

浅谈新型注射给药系统的研究进展

庞天宇

(辽宁广播电视大学, 辽宁装备制造职业技术学院, 辽宁 沈阳 110000)

摘要: 在药物制剂技术不断发展的前提下, 脂质体、微乳、纳米粒以及原液凝胶等新型注射给药系统, 已经成为药剂学领域各大学者研究的重点。在医学过程中应用以上给药系统, 可以降低注射的次数, 将患者可能出现的不良反应有效降低。本文结合当前形势, 对不同类型的新型注射给药系统或是正处于临床试验的产品研发、遇到的问题以及具体应用等进行研究, 以供参考。

关键词: 新型注射; 给药系统; 研究进展

近些年以来, 新型注射给药系统在临床上应用越来越多, 由于其注射的次数能够有效降低, 疗效方面更佳, 且患者的不良反应明显减少等优势, 越来越多人的青睐和关注。根据相关部门的统计, 从2008年至2013年六年间, 经美国FDA批准, 允许上市的缓、控释剂大部分都是口服制剂, 非口服制剂只有四种。口服缓与控释制剂的生物利用程度会受到胃肠道环境和首过效应的影响, 并且缓释的时间相对较短。针对类似胰岛素类型胃肠道内稳定性差、需要长期给药的药物来说, 通常制作为注射型缓、控释剂更好, 以此能够延长临床治疗的时间, 效果也更佳。现阶段, 在新型制剂技术不断发展的情况系, 诸如脂质体、微球、纳米粒等给药系统的新型注射液, 在现在的药物新剂型研究当中已经占据重要地位, 未来有更加广阔的发展前景。

一、脂质体给药系统分析

脂质体的主要成分为磷脂与其它两亲性物质, 在水中分散后, 将药物包裹在一层或是多层同心脂质双分子夹层中的微型泡囊当中。脂质体通常为治疗肿瘤、疫苗或是合算类药物的媒介。其可能会存留在人体的注射位置, 也可能被相应的器官所摄取。同时, 其也会在脂质体不断降解的过程中, 慢慢的释放出药物。现在, 用于治疗不同疾病的脂质体产品已经被批准可以上市。

二、微乳给药系统分析

微乳的主要组成部分包括乳化剂、油相、助乳化剂以及水相, 粒径大部分在10-100nm之间, 其具有热力学稳定的优点, 不仅毒性较小, 且药物的溶解度和稳定性都相对较高。助乳化剂的成分加入则能够将此其中油、水两相间表面的张力。所以, 只要采用教版、均质或是超生的方式就可以实现微乳的均匀分布。

三、微球给药系统

微球指的是药物溶解或是分散于高分子材料基质当中后逐渐形成的一种微小球状实体, 一般其直径在1-500μm以内, 从类型方面属于基质型骨架微粒。由于其优点显著, 能够快速释药, 并且对可生物能够起到降解作用, 所以现在已经进入长效注射剂研制阶段。

近些年以来, 微球剂系统大多时候是用来研究蛋白质、疫苗等生物技术。根据统计来看, 现在世界上上市的注射用微球产

品为十几种。纵观国内, 很多产品现在也已经进入了临床实验阶段。微球制备包括多种方式, 例如溶剂挥发法、喷雾干燥法以及超临界流体法等。采用可生物降解材料对生物技术进行的注射用微球问题还是有很多, 不过其中最主要的问题在于怎样能够确保生物技术产品历经微囊化与灭菌之后, 仍然可以实现结构的完整, 生物活性也能够达到要求。

四、纳米粒给药系统

纳米粒的米粒直径一般在1-1000nm之间, 呈固态胶体微粒状。其包括骨架实体的纳米球与膜壳药库型的纳米囊。现阶段, 部分正在进行临床试验的注射纳米晶体, 因为不同细胞表面会高度表达特定的配体或受体。以这些差异为依据, 研发人员能够对纳米粒的表面适当地加以调整。也可以将它只作为主动靶向的纳米粒, 直接靶向肿瘤组织, 尽可能地降低正常组织所受的损伤。

根据相关的文献资料可以发现, BF.NPs对于药物在肿瘤细胞中的时间, 可以起到有效地延长作用, 并且还能降低正常组织的损伤。即型凝胶的类型属于溶液状态给药之后, 用药位置有所转变, 从液体渐渐成为半固体凝胶的一种制剂。查阅相关资料, 可知按照载体材料原位固化体质的差异, 原味凝胶注射剂大体能够分成四类, 分别是热塑性糊状体、热诱导凝胶体系、原位交联聚合物体系以及原位聚合物沉淀体系。现阶段, 研发人员对凝胶制剂的研究并不成熟, 只能说仅仅是处于初级阶段, 目前真正上市的制剂产品还比较少。原味凝胶制备方式不止一种, 而是包含有多种, 主要包括温度、pH值和离子的相互作用等。在近几年的临床实验当中, 注射用原位凝胶大部分是用来对药物的释放进行合理控制, 或是为再生医学研究做贡献。

五、结语

注射给药的作用较为迅速, 可靠性较强, 其所受的pH值、食物以及酶等影响较小, 没有首过效应, 其兼具全身和局部定位的作用, 并且用药的剂量相对准确, 属于不可替代的给药路径。根据这些年来的研究, 脂质体、微乳、纳米粒以及原味凝胶等给药系统注射液进展明显。应用的前景较为广泛, 尤其是在治疗炎症、对抗肿瘤等方面疗效显著, 很多品种甚至已经在临床中使用。另一方面, 根据各位学者的研究, 现在水溶性差的化合物研究也有了较大进展, 将成为后续研究的热点所在。

参考文献:

- [1] 张强, 代文兵, 高薇, 等. 疏水性肽修饰的注射用长循环脂质体给药系统[J]. 中国, 2013, 11-20.
- [2] 涂盈锋, 刘畅, 居瑞军, 等. P167肽修饰的多柔比星长循环脂质体在大鼠体内的药动学和药效学[J]. 中国临床药理学杂志, 2014, 23(1): 9-14.