

冲刺预测班

中 药 学 专 业 知 识 （ 一 ）

国 家 执 业 药 师 资 格 考 试

主讲老师：姜 雅

2019

» 第十一节 丸 剂

2017年1A+2C； 2016—3B+1X； 2015—1A+3B+1C； 2018-1C

1	丸剂的特点和分类	☆☆
2	蜂蜜的炼制和等级	☆☆☆☆
3	糊丸和蜡丸的特点	☆☆☆☆☆
4	滴丸的特点和基质	☆☆☆☆
5	丸剂含水量	☆☆☆☆☆
6	丸剂的溶散时限	☆☆☆☆☆
7	丸剂的包衣	☆☆☆☆

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

一、丸剂的特点与分类

1. 特点

- ①传统：缓释、长效（慢性病、调和气血）；
- ②新型：滴丸速释（难溶+水基=速释，急症）；
- ③糊、蜡丸：降低毒性和不良反应，适于毒刺激长效；
- ④适用范围广：固体、半固体、黏稠性液体；
- ⑤提高药物稳定性，减少刺激性；
- ⑥制法简便，小量、大生产；
- ⑦某些剂量大，服用不便，尤其是儿童；
- ⑧易致溶散迟缓、微生物易超标。

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

2. 分类：按制法分类：

(1) 泛制丸：水丸及部分水蜜丸、浓缩丸、糊丸等。

(2) 塑制丸：蜜丸及部分糊丸、浓缩丸等

(3) 滴制丸（滴丸）：滴制法

泛制丸	水丸及部分水蜜丸、浓缩丸、糊丸
塑制丸	蜜丸及部分糊丸、浓缩丸
滴制丸（滴丸）	滴制法

备注：胶囊剂—滴制法和压制法

2019

5073

>> 第十一节 丸 剂

二、蜜丸的炼蜜问题

1. 蜂蜜的炼制

目的：除去杂质、破坏酶类、杀灭微生物、降低水分含量、增加黏性

炼蜜规格	嫩蜜	中蜜	老蜜
炼制程度	色泽无变化， 稍黏	黄色、鱼眼泡、 黏性、无长白 丝	红棕色、牛眼泡、 黏性强、打白丝、 滴水成珠
适用药粉	黏性强：黏液 质、胶质、糖、 淀粉、油脂、 动物组织	黏性中等，大 部分蜜丸所采 用	粘性差：矿物药、 富含纤维

» 第十一节 丸 剂

【B型题】

- A. 嫩蜜
 - B. 中蜜
 - C. 老蜜
 - D. 蜜水
 - E. 生蜜
1. 适用于含淀粉、黏液质、胶质、糖类及脂肪较多的药物
 2. 用于黏性差的矿物药或富含纤维的药粉制丸

【答案】： A C

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

三、糊丸和蜡丸的特点

类型	特点	适用药物
糊丸	溶散迟缓、释药缓慢，可延长药效，“取其迟化”	含毒性饮片或刺激性饮片以及需延缓药效的方药
	减少药物对胃肠的刺激性	
蜡丸	基本不溶散	

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

四、滴丸的特点和基质

特 点	优点	奏效迅速，适用于急症治疗； 剂量准确 生产设备简单，自动化程度高，成本较低
	缺点	载药量较小，理想基质和冷凝剂较少
基 质	类型	特点
	水溶性	聚乙二醇、硬脂酸钠、聚氧乙烯单硬脂酸酯（S-40）、泊洛沙姆、甘油明胶
	非水溶性	硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、虫蜡、蜂蜡、十八醇、氢化植物油

» 第十一节 丸 剂

【A型题】

滴丸制备中常用的水溶性基质为

- A. 聚乙二醇4000
- B. 单硬脂酸甘油酯
- C. 氢化油
- D. 硬脂酸
- E. 甘油

【答案】： A

2019

5073

》 第十一节 丸 剂

五、丸剂的含水量 ☆☆☆☆☆

蜜丸和浓缩蜜丸	$\leq 15.0\%$
水蜜丸和浓缩水蜜丸	$\leq 12.0\%$
水丸、糊丸和浓缩水丸	$\leq 9.0\%$
蜡丸、滴丸不检查水分	
从蜜到水含水少，1512降到9，蜡丸滴丸无水分	

