

药物制剂研发中的剂型设计与选择策略

蔡紫阳

(正大天晴药业集团股份有限公司, 江苏 连云港 222000)

【摘要】随着现代医学的发展和人们对健康生活的追求, 制药行业已经成了全球经济的重要组成部分之一。而药物制剂作为一种重要的医药产品形式, 其研制对于提高药效性和降低副作用具有重要意义。因此, 在药物制剂研发过程中, 剂型的设计和选择成了一个备受关注的问题。本文重点研究药物制剂研发中的剂型设计与选择策略, 为药物制剂的开发提供参考依据。

【关键词】药物制剂; 研发; 剂型设计; 选择策略

前言

药物制剂新剂型的理论和技术越来越完善, 并且发展速度有了越来越快的趋势, 在一定程度上推动了药物制剂的发展。相关工作人员通过查看资料, 可以了解药物制剂新剂型的发展现状, 而且目前所出现新的药物制剂技术还冲破了原有的药物制剂观念, 使得新药物制剂的适应范围更加广泛, 疗效更加稳定, 新药物制剂有了更加广阔的发展前景。随着我国医学事业的迅速发展, 越来越多的药物制剂新剂型出现在人们面前, 为药物制剂的稳定发展奠定了基础。

一、药物制剂研发中的剂型开发现状

在过去药物制剂的主要形态不是药片就是胶囊。现阶段, 对药物制剂新剂型的研发除了上述两种形态以外, 工作人员还会站在新的角度上对药物制剂的新剂型进行有效地考虑, 希望能够更好地提升药物制剂的安全性和疗效, 降低药物对人体产生的不利影响, 更好地保障人类的身体健康。在药物制剂新剂型品种的开发中, 如何使病患在用药时具备良好的顺应性以及对方制剂的研发是当今药物制剂研究的重点内容。目前, 市面上所流通的OTC药品都属于复方制剂。对方制剂研发时必须遵循一个原则那就是所使用的材料必须具备互补的效用, 如此才能够将药物制剂的作用充分地发挥出来, 对人体健康的危害或副作用降至最低。

目前, 智能化药物制剂的应用多用于癌症患者的治疗。例如, 当患者进入化疗阶段时会食用一些病毒性较大的药物, 给患者的身体带来不利的影响。如果在此时工作人员能够将这些病毒性较大的药物提前制作成前体药物, 并与生物酶、基因抗体、水溶性化合物等药物进行有效地融合, 并且使其成为一种新的

智能化药物制剂。这些药物进入病患身体以后, 到达肿瘤细胞区域时, 智能化药物制剂中的生物酶会将已经制作好的前体药物提前激活, 最终使这些药物将自己的成分发挥出来, 并利用这些药物本身所具有的毒性“除掉”癌细胞。因为制作成的智能化药物制剂所发生效用时都是在肿瘤区域内发生的, 对患者正常的细胞或组织只会产生极小的危害。

二、药物制剂研发中的剂型设计分析

(一) 设计原则

在药物制剂的研发过程中, 剂型的设计是至关重要的一环。为了保证药效和安全性, 需要遵循一系列的原则来进行剂型设计。必须充分考虑药品的特性和用途, 以确保其能够发挥最佳的效果, 要考虑到药品的稳定性和耐受性, 避免在生产和使用过程中出现不良反应或失效。此外, 还需要考虑药品的包装方式和运输条件等因素, 以便于满足市场需求并提高产品的竞争力。还要注意药品的质量控制和监管措施, 确保产品符合国家法律法规的要求。针对这些原则, 可以采取以下剂型设计策略: 一是采用合适的载体材料, 如聚合物、乳化剂等; 二是优化剂型结构的设计参数, 如粒径、表面活性度、溶胀温度等; 三是合理安排剂型装配方式, 如混悬液、胶囊、软膏等; 四是加强质量控制和监管措施, 包括对原料成分、工艺流程等方面进行严格把控。通过以上策略的应用, 可以有效地实现剂型的设计目标, 为药物制剂的研究提供有力的支持。

(二) 设计方法

药理学中所指的缓释是指当药物进入病患的身体以后, 根据患者的病理状况和患者的身体机能状况, 对药物的走向进行有效地控制, 并且将药品的疗

效充分地释放。与缓释相对应的是控释，控释是指在药物上覆盖一层控释衣膜，从而对药物在人体内的释放速度进行有效控制，也就是常说的靶向治疗。除此以外，药物制剂新剂型品种还有智能化药物制剂，这种药物制剂主要是将缓释和控制的优点进行了有效地结合，使药品在进入患者身体后能够直达病灶，并且根据患者的病理特征释放相应的药物[2]。智能化药物制剂患者体内释放药物成分时对周围环境的要求非常高，当药物进入人体以后到达病症区域时，会严格地按照患者的病理特征以及相关的标准将药物成分释放出来。例如，智能化药物制剂到达指定区域后当发现该区域内的酸碱值或者体温都处在正常的范围内，智能化药物制剂就不会释放相关的药物成分，从而减少了智能化药物制剂对人体健康所带来的副作用。

