



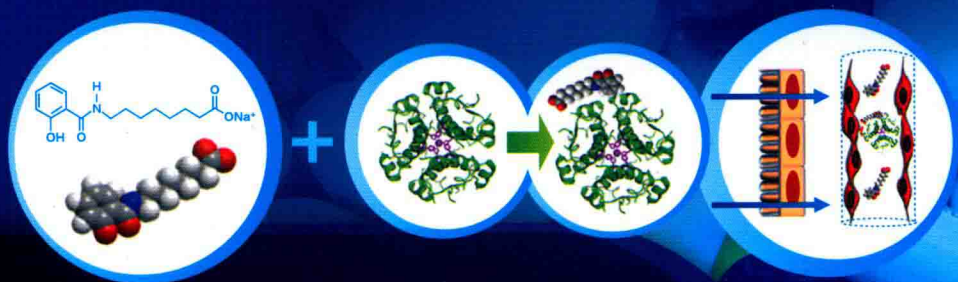
全国高等教育药学类规划教材

药剂学

Pharmaceutics

潘卫三 主编

刘伟 副主编



化学工业出版社



全国高等教育药类规划教材

药剂学

Pharmaceutics

潘卫三 主编

刘伟 副主编

《药剂学》全书共分为十八章，首先阐述药剂学相关概念及生物药剂学与药物动力学基础；然后以药物剂型为主线，结合《中国药典》(2015年版)，分别详细介绍了液体制剂、无菌制剂、固体制剂、膏剂、膜剂、凝胶剂、栓剂、气雾剂、喷雾剂、粉雾剂、中药制剂、固体分散体、包合物、微球与微囊、缓(控)释制剂、经皮吸收制剂、靶向制剂、生物技术药物制剂的处方设计基本原理、制备工艺以及所涉及的常用制剂生产设备，适当增加与实际工业生产密切相关的制剂技术、工艺设计、质量控制等内容，强化新剂型和新制剂的设计与研究等方面的介绍，内容由浅入深；最后简述药物制剂的稳定性，并强调药品的包装重要性及相关行业标准。

全书体系合理，精化基础理论，优化专业知识，强化实践能力，紧密结合行业最新标准，突出专业特色，可作为制药工程、药物制剂、药学等高等院校药学类本科各相关专业的教材，也可供从事药物制剂研发的科技人员和药物制剂生产的专业技术人员参考使用。

图书在版编目(CIP)数据

药剂学/潘卫三主编. —北京: 化学工业出版社, 2017.7
全国高等教育药学类规划教材
ISBN 978-7-122-29868-3

I. ①药… II. ①潘… III. ①药剂学 IV. ①R94

中国版本图书馆CIP数据核字(2017)第128296号

责任编辑: 褚红喜 宋林青
责任校对: 宋 夏

装帧设计: 关 飞

出版发行: 化学工业出版社(北京市东城区青年湖南街13号 邮政编码100011)
印 装: 三河市延风印装有限公司
787mm×1092mm 1/16 印张32 字数813千字 2017年9月北京第1版第1次印刷

购书咨询: 010-64518888(传真: 010-64519686) 售后服务: 010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书, 如有缺损质量问题, 本社销售中心负责调换。

定 价: 58.00 元

版权所有 违者必究

全国高等教育药学类规划教材

《药剂学》编写组

主 编 潘卫三
副 主 编 刘 伟
编 者 (以汉语拼音为序)

陈立江 (辽宁大学药学院)
丁劲松 (中南大学湘雅药学院)
杜永忠 (浙江大学药学院)
纪宏宇 (哈尔滨医科大学)
李 翀 (西南大学药学院)
刘丹丹 (辽宁科技学院)
刘 伟 (郑州大学药学院)
李 颖 (深圳大学药学院)
欧阳德方 (澳门大学中华医药研究院)
潘卫三 (沈阳药科大学药学院)
钱 锋 (清华大学药学院)
任福正 (华东理工大学药学院)
沈 琦 (上海交通大学药学院)
魏 刚 (复旦大学药学院)
王秀敏 (厦门大学药学院)
熊素彬 (浙江工业大学药学院)
杨星钢 (沈阳药科大学药学院)
赵会英 (北京化工大学生命学院)
张 娜 (山东大学药学院)

前言

药剂学 (Pharmaceutics) 是以药物制剂为中心研究其基本理论、处方设计、制备工艺、质量控制和合理应用的综合性应用学科, 其基本任务是研究和设计如何将药物制成适宜的剂型并能批量生产出品质优良、安全有效的药物制剂, 以满足医疗与预防的需要, 这正是本书的主体内容。