2019
5073

» 第十一节 丸 剂

【2016年，X型题】

119. 除另有规定外，不需要检查水分的丸剂有

- A. 糊丸
- B. 滴丸
- C. 蜜丸
- D. 蜡丸
- E. 浓缩丸

【答案】：BD

2019
5073

» 第十一节 丸 剂

六. 溶散时限

小蜜丸、水蜜丸和水丸	1 h内
浓缩丸和糊丸	2 h时内
滴丸	30 min内
包衣滴丸	1 h内
蜡丸	2 h×, 1 h√
大蜜丸，大蜜丸及研碎、嚼碎后或用开水、黄酒等分散后服用的： 不检查	
记忆方法： 滴丸速效散的快：滴丸-三十；小水蜜穿了衣（1）；浓缩成糊就犯二（2）	

» 第十一节 丸 剂

【2017年，A型题】

24. 除另有规定外，不需要检查溶散时限的丸剂是

A. 水丸

B. 糊丸

C. 滴丸

D. 浓缩丸

E. 大蜜丸

【答案】：E

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

七、丸剂的包衣

药物衣	A 朱砂衣（镇静、安神、补心类药物常用） B 黄柏衣（利湿、渗水、清下焦湿热的药物常用） C 雄黄衣（解毒、杀虫类药物常用） D 青黛衣（清热解毒类药物常用） E 百草霜衣（清热解毒类药物常用）
保护衣	薄膜衣；糖衣；有色糖衣；明胶衣。
肠溶衣	丙烯酸树脂I号、II号、III号邻苯二甲酸醋酸纤维素

» 第十一节 丸 剂

【2017年，C型题】

（一）补脾益肠丸为双层水蜜丸。药物组成：外层：辅料、党参（米炒）、砂仁、白药、当归（上炒）、白术（土炒）、肉桂；内层：延胡索（制）、荔枝核、炮姜、甘草（炙）、防风、防风、木香、盐补骨脂、煅赤石脂。辅料为：聚丙烯酸树脂I、炼蜜、滑石粉、蓖麻油、乙醇、淀粉、药用炭、虫白蜡。

制法：处方中饮片15味

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

101. 该制剂处方中辅料聚丙烯酸树脂 II 是用作

- A. 包药物衣
- B. 包糖衣
- C. 包缓释衣
- D. 包肠溶衣
- E. 包控释衣

【答案】：D

2019

5073

» 第十一节 丸 剂

【X型题】

下列丸剂的包衣材料中属于保护衣的是

- A. 肠溶衣
- B. 有色糖衣
- C. 明胶衣
- D. 薄膜衣
- E. 朱砂衣

【答案】：BCD

2019
5073

» 第十二节 颗粒剂

2017 1A

丸剂 的质 量要 求	水分 $\leq 8.0\%$
	粒度：不能通过1号筛与能通过5号筛 $\leq 15.0\%$
	溶出度：混悬颗粒剂
	释放度：缓释颗粒、控释颗粒、肠溶颗粒
	溶化性：可溶性颗粒，5分钟全部溶化；泡腾颗粒：产生气体而成泡腾状，5分钟内颗粒均应完全分散或溶解在水中
	残留溶剂：包衣颗粒

