

前 言

目前，大约 40% 的新化学实体在临床研究中面临着溶解性差、生物利用度低的缺点，这给新药研发的初期以及后期商品化阶段带来了巨大的挑战，尤其是口服给药系统。然而相对于其他给药形式，大多数患者更加倾向于口服给药，而更好的患者顺应性对于治疗效果具有明显的促进作用。除此之外，很多难溶性药物上市后，药物口服生物利用度受食物的影响较大，然而很多患者甚至医生对此重视不足，导致需要饱腹服用的药物没按照规定服用，使得药物吸收度降低，血药浓度达不到治疗有效浓度，导致药效的下降。除此之外，对于治疗精神分裂症等患者的药物，此类患者与正常人不同，服药顺应性较差，很难确保患者在饱腹下服药。

关于提高难溶性药物生物利用度的研究很多，但是关于解决空腹和饱腹下的吸收差异，国内外研究较少。因此研究增加这些药物空腹口服下的生物利用度，消除或减小空腹与饱腹下药物吸收的差异，将在增加此类药物的可控性、提高药物的安全性、加强药物的疗效、提高患者服药顺应性和避免因患者进食的食物达不到所需的脂肪含量或热量而导致的吸收差异等方面有着重要的意义。

本书以盐酸齐拉西酮、盐酸西那卡塞、利伐沙班和普仑司特等生物药剂学分类中 II 类药物为研究对象，制备盐酸齐拉西酮与普仑司特磷脂复合物与盐酸西那卡塞和利伐沙班自微乳，并对两种制剂技术制备的相应剂型进行了体内外的评价，研究上述药物通过磷脂复合物与自微乳给药系统能够提高其体内口服生物利用度和消除或减少食物对其吸收的影响。