为了实现药品的质量控制和稳定性的要求，需要对不同剂型的性能进行全面评估和比较。因此，在剂型设计中，应该采用多种方法来确定最佳剂型。可以通过实验的方法来测试不同的剂型之间的差异性。例如，可以使用色谱法或质谱法来检测不同剂型的成分组成是否一致；也可以利用热重分析法或其他相关技术手段来测量不同剂型的溶出度、溶解度等方面的数据指标。这些数据可以通过对比不同剂型的优劣之处，为最终的选择提供参考依据。可以借助计算机模拟的方法来辅助剂型设计。现代计算机仿真技术已经非常成熟，可以用于模拟药物分子的结构和性质，以及其不同剂型中的行为特征。这种方法不仅能够提高研究效率，还能够减少实际试验所需的时间和成本。此外，还可以结合其他因素如药效学、安全性等因素，综合考虑各种因素的影响，从而得出最合适的剂型方案。可以借鉴已有的研究成果，学习他人的经验和教训，以避免重复犯同样的错误。同时，也需要注意到不同剂型之间可能存在的相互作用问题，并采取相应的措施加以规避。剂型的设计是一个复杂的过程，需要综合运用多种方法和经验，才能得到最好的结果。

三、药物制剂研发中的剂型选择策略

（一）剂型选择的具体方法

不同的剂型可以对药物的吸收、代谢和疗效产生不同程度的影响。因此，在进行剂型选择时需要考虑多种因素，包括药物性质、患者身体状况、治疗目的等因素。具体来说，剂型的选择应遵循以下原则：要确保所选剂型能够充分地发挥药物的作用；

要考虑到患者的身体情况，如年龄、体重、疾病史等方面的因素；还要注意剂型的选择是否符合临床实践的要求以及药品监管部门的规定。首先，对于同一种药物的不同剂量，不同的剂型可以提供不同的治疗效果。例如，对于一种抗病毒药物，采用硬胶囊的形式能够更好地控制其释放速度，从而达到更好的疗效；而采用软胶囊形式则更加方便患者服用，但可能会导致药物释放的速度更快。因此，在实际使用中需要综合考虑药品的特点以及患者的需求来确定合适的剂型。其次，药物制剂的选择也应该考虑到其稳定性和安全性。一些常见的药物制剂如片剂、颗粒剂等容易受到环境因素的影响，如温度变化、湿度等因素会对它们的质量产生影响。因此，在选用药物制剂时应尽可能避免这些不利条件的存在，以保证产品的稳定性和安全性。最后，药物制剂的设计和选型的过程需要充分考虑患者的需求和实际情况。有些疾病可能需要长期用药，因此需要选择具有较长缓释时间的产品，以便于患者按时服药。同时，还需要注意药品的口感、气味等方面的因素，以确保患者能够接受并且不会因为不良反应放弃治疗。针对这些问题，可以采用一些具体的方法来确定剂型的选择。例如，可以通过实验研究的方式验证不同剂型的药效差异，或者通过计算机模拟的方法预测剂型对药物的吸收、代谢和疗效影响。此外，还可以参考已有的研究结果和文献资料，以获取更多的相关知识和经验。总之，剂型的选择是一个复杂的过程，需要综合考虑各种因素并制定相应的策略。只有这样才能保证药物制剂研发的质量和效果。

（二）剂型选择的注意事项

1. 药品特性的影响。药品本身的性质对剂型的选择有着很大的影响。例如，一些具有高黏度或低溶性的药物可能不适合使用某些类型的剂型，而有些药物则适合于某种特定的剂型。因此，在进行剂型选择前应先了解药品的基本性质，以便更好地选择合适的剂型。

2. 患者个体差异的影响。不同患者的身体状况和生理条件可能会对其药效产生一定的影响，从而导致用药效果不佳或者出现不良反应等问题。因此，在进行剂型选择时应该考虑患者的具体情况，如年龄、体重、性别等因素，以及疾病的严重程度等等。这样可以确保所选用的剂型能够满足患者的需求，并最大限度地提高治疗的效果。