» 第十二节 颗粒剂

【A型题】

现行药典规定颗粒剂水分含量限度为

- A. $\leq 6.0\%$
- B. $\leq 5.0\%$
- C. $\leq 8.0\%$
- D. $\leq 9.0\%$
- E. 无规定

【答案】：C

2019
5073

» 第十二节 颗粒剂

25. 除另有规定外，不需要应检查溶出度的颗粒剂是

- A. 肠溶颗粒
- B. 缓释颗粒
- C. 控释颗粒
- D. 泡腾颗粒
- E. 混悬颗粒

【答案】： ABCD

2019
5073

» 第十三节 片剂

2015年没有考！ 2016-1A+3B, 2017年1A+1X; 2018: 1C

1	分类	☆☆☆
2	片剂的辅料	☆☆☆☆☆
3	质量要求之崩解 时限	☆☆☆☆☆

2019
5072

» 第十三节 片剂

一、片剂的分类

第一类：口服片：口服普通片、咀嚼片、分散片（遇水能迅速崩解且均匀分散的片剂）、可溶片（可供口服、外用、含漱等用）、缓释片、控释片、肠溶片、口崩片

第二类：口腔用片

1. 含片（局部）

2. 舌下片（全身）：舌下黏膜直接吸收，吸收迅速显效快，可避免胃肠液对药物的不利影响和肝脏的首过作用

3. 含漱片

第三类：外用的

2019

5073

» 第十三节 片剂

【A型题】

1. 通过黏膜吸收而呈现全身治疗作用的片剂剂型为
- A. 咀嚼片
 - B. 多层片
 - C. 泡腾片
 - D. 舌下片
 - E. 分散片

【答案】：D

2019
5073

» 第十三节 片剂

【X型题】

2. 属于口服片剂的有

- A. 咀嚼片
- B. 舌下片
- C. 分散片
- D. 泡腾片
- E. 口腔贴片

【答案】： ACD

2019
5072

第十三节 片剂

二、片剂的辅料：四大金刚

(一) 填充剂	稀释剂	适用于主药剂量小于0.1g，或含浸膏量多，或浸膏黏性太大而制片困难者
	吸收剂	适用于原料药中含有较多挥发油、脂肪油或其他液体，而需制片者
	淀粉、预胶化淀粉、糖粉、乳糖、糊精、甘露醇、微晶纤维素、微粉硅胶、硫酸钙二水物、磷酸氢钙（吸收剂）、氧化镁、碳酸钙、碳酸镁。 记忆技巧：二粉二糖成糊精，微晶无机甘露醇。稀释填充都能行	

» 第十三节 片剂

(二) 润湿剂与黏合剂

1. 水：一般用制药用水（蒸馏水、去离子水）
2. 乙醇：常用浓度为30%~70%或更高。

润湿剂：水+乙醇		
粘 合 剂	看着就 很“黏”	淀粉浆（糊）：最常用的 糖浆；液状葡萄糖、饴糖、炼蜜 胶浆类：阿拉伯胶、明胶
	带“纤维”和 “聚”	聚维酮（PVP） 纤维素衍生物：微晶纤维素，羧甲基纤维素钠 CMC-NA. 羟丙基甲基纤维素（HPMC）、低取代羟 丙基纤维素（L-HPC），乙基纤维素（EC）

» 第十三节 片剂

（三）、崩解剂

口含片、舌下片、缓释片、咀嚼片、中药半浸膏片可以不加

种类	干燥淀粉；羧甲基淀粉钠(CMS—Na)；低取代羟丙基纤维素(L—HPC)；交联聚维酮(交联PVPP)；泡腾崩解剂：碳酸氢钠(或碳酸钠)与有机酸(枸橼酸或酒石酸等)；崩解辅助剂
----	---

记忆方法：崩解淀粉羧淀粉钠，低代交联小苏打

2019

5073

» 第十三节 片剂

（四）润滑剂

压片前必须加入的能增加颗粒（或粉末）流动性，减少颗粒（或粉末）与冲模内摩擦力

种类	① 硬脂酸镁、硬脂酸、硬脂酸锌和硬脂酸钙
	② 滑石粉
	③ PEG（聚乙二醇）
	④ 月桂醇硫酸镁（钠）（十二烷基硫酸镁）
	⑤ 微粉硅胶

记忆方法：微距十二青花美

» 第十三节 片剂

【2016年，B型题】

[71~73]

- A. 润滑剂
- B. 湿润剂
- C. 黏合剂
- D. 崩解剂
- E. 吸收剂

71. 片剂制备过程中，辅料淀粉浆用作

72. 片剂制备过程中，辅料硬脂酸镁用作

73. 片剂制备过程中，辅料碳酸氢钠用作

【答案】：C A D

2019

5073

» 第十三节 片剂

三、片剂的崩解度

片剂类型	崩解时间 (min)
口崩片	1
可溶片	3
舌下片、泡腾片	5
含片	10不能
普通片	15
药材原粉片	30
浸膏（半浸膏）片，糖衣片	60
薄膜衣片	30（化）、60（中）
阴道片	融变时限 30