本书始终坚持以现代制药及制剂工业的发展要求为核心, 以理论密切联系实际为指导思想, 首先介绍了学习药剂学必备的生物药剂学与药物动力学的基础知识, 然后以生产实践和临床应用上常见的液体制剂、无菌制剂、固体制剂等各种剂型为主线, 结合《中国药典》(2015年版), 由浅入深地具体介绍了各种剂型和制剂的特点与制备工艺、质量控制要点与处方设计的基本原理以及所涉及的经典的或最新的制剂设备; 同时, 本书也强化了缓(控)释制剂、经皮吸收制剂、靶向制剂和生物技术药物制剂等新剂型和新制剂的设计、开发与研究等方面的内容; 此外, 根据我国近年来陆续颁布的有关法规, 简述了与药物制剂稳定性有关的基本理论、常用技术与研究方法以及药品的包装重要性及相关行业标准, 以供读者参阅, 从而使本书具有较强的可读性和实用性。

全书体系合理, 精化基础理论, 优化专业知识, 强化实践能力, 紧密结合行业最新标准, 突出专业特色, 不仅是制药工程专业、药物制剂专业和药学专业师生的必备教材, 也是广大从事药物制剂生产、科研和管理技术人员的重要参考书。由于药剂学所涉及的基础知识、技术领域以及相关行业标准与法规非常广泛, 专业性强, 实践性强; 且近年来我国药剂学发展非常迅速, 先进技术与先进制剂设备不断更新, 故本书的内容可能不够全面。在此, 衷心期望有关专家学者提出批评和建议, 以使本书再版时得到升华。

在本书的编写过程中, 得到了清华大学、复旦大学、澳门大学、浙江大学、郑州大学、上海交通大学、厦门大学、山东大学、辽宁大学和浙江工业大学等多年从事药剂学教学与科研工作的专家学者的大力支持, 他们为本书的编写付出了辛勤的努力与无闻的心血, 在此表示深深的感谢!

为方便教学, 本书配有电子课件和教学大纲, 使用本书作教材的院校可向出版社索取, chxcip@126.com。

沈阳药科大学 潘卫三

2017年5月

目 录

第一章 绪论 / 1

第一节 概述	1
一、剂型、制剂、药剂学和工业药剂学的概念	1
二、药剂学的其他分支学科	2
第二节 药物制剂	3
一、剂型的分类	3
二、药用辅料	4
第三节 药剂学的任务与发展	6
一、药剂学的任务	6
二、药剂学的发展	7
第四节 药物制剂的质量控制	8
一、国家药品标准	8
二、药典	9
三、药品生产质量管理规范	10
四、仿制药质量和疗效一致性评价	11
参考文献	12

第二章 生物药剂学与药物动力学基础 / 13

第一节 概述	13
一、生物药剂学概念	13
二、生物膜结构	13
三、药物通过生物膜的转运途径与机理	14
四、药物的生物药剂学分类系统	15
第二节 药物的吸收及其影响因素	16
一、药物经胃肠道吸收的生理基础	16
二、影响药物胃肠道吸收的生理因素	17
三、影响药物胃肠道吸收的理化因素	18
四、影响药物胃肠道吸收的剂型与制剂因素	19
五、其他给药途径的药物吸收影响因素	21
第三节 药物的分布、代谢与排泄	22
一、药物的分布	22
二、药物的代谢	24
三、药物的排泄	25
第四节 药物动力学原理	26
一、概述	26
二、药物动力学基本概念	27

三、生物利用度与生物等效性	28
参考文献	28

第三章 液体制剂（一） / 30

第一节 概述	30
一、液体制剂的概念与特点	30
二、液体制剂的质量要求	31
三、液体制剂的分类	31
第二节 药物的溶解度与溶解速度	32
一、溶解、溶解度及溶解速度	32
二、药物溶解度的影响因素	33
三、提高药物溶解度的方法	35
四、药物溶解速度的影响因素及提高方法	37
第三节 表面活性剂	37
一、表面活性剂概念及结构特征	37
二、表面活性剂的分类及常用表面活性剂	38
三、表面活性剂的特征	41
四、表面活性剂的生物学性质	46
五、表面活性剂在制剂中的应用	46
第四节 液体制剂的常用溶剂和附加剂	49
一、液体制剂的常用溶剂	49
二、液体制剂的常用附加剂	51
参考文献	54

第四章 液体制剂（二） / 55

第一节 溶液型液体制剂	55
一、溶液剂	55
二、糖浆剂	57
三、芳香水剂	59
四、醑剂	60
五、酊剂	60
六、甘油剂	61
七、高分子溶液剂	61
第二节 溶胶剂	63
一、概述	63
二、溶胶剂的构造和性质	63
三、溶胶剂的制备	64
第三节 混悬剂	65
一、概述	65
二、混悬剂的物理稳定性	66
三、混悬剂的稳定剂	68
四、混悬剂的制备	70

