



学习情境：药物制剂新技术		难度系数：
班级：	学习小组：	姓名：

一、任务描述

靶向制剂

1、任务目的

2、任务内容（分组完成其中一个操作任务）

（一）薄膜分散法制备环孢素脂质体

1. 处方

大豆磷脂	100mg	环孢素	5mg
胆固醇	25mg	0.9%氯化钠	5mL

2. 制备：精确称取环孢素 5mg 置茄形瓶中，加入大豆磷脂 100mg 和胆固醇 25mg，用氯仿 10mL 使溶解，利用水浴旋转蒸发仪在不断旋转振摇下，减压蒸发除去溶剂（水浴温度 $35^{\circ}\text{C} \pm 1^{\circ}\text{C}$ ），使脂质混合物以薄膜状均匀地沉积于瓶的内壁形成。然后加入 0.9%氯化钠水溶液 5mL，充分振摇 5min，在水浴旋转蒸发仪上旋转水合 1h，然后用探式超声仪在冰水浴中超声 1min，即得脂质体混悬液。

将环孢素脂质体混悬液置冰箱中密封冷藏保存。

（二）逆相蒸发法制备胰岛素脂质体

[处方]	大豆磷脂	150mg
	胆固醇	25mg
	胰岛素	4mg
	0.01M HCl	0.5mL
	pH7.4 磷酸盐缓冲液	4.5mL

[制备]：精确称取胆固醇 20mg 置茄形瓶中，加入大豆磷脂 150mg，用乙醚 10mL 溶解。另精确称量取胰岛素 4mg，溶于 0.5mL 的 0.01M HCl 中，再加入 4.5mL pH 7.4 的 PBS，然后与乙醚液混合，振摇，浴式超声乳化，所得乳液在 20°C 水浴旋转蒸发仪上减压除去有机溶剂，直至得到乳状脂质体混悬液。



将该脂质体混悬液涡旋振摇 15min，然后用探式超声仪在冰水浴中超声 1min，即得。

将胰岛素脂质体混悬液置冰箱中密封冷藏保存。

四、操作要点和注意事项

1. 脂质体的制备方法应根据药物的性质以及该脂质体的用途和要求进行选择。
2. 用薄膜分散法制备含药脂质体时，应注意正确称量、按规定控制温度、并将溶媒蒸发除尽。另外，控制好旋转蒸发仪的旋转速度和真空度，以便成膜均匀。
3. 用逆相蒸发法制备含药脂质体时，应注意乳化要充分、水浴温度和真空度要控制得当。
4. 使用旋转蒸发仪减压蒸发时，要防止水循环真空泵的水倒灌。
5. 脂质体制备完毕后，要对其进行质量评价，目前要求控制的主要项目有：①形态、Zeta 电位、粒径及分布；②包封率、率载药量和渗漏；③药物的含量测定；④有害有机溶剂的限量检查；⑤药物体内分布测定（通常用小鼠）等。

3、学生操作指导

4、任务结果与记录

5、讨论（围绕如下思考题讨论）

本次课围绕下列任务展开：

环孢素脂质体、胰岛素脂质体的生产方法

二、相关资料及资源

相关资料：

- 1、教材《药物制剂生产》
- 2、工具书《药用辅料大全》
- 3、教学课件

相关资源：

- 1、电脑设备
- 2、网络资源
- 3、相关参考资料
- 4、教学课件 教学情景六
- 5、引导文

三、任务实施说明

- 1、学生分组，每小组 5 人
- 2、小组进行任务分析
- 3、资料学习
- 4、现场教学



5、小组合作，共同完方案制定

7、完成引导文

8、完成教材相关思考与练习

四、任务实施注意点

1、必须掌握靶向制剂的生产工艺和流程及辅料的作用。

2、遇到问题时小组进行讨论，可让老师参与讨论，通过团队合作获取问题的解决。

3、环孢素脂质体、胰岛素脂质体生产方法和工艺流程进行比较。

任务分配表：

姓名	内容	完成时间

日期： 年 月 日