2019

5073

第十三节 片剂

续表

片剂类型	崩解时间 (min)
阴道片	融变时限 (泡腾片, 发泡量)
肠溶衣片	盐酸溶液中2小时内不崩解, 在pH6. 8磷酸盐缓冲液中1小时内全部崩解
不检查的: 咀嚼片、冷冻干燥法制备的口崩片、检查溶出度、释放度的药物	

记忆方法:

崩1溶3舌泡5; 素颜一刻钟 穿衣半小时
中药薄糖衣; 进肠一小时

2019

» 第十三节 片剂

总结

质量检查项目	散剂	颗粒剂	胶囊剂	片剂	丸剂
粒度	√	√			
水分	√	√	√		√
崩解时限/融变时限			√	√	
溶散时限					√
溶出度/释放度		√	√	√	
重量差异/装量差异	√	√	√	√	√
溶化性		√			
无菌	√				
硬度、脆碎度、发泡量				√	

» 第十三节 片剂

【2017年，X型题】

117. 除另有规定外，应检查崩解时限的片剂有

- A. 肠溶片
- B. 可溶片
- C. 缓释片
- D. 舌下片
- E. 咀嚼片

【答案】： ABD

2019
5072

感谢观看

请继续关注，精彩课程内容待续……

2019

5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

2015年无，2016—1A+3B，2017年1X；2018年1A+4B

1	气雾剂的特点	☆☆☆☆☆
2	吸入气雾剂的吸收与影响因素	☆☆☆☆
3	气雾剂的附加剂	☆☆☆☆
4	气雾剂的质量要求	☆☆☆☆☆
5	气雾剂的分类	☆☆☆

2019
5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

一、气雾剂、喷雾剂总结

	气雾剂	喷雾剂
内容物	二相：溶液；三相：混悬液、乳液	溶液、混悬液、乳液
抛射剂	喷射动力，兼溶剂、稀释剂	无
药物释放方式	耐压容器+特制阀门抛射剂喷射	手动泵压力、高压气体
给药途径	吸入：肺部（雾滴粒径 $5\mu\text{m}$ – $10\mu\text{m}$ ）非吸入：腔道、黏膜、皮肤、空间消毒	

第十四节 气雾剂与喷雾剂

【B型题】

- A. 混悬型气雾剂
- B. 吸入粉雾剂
- C. 溶液型气雾剂
- D. 泡沫剂
- E. 喷雾剂

- 1. 二相气雾剂是
- 2. 借助于手动泵的压力将药液喷成雾状的制剂是
- 3. 采用特制的干粉吸入装置，由患者主动吸入雾化药物的制剂

是

【答案】：C E B

第十四节 气雾剂与喷雾剂

二、吸入气雾剂的吸收与影响因素

	气雾剂	喷雾剂
1	药物的脂溶性	成正比
2	分子大小	成反比
3	雾滴（粒）粒径	适当（在10 μm 以下，其中大多数应在5 μm 以下）

2019
5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

历年考点：影响气雾剂吸收的因素

【A型题】

吸入气雾剂能否到达肺泡主要取决于

- A. 雾化粒径大小
- B. 药物分子大小
- C. 药物脂溶性
- D. 抛射剂的种类
- E. 气雾剂抛射压力

【答案】：A

2019

5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

三、气雾剂的组成

药物			
附加剂	溶剂		抛射剂（可溶脂溶性）、水、甘油或脂肪酸、植物油
	助溶剂		乙醇、丙二醇
	抗氧化剂		维生素C、亚硫酸钠
	防腐剂		尼泊金乙酯
	表面活性剂	乳化剂	如硬脂酸三乙醇胺皂、聚山梨酯类
		助悬剂	司盘类、月桂醇等

第十四节 气雾剂与喷雾剂

续表

抛射剂	适宜低沸点液化气体，抛射剂是喷射药物动力，兼作溶剂和稀释剂	
	氢氟烷烃类	四氟乙烷（HFA-134a）、七氟丙烷（HFA-227ea）。替代氟氯烷烃类（氟利昂，现已禁用）最佳抛射剂
	二甲醚	可燃，美国FDA尚未批准用于吸入气雾剂
	碳氢化合物	丙烷、正丁烷，易燃、易爆，不宜单独使用
	惰性气体	
耐压容器		
阀门系统		①普通阀门；②定量阀门