五、混悬剂的质量评价	70
第四节 乳剂	71
一、概述	71
二、乳剂形成机理	72
三、乳化剂	73
四、决定乳剂类型的因素	75
五、乳剂的稳定性	76
六、乳剂的制备与设备	77
七、乳剂的质量评价	79
第五节 不同给药途径用液体制剂	80
一、合剂	80
二、洗剂	80
三、冲洗剂	80
四、搽剂	80
五、涂剂与涂膜剂	81
六、耳用液体制剂	81
七、滴鼻剂	81
八、灌肠剂	82
九、含漱剂	82
第六节 液体制剂的包装与贮存	82
一、液体制剂的包装	82
二、液体制剂的贮存	83
参考文献	83

第五章 无菌制剂 / 84

第一节 概述	84
一、无菌制剂	84
二、灭菌参数	85
三、物理灭菌法及设备	87
四、化学灭菌法	91
五、无菌操作法	92
六、无菌生产工艺验证	93
第二节 注射剂概述	93
一、注射剂的概念与特点	93
二、注射剂的质量要求	94
三、注射剂的分类	95
四、注射剂的给药途径	95
第三节 制药及注射用水的制备技术	96
一、热原	96
二、制药用水和注射用水的相关概念及质量要求	98
三、制药用水及注射用水的制备	99
第四节 液体过滤技术	103
一、过滤机理	103
二、过滤速度的影响因素及提高方法	104

三、过滤介质	104
四、过滤器及过滤装置	104
第五节 洁净室与空气净化技术	106
一、GMP 洁净室的净化标准	106
二、空气净化技术	108
三、洁净室的设计及要求	110
第六节 注射剂的处方组成	111
一、注射剂的原料	112
二、注射剂的溶剂	112
三、注射剂的附加剂	113
第七节 小体积注射剂的制备	117
一、注射剂的制备工艺流程图	117
二、注射剂的容器及处理方法	117
三、溶液型注射液的制备	119
四、混悬型注射剂的制备	124
五、乳剂型注射剂的制备	124
第八节 输液	125
一、概述	125
二、输液的制备	127
三、输液容易存在的问题及解决方法	131
第九节 注射用无菌粉末	132
一、注射用无菌分装产品	132
二、注射用冷冻干燥制品	133
第十节 眼用液体制剂	137
一、概述	137
二、滴眼剂吸收途径及影响吸收的因素	138
三、滴眼剂的常用附加剂	140
四、滴眼剂的制备方法	142
五、滴眼剂的举例	143
参考文献	145

第六章 固体制剂 (一) / 146

第一节 固体制剂概述	146
一、固体制剂的特点	146
二、固体制剂的制备工艺	147
三、固体剂型的体内吸收途径	148
四、Noyes-Whitney 方程	148
第二节 固体制剂的常用辅料	149
一、填充剂和吸收剂	149
二、润湿剂和黏合剂	151
三、崩解剂	153
四、润滑剂	155
五、其他辅料	156
第三节 粉体学	156

一、粉体学概念及在制剂中的应用	156
二、粉体粒子的性质	157
第四节 粉碎、筛分与混合	168
一、粉碎	168
二、筛分	172
三、混合	174
第五节 制粒	177
一、概述	177
二、湿法制粒	178
三、干法制粒	182
第六节 干燥	182
一、概述	182
二、干燥的原理	183
三、干燥速率及影响因素	184
四、干燥的方法与设备	185
参考文献	188

第七章 固体制剂（二） / 189

第一节 散剂	189
一、概述	189
二、散剂的制备	189
三、散剂举例	191
四、散剂的包装与贮存	191
五、散剂的质量评价	192
第二节 颗粒剂	193
一、概述	193
二、颗粒剂的制备	194
三、颗粒剂举例	194
四、颗粒剂的包装与贮存	195
五、颗粒剂的质量评价	195
第三节 胶囊剂	196
一、概述	196
二、胶囊剂的制备与设备	197
三、胶囊剂举例	203
四、胶囊剂的包装与贮存	204
五、胶囊剂的质量评价	204
第四节 滴丸剂	205
一、概述	205
二、滴丸剂常用基质和冷凝液	205
三、滴丸剂制备方法	206
四、滴丸剂举例	208
五、滴丸的质量评价	209
第五节 微丸剂	210
一、概述	210