3. 生产工艺的影响。制药企业的生产工艺也会影响到剂型的选择。例如,对于需要长时间注射的药物,可以选择注射剂作为剂型;对于需要口服的药物,可以选择胶囊或其他类似形式的剂型。此外,生产工艺还包括了原料的质量、设备的性能等方面的因素,这些都会直接影响到剂型的选择结果。

4. 市场需求的影响。市场的需求也是剂型选择的一个重要因素。企业要根据市场需求的变化及时调整剂型的选择,以适应市场的变化趋势。同时,也要注意产品的竞争力,尽可能多地提供给消费者更多的选择。剂型选择是一个复杂的过程,需要综合考虑各种因素。只有充分掌握这些因素,才能够做出正确的决策,为药物制剂的发展注入新的活力。

四、药物制剂研发中的剂型发展方向与趋势

(一) 药物化学的发展推动了药物制剂的发展

随着生物学,生物化学等这些学科的迅速发展,企业所生产出来的药物制剂更加科学合理,药物制剂新剂型的品种也有了新的发现,如智能化药物制剂等,而且这些药物制剂的疗效也得到了有效提升。在过去药物制剂发展过程中面临的诸多问题,如吸收不彻底、靶向治疗缺乏精准性等,随着生物化学生物学的发展,这些问题都已经全部解决。

(二) 药物制剂的制作方式,制作工艺更加标准化程序化

随着信息技术、医药制剂技术、人工智能技术的快速发展,制作药物制剂的原材料和其他辅料的质量也越来越好,制作过程也越来越标准,制作设备也越来越智能化、程序化。在过去进行药物制剂的制作时,药物成分、药物的配比都需要多个医药学专家进行共同的探讨,但随着信息技术和人工智能技术的快速发展,这些任务只需要操作人员控制计算机就能完成。

(三) 生物芯片推动了药物制剂的发展

在生物医学领域中,生物芯片技术的出现,绝对是这一领域内的一次重大变革。通过将生物芯片技术与其他的医药技术对比发现,生物芯片技术具有更高的规范性和精准性,因而生物芯片技术一经出现就被多个领域所重用,如生物药学、药动学、生命科学等等。将生物芯片技术与医学进行有效地结合,能够更快地推动药物制剂新剂型的发展。因此,生物芯片技术已经成为药物制剂新剂型研发时的重要组成部分。但是,在药物制剂新剂型的研发过程中仍然存在一系列问题,如药物制剂新剂型研发经费较少、该领

域内缺乏创新意识的专业人才、与其他国家缺少交流等等,这些因素都限制了药物制剂新剂型的发展。对于药物制剂新剂型的研发来说,科研人员具备要好的创新意识、国家对此投入大量的经费、与其他国家进行有效的合作等都是必不可少的,也是必须经历的。

结语

综上所述,从药物制剂新剂型的发展历程来看,我国相关人员在该领域内取得了重大的成绩,这是有目共睹的,甚至在某些方向中,我国相关人员的研究是超前的,远远领先于其他国家。因此,随着新技术、新思想的快速发展,更多药物制剂经济型品种一定会研发成功,在疾病治疗中也会发挥有效的作用,进一步保障人类的健康。

参考文献:

- [1] 韩金城,周莹,蒋敏等.基于药物研发的药学综合实验设计[J].实验室研究与探索,2023,42(05):216-221.
- [2] 曹冲,黄启良,曹立冬等.减施增效农药剂型设计与制剂研发策略[J].世界农药,2021,43(02):1-5.
- [3] 王逸飞,朱振宇,吴志生等.QbD理念的中药缓控释制剂的设计与研发研究[J].中国中药杂志,2019,44(20):4317-4321.
- [4] 张振声.小分子ERR α 蛋白水解靶向嵌合体的设计合成及相关生物学活性研究[D].暨南大学,2019.
- [5] Schwendeman A.合成高密度脂蛋白纳米制剂的设计及研发[C]//中国药学会.2018年第十二届中国药物制剂大会论文集.College of Pharmacy, Biointerfaces Institute, University of Michigan;, 2018: 2.
- [6] 杜威.农药制剂数据库的设计与研发[D].上海师范大学,2015.
- [7] 陈春,林志强,杨劲.模型设计在制剂研发及生产过程质量控制中的应用[J].药学进展,2011,35(07):289-296.
- [8] 李青,冯恩光,柳红等.基于结构的抗流感病毒神经氨酸酶抑制剂的设计和研发[J].生物产业技术,2010,(06):42-48.

作者简介:

蔡紫阳(1979.5-),男,汉,本科,籍贯:江苏省灌云县,职称:高级工程师,研究方向:药物研发与生产。