第十四节 气雾剂与喷雾剂

【B型题】

- A. 金属离子络合剂
 - B. 乳化剂
 - C. 抛射剂
 - D. 抗氧剂
 - E. 矫味剂
1. 亚硫酸钠作为偏碱性中药注射液的
 2. 乙二胺四乙酸二钠可作为中药注射液的
 3. 硬脂酸三乙醇胺皂可作为气雾剂的

【答案】：D A B

2019

5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

2018B[69~71]

- A. 乳化剂
- B. 溶剂
- C. 抗氧剂
- D. 助溶剂
- E. 助悬剂

69. 聚山梨酯80可用作气雾剂的

70. 月桂醇可用作气雾剂的

71. 四氟乙烷可用作气雾剂的

【答案】： AEB

2019

5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

四、气雾剂、喷雾剂的质量检查项目

1. 定量气雾剂--每瓶总揿次，递送剂量均一性，每揿主药含量，每揿喷量
2. 多剂量定量喷雾剂--每瓶总喷次
3. 供雾化器用的吸入喷雾剂--递送速率和递送总量
4. 定量喷雾剂--每喷主药含量，每喷喷量
5. 吸入气雾剂--微细粒子剂量
6. 非定量气雾剂--喷射速率，喷出总量
7. 凡规定检查递送剂量均一性的单剂量喷雾剂，一般不再进行装量差异的检查。

2019

5073

第十四节 气雾剂与喷雾剂

【2017年，X型题】

119. 关于气雾剂，喷雾剂质量检查项目的说法，正确的是

- A. 定量气雾剂应检查每瓶主药含量
- B. 非定量气雾剂应检查每瓶总喷次
- C. 定量气雾剂应检查每喷主药含量
- D. 非定量气雾剂应检查每瓶的喷射速率
- E. 定量气雾剂应检查递送剂量均一性

【答案】： CDE

2019

5073

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

2015年无 2016 2B, 2017年1A

1	胶剂（辅料问题）	☆☆☆☆☆
2	膜剂和涂膜剂	☆☆☆☆
3	其他传统剂型	☆☆☆☆

2019
5073

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

一、胶剂辅料

辅 料	作用
冰 糖	增加胶剂透明度和硬度，矫味
植物油	降低黏度，便于切胶；消泡
酒 类	矫味、矫臭，利于气泡逸散
明 矾	沉淀胶液中的泥沙及杂质

2019
5073

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

【B型题】

- A. 冰糖
 - B. 麻油
 - C. 黄酒
 - D. 明矾
 - E. 碳酸钠
1. 可增加胶剂透明度和硬度的辅料是
 2. 具消泡作用，且可降低胶块黏度，便于切胶的辅料是
 3. 起矫味作用，收胶时有利于气泡逸散的辅料是
 4. 可沉淀胶液中泥砂等杂质的辅料是

【答案】： A B C D

2019

5073

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

二、膜剂和涂膜剂

成膜材料	天然：淀粉、纤维素、明胶	成膜性、脱膜性好，制成的膜具韧性
	合成：纤维素衍生物、PVA（最常用）	
其他辅料	增塑剂：甘油、乙二醇、山梨醇	
	着色剂：食用色素	
	遮光剂：二氧化钛	
	矫味剂：蔗糖、甜菊苷	
	填充剂：碳酸钙、淀粉	
	表面活性剂：聚山梨酯80、十二烷基硫酸钠、豆磷脂	

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

【A型题】

2. 可作为涂膜剂溶剂的是

- A. 乙醇
- B. 丙三醇
- C. 三氯甲烷
- D. 聚乙二醇
- E. 邻苯二甲酸二丁酯

【答案】：A

2019

5073

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

三、其他传统剂型

锭剂	不同形状。内服、外用，嗅入或外搽
灸剂	艾叶等供熏灼穴位或其他患部的外用制剂
线剂	丝线或棉线，外用治疗痔疮
熨剂	锻制铁砂混合制成的外用制剂。拌醋生热
糕剂	细粉与米粉、蔗糖等蒸制。治疗小儿脾胃虚弱等
丹剂	含有汞。丹剂毒性较大，供外用。
条剂	桑皮纸粘药膏后搓捻成细条，外用制剂
钉剂	搓成细长而两端尖锐的外用制剂
棒剂	多用于眼科

