

执业西药师辅导:药剂学考试重点总结(十三) PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/235/2021_2022__E6_89_A7_E4_B8_9A_E8_A5_BF_E8_c23_235957.htm

第13章 经皮吸收制剂

一、概述 1、经皮吸收制剂的概念与特点 1) 概念：将制剂应用于皮肤上，其中的药物透过角质层，进入真皮和皮下脂肪，由毛细血管和淋巴管吸收进入体循环、产生全身治疗作用的过程称为经皮吸收或透皮吸收。常称为透皮治疗系统

(Transdermal therapeutic systems , 简称TTS)。

2) 经皮吸收制剂具有以下优点： 可避免肝脏的首过效应和胃肠道对药物的降解，以及胃肠道给药时的副作用； 可以减少给药次数：

可以维持恒定的血药浓度，避免口服给药引起的峰谷现象，降低毒副作用； 使用方便，可随时给药或中断给药。

2、TTS的基本组成 (1) 背衬层：可防止药物流失和潮解。

(2) 药物储库：其组成有：药物、高分子基质材料、透皮促进剂等。(3) 控释膜：成膜材料与致孔剂组成的微孔膜。

(4) 粘附层：粘合剂等组成。(5) 保护层：附加的塑料保护薄膜。

二、TTS的类型 (目前在生产及临床应用的)

1) 膜控释型 2) 复合膜型 3) 黏胶分散型 4) 聚合物骨架型 5) 微储库型

三、药物的经皮吸收 1、药物的经皮吸收过程与途径

1) .药物的经皮吸收过程：主要包括释放、穿透及吸收进入血液循环三个阶段。 2) .药物经皮吸收的途径：一是表皮途径，药物透过完整表皮进入真皮和皮下脂肪组织，被毛细血管和淋巴管吸收进入体循环，这是药物经皮吸收的主要途径。

二是皮肤附属器途径，药物通过皮肤附属器吸收要比表皮途径快。

2、影响药物经皮吸收的因素 1) 药物性质

2) 影响药物经皮吸收的因素

的影响 1. 药物的溶解性与油/水分配系数 (K) : 即能油溶又能水溶的药物 (即K值适中者) 具有较高的穿透性, 油溶性很大的药物可能会聚集、滞留在角质层而难被进一步吸收。

2. 药物的分子量: 药物吸收速率与分子量成反比。 3. 药物的熔点: 低熔点的药物容易渗透通过皮肤。 4. 药物在基质中的状态影响其吸收量: 溶液态药物>混悬态药物, 微粉>细粒。

2) 基质性质的影响: 基质对药物的释放性能影响很大, 药物从基质中越容易释放, 则越有利于药物的经皮渗透。 1. 基质的特性与亲和力: 不同基质中药物的吸收速度 乳剂型>动物油脂>羊毛脂>植物油>烃类。水溶性基质需视其与药物的亲和力而定, 亲和力越大, 越难释放。 2. 基质的pH: 能使药物分子型 (非解离型) 增多pH, 有利于药物的经皮吸收。 3. 基质对皮肤水合作用的影响: 它是影响药物穿透皮肤的主要因素。一般油脂性基质特别是烃类基质的封闭性最强, 可引起较强的水合作用, 故而可增加药物的透皮吸收; W/O型乳剂基质次之; O/W型乳剂基质再次之; 水溶性基质如聚乙二醇1500没有阻止水分蒸发的作用。 3) .透皮吸收促进剂的影响: 透皮吸收促进剂是指那些能加速药物穿透皮肤的物质。

1. 二甲基亚砷及其同系物。 2. 氮酮类化合物: 月桂氮酮 (Azone 用量1%~10%) 的透皮促进作用很强。 3. 醇类化合物 丙二醇、甘油及聚乙二醇等多元醇单独应用时, 促渗效果不佳。往往与其他透皮促进剂合用。 4. 表面活性剂可增溶药物, 增加皮肤的润湿性。 5. 其他透皮促进剂、尿素、挥发油和氨基酸等。

4) .皮肤因素的影响: 皮肤的渗透性是影响药物透皮吸收的重要因素。不同部位的皮肤药物透皮吸收的情况不同。

4、TTS的常用材料 1) 控释膜材料: 经皮吸收制剂

的控释膜分为均质膜与微孔膜。（1）均质膜的高分子材料：乙烯-乙酸乙烯共聚物（EVA），（2）控释膜中的微孔膜：通过聚丙烯拉伸而得，也有用醋酸纤维膜的。2）骨架材料。（1）. 聚合物骨架材料：聚乙烯醇（PVA）：醇解度在80%左右的水溶性最好，在冷热水中均能溶解。（2）微孔材料：几乎所有的合成高分子材料均可作微孔骨架材料，应用较多的是醋酸纤维素。3）压敏胶：其作用是使制剂与皮肤紧密粘贴，有时又作为药物的储库或载体材料，用以调节药物的释放速度。4）其它材料（1）背衬材料：系用于支持药库或压敏胶等的薄膜。（2）保护膜材料：常用的有聚乙烯、聚丙烯、聚碳酸酯、聚四氟乙烯等塑料薄膜。（3）药库材料：可以用单一材料，也可用多种材料配制的软膏、凝胶或溶液，如卡波姆、HPMC、PVA等。转贴于：100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com