第十五节胶剂、膜剂、涂膜剂及其他传统剂型

【B型题】

- A. 锭剂
 - B. 棒剂
 - C. 条剂
 - D. 灸剂
 - E. 膜剂
1. 既可内服也可吸入或外搽应用的剂型为
 2. 多外用于眼科的是
 3. 既可内服又可眼用的剂型为

【答案】：A B E

2019

5073

感谢观看

请继续关注，精彩内容待续……

2019

5073

第十六节 新型给药系统与制剂

2018:1A+2B+1C; 2017年3B; 2016--1A+3B 2015—1A

1	缓释、控释制剂特点	☆☆☆☆
2	缓释、控释制剂的类型	☆☆☆
3	靶向制剂的分类	☆☆☆☆
4	中药制剂新技术	☆☆☆

2019
5073

» 第十六节 新型给药系统与制剂

一、缓释、控释制剂特点

- ①缓释，作用持久；
- ②用药次数显著减少；
- ③增加患者用药的顺应性；
- ④缓释制剂释药先多后少，控释制剂恒速零级释药，血药浓度的“峰谷”波动小，保持疗效，减少毒副作用。

2019

5073

第十六节 新型给药系统与制剂

不宜制成缓释、控释制剂的药物：

- ① 生物半衰期($t_{1/2}$)很短(小于1 h)或很长(大于24 h)的药物。
- ② 单服剂量很大(大于1g)的药物。
- ③ 药效剧烈、溶解度小、吸收无规律、吸收差或吸收易受影响的药物
- ④ 需在肠道中特定部位主动吸收的药物

记忆技巧：

半长半短不合适；量大溶小不合适；药效剧烈不合适

吸收麻烦不合适；肠中特定不合适

2019

5073

第十六节 新型给药系统与制剂

二、缓释、控释制剂的类型

1	骨架型	扩散、溶蚀作用或扩散与溶蚀共同作用
2	膜控包衣型	控制包衣膜的厚度、膜孔的孔径及其弯曲度
3	乳剂分散型	油相对药物分子的扩散具的屏障作用
4	注射用	油溶液型或混悬液型中药物体液中分配或溶解的延缓作用
5	缓释膜剂	多聚物膜对药物的释放具有延缓作用
6	渗透泵式	渗透压，释药速度与pH无关
7	胃滞留型	提高药物在胃及十二指肠部位的局部治疗

» 第十六节 新型给药系统与制剂

【2016年，B型题】

[79~81]

- A. 膜控包衣型
- B. 渗透泵型
- C. 乳剂分散型
- D. 注射混悬液型
- E. 骨架分散型

79. 药物通过扩散、溶蚀作用而缓释的是

80. 释药速度与胃肠pH无关的是

81. 借助油相对药物分子的扩散产生屏障作用而缓释的是

【答案】：E B C

2019

5073

➤ 第十六节 新型给药系统与制剂

三、靶向制剂

(1) 按靶向作用方式

1	被动靶向制剂	微囊，微球，脂质体
2	主动靶向制剂	修饰的药物载体：修饰的（脂质体、微球、微乳、纳米球）
		前体药物靶向制剂
3	物理化学靶向制剂	磁性制剂，栓塞靶向制，热敏靶向制剂 pH敏感靶向制剂
记忆方法：被动：微囊微球脂质体；主动：修饰之后变前体 物理化学：磁性栓塞热敏感		

» 第十六节 新型给药系统与制剂

续表

1	被动靶向制剂	在体内的分布首先取决于粒径的大小
2	修饰的脂质体	长循环脂质体；延长在体内循环时间
		免疫脂质体：接上某种抗体，具有对靶细胞分子水平上的识别能力

2019

5073

第十六节 新型给药系统与制剂

(2) . 根据靶向制剂释药情况（到达部位不同）

一级靶向制剂	到达特定的靶部位-毛细血管床
二级靶向制剂	到达特定的细胞-肿瘤细胞
三级靶向制剂	到达细胞内的特定靶点

2019
5073

» 第十六节 新型给药系统与制剂

【2016年，A型题】

27. 根据《中国药典》微粒制剂指导靶向制剂的分类，二级靶向制剂可使药物定向作用于

- A. 靶气管
- B. 靶组织
- C. 靶细胞
- D. 靶细胞器
- E. 靶细胞核

【答案】：C

2019

5073

第十六节 新型给药系统与制剂

四、中药制剂新技术

环糊精包合技术	定义	药物分子包藏于环糊精分子空穴结构内
	特点	<ul style="list-style-type: none">① 能够提高药物的稳定性② 增加药物的溶解度③ 减少药物的刺激性④ 调节药物的释放速度⑤ 同时能够使液体药物粉末化而便于制剂⑥ 没有提到靶向性
微型包囊技术	定义	微小胶囊的过程，微囊化
	特点	提高稳定性，掩盖不良嗅味，降低在胃肠道中的副作用，减少复方配伍禁忌，延缓或控制药物释放，改进某些药物的物理特性，将液体药物制成固体制剂。没有提到靶向性

第十六节 新型给药系统与制剂

续表

固体分散技术	定义	药物与载体混合制成的高度分散的固体分散物
	特点	<div><div>① 达到不同的释药目的：提高药物的生物利用度；缓释控释肠溶</div><div>② 延缓药物的水解和氧化</div><div>③ 掩盖药物的不良气味和刺激性。</div><div>④ 使液体药物固体化</div><div>⑤ 久贮可能出现药物晶型改变、重结晶、结晶粗化和药物溶出度降低等老化现象</div><div>⑥ 没有提到靶向性</div></div>
	类型	<div><div>①低共熔混合物（药物微晶状态）</div><div>②固态溶液（药物分子状态）</div><div>③玻璃溶液或玻璃混悬液（质脆透明状固体溶液或混悬液）</div><div>④共沉淀物（药物与载体形成非结晶性无定形物）</div></div>

» 第十六节 新型给药系统与制剂

- A. 固态溶液
- B. 共沉淀物
- C. 固态凝胶
- D. 低共熔混合物
- E. 微细结晶形式

下列固体分散物的类型分别是

1. 固体药物与载体以适当比例形成的非结晶性无定形物
2. 药物以分子状态溶解在固体载体中形成均相体系，药物溶出速度高
3. 药物与载体共熔成完全混溶的液体，搅拌均匀，迅速冷却固化而成为分散体，药物以微晶形式分散于载体中成为物理混合物

【答案】：B A D

» 第十七节 药物体内过程

2018:1A; 2017-1A+3B; 2016-1A; 2015-1X

1	药药物的体内过程及其影响因素	☆☆☆☆
2	影响吸收的因素	☆☆☆
3	影响分布的因素	☆☆☆
4	代谢动力学的基本术语	☆☆☆☆

2019
5073

» 第十七节 药物体内过程

一、药物的体内过程

四个过程

吸收	从用药部位进入体循环的过程；血管内给药没有吸收过程。口服药物的吸收部位主要是胃肠道
分布	药物吸收后，由循环系统运送至体内各脏器组织的过程
代谢	药物在体内发生化学结构改变的过程，主要在肝脏
排泄	体内的药物及其代谢产物从各种途径排出体外的过程；主要是通过肾脏，其次是胆汁等

第十七节 药物体内过程

二：影响吸收的因素

生理因素	①胃肠液的成分和性质；②胃排空速率 ③其他
药物因素	①药物的脂溶性和解离度：通常脂溶性大的药物和未解离的分子型药物易于透过细胞膜 ②药物的溶出速度
剂型因素	①固体制剂的崩解与溶出 ②剂型：静脉>吸入>肌肉>皮下>舌下或直肠>口服>皮肤；口服制剂：溶液剂>混悬剂>胶囊剂>片剂>包衣片。 ③制剂处方及其制备工艺

» 第十七节 药物体内过程

三：影响分布的因素

药物与血浆蛋白结合的能力	游离型可自由转运，可逆，具有饱和现象，合并用药竞争结合出现用药安全性问题
血液循环和血管透过性	血流量大，血管通透性好的组织器官，则药物分布速度快
药物与组织的亲和力	蓄积在靶组织或靶器官，可达到满意的疗效；蓄积在脂肪等，延长作用时间；蓄积的药物毒性较大，对机体造成伤害
血脑屏障与血胎屏障	随着胎儿的长大，药物的通透性增加

» 第十七节 药物体内过程

【2016年，A型题】

28. 同一种药物制成的口服制剂，药物吸收速度最快的剂型是

- A. 散剂
- B. 片剂
- C. 胶囊剂
- D. 溶液剂
- E. 混悬剂

【答案】：D

2019

5073

第十七节 药物体内过程

四、药物动力学基本概念

1：药物转运的速度过程

一级速度过程	转运速度与该部位的药量或血药浓度的一次方成正比（ 药物在常规剂量下 ）
零级速度过程	转运速度在任何时间都是 恒定的 （ 恒速静脉滴注+控释制剂 ）
受酶活力限制的速度过程	

2019

» 第十七节 药物体内过程

2. 隔室模型

单室模型	可把整个机体看作一个单一的隔室
双室模型	药物进入机体后，能够很快分布进入机体的某些部位，但对另外一些部位则需要一段时间才能完成分布

2019
5073

第十七节 药物体内过程

3. 常用的药物动力学参数

参数	定义	单位
速率常数 (K)	药物转运 (消除) 速度	
生物半衰期 ($t_{1/2}$)	体内药量或血药浓度消除一半所需要的时间	min, h
表观分布容积 (V)	体内药量与血药浓度间关系的一个比例常数	“L” 或 “L/kg”
体内总清除率 (TBCL, CI)	单位时间内从机体或器官能清除掉相当于多少体积的体液中的药物	体积·时间 ⁻¹

第十七节 药物体内过程

续表

参数	定义	表示方法
生物利用度	药物吸收进入血液循环的 程度与速度	$AUC + C_{max} + t_{max}$
	生物利用 程度 （EBA）：药物进入血液循环的 多少	血药浓度—时间曲线下的面积（AUC）
	生物利用 速度 （RBA）：药物进入体循环的 快慢	峰浓度（ C_{max} ）和达峰时间（ t_{max} ）

第十七节 药物体内过程

续表

参数+	定义	表示方法
相对生物利用度	试验制剂与参比制剂的血药浓度一时间曲线下面积的比率	$F = \frac{AUC_T}{AUC_R} \times 100\%$
绝对生物利用度	参比制剂是静脉注射剂时，则得到的比率为绝对生物利用度	$F = \frac{AUC_T}{AUC_{iv}} \times 100\%$
生物等效性	相同活性物质的两种药品药剂学等效或可替代，相同摩尔剂量下给药后，生物利用度落在预定的可接受限度内，相似的安全性和有效性	AUC、C _{max}

第十七节 药物体内过程

【B型题】

- A. 生物利用度
- B. 绝对生物利用度
- C. 相对生物利用度
- D. 生物等效性
- E. 生物半衰期

1. 试验制剂与参比制剂血药浓度一时间曲线下面积的比值，称为
2. 试验制剂与其静脉给药参比制剂的血药浓度一时间曲线下面积的比值，称为
3. 药物体内血药浓度消除一半所需要的时间

【答案】：C B E

第十七节 药物体内过程

【X型题】

用于评价制剂生物等效性的药物动力学参数有

- A. 生物半衰期($t_{1/2}$)
- B. 清除率 Cl
- C. 血药峰浓度 (C_{max})
- D. 表观分布容积 (V)
- E. 血药浓度-时间曲线下面积 (AUC)

【答案】：CE

2019
5073

第十七节 药物体内过程

【2017年，B型题】

- A. 速率常数
- B. 表观分布容积
- C. 相对生物利用度
- D. 稳态血药浓度
- E. 绝对生物利用度

79. 体内药量与血药浓度的比值为

80. 描述药物转运（消除）快慢的动力学参数是

81. 实验与参比制剂血药浓度-时间曲线下面积的比例是

【答案】：B A C

2019

5073

感谢观看

请继续关注，精彩内容待续……

2019

5073