二、微丸剂的辅料	210
三、微丸剂的制备	210
四、微丸剂举例	213
五、微丸剂的包装与贮存	213
六、微丸剂的质量评价	213
参考文献	214

第八章 固体制剂 (三) / 215

第一节 片剂概述	215
一、片剂的概念与特点	215
二、片剂的质量要求	215
三、片剂的分类	216
第二节 片剂的制备	217
一、湿法制粒压片	217
二、干法制粒压片	221
三、直接压片	221
四、片剂成型的机理及影响因素	222
五、片剂生产中可能出现的问题及解决方法	223
第三节 片剂的包衣	227
一、概述	227
二、包衣的方法与设备	228
三、包衣的材料与工艺	230
四、包衣过程中可能出现的问题及解决方法	235
第四节 片剂的质量控制	236
一、片剂质量控制的目的及意义	236
二、片剂的质量控制项目	236
第五节 片剂的包装与贮存	238
一、片剂的包装	238
二、片剂的贮存	239
第六节 片剂举例	239
一、普通片	239
二、包衣片	240
三、泡腾片	241
四、分散片	242
五、口腔崩解片	242
参考文献	242

第九章 膏剂、膜剂、凝胶剂与栓剂 / 244

第一节 流变学	244
一、概述	244
二、流变性质	246
三、流体流变性质的测定	250

四、流变学在药剂学中的应用	252
第二节 软膏剂	252
一、概述	252
二、软膏基质	253
三、软膏剂的制备与设备	256
四、软膏剂举例	257
五、软膏剂的包装、贮藏与质量评价	257
第三节 乳膏剂	258
一、概述	258
二、乳膏基质	258
三、乳膏剂的制备与设备	262
四、乳膏剂举例	263
五、乳膏剂的包装、贮藏与质量评价	263
第四节 凝胶剂	264
一、概述	264
二、凝胶基质	264
三、凝胶剂的制备与设备	266
四、凝胶剂举例	266
五、凝胶剂的包装、贮藏与质量评价	266
第五节 贴膏剂	267
一、概述	267
二、橡胶贴膏	267
三、凝胶贴膏	269
第六节 膜剂	269
一、膜剂概述	269
二、膜剂的成膜材料	270
三、膜剂的制备与设备	270
四、膜剂举例	271
五、膜剂的质量评价	271
第七节 糊剂与眼用半固体制剂	272
一、糊剂	272
二、眼用半固体制剂	272
第八节 栓剂	273
一、概述	273
二、栓剂基质	275
三、栓剂的制备	276
四、栓剂举例	278
五、栓剂的包装、贮藏与质量评价	278
参考文献	279

第十章 气雾剂、喷雾剂与粉雾剂 / 280

第一节 概述	280
一、吸入制剂的肺部吸收特点	280
二、影响药物在肺部吸收的因素	280

第二节 气雾剂	281
一、概述	281
二、气雾剂的组成	283
三、气雾剂的制备及设备	285
四、气雾剂举例	287
五、气雾剂的质量评价	288
第三节 喷雾剂	289
一、概述	289
二、喷雾装置	289
三、喷雾剂的处方设计	291
四、喷雾剂举例	292
五、喷雾剂的质量评价	292
第四节 吸入粉雾剂	293
一、概述	293
二、吸入粉雾剂的装置	293
三、吸入粉雾剂的制备	295
四、吸入粉雾剂举例	296
五、吸入粉雾剂的质量评价	296
参考文献	296

第十一章 中药制剂 / 298

第一节 中药制剂概述	298
一、中药制剂的概念与特点	298
二、中药制剂的质量要求	299
三、中药制剂的分类	300
第二节 中药制剂前处理	301
一、浸出的原理	301
二、浸出的影响因素	302
第三节 浸出制剂的制备及设备	304
一、浸渍法	304
二、渗漉法	305
三、煎煮法	307
四、连续逆流法	308
五、其他方法	309
六、浸出液的蒸发及干燥	312
第四节 常用的中药制剂	314
一、汤剂	314
二、酒剂	315
三、酊剂	316
四、流浸膏剂与浸膏剂	316
五、煎膏剂	317
六、中药丸剂	318
七、膏药	321
参考文献	323

第一节 固体分散体	324
一、概述	324
二、固体分散体的热力学特性	325
三、固体分散体的制备方法	326
四、固体分散体的物理稳定性问题	328
五、固体分散体的物理表征	330
六、固体分散体的体外溶出和体内评价	331
第二节 包合物	332
一、概述	332
二、包合材料	333
三、药物-环糊精相互作用的机制	335
四、常用的包合技术	336
五、包合物的验证	337
第三节 微囊与微球	338
一、概述	338
二、微囊与微球常用载体材料	339
三、微囊与微球的制备方法	341
四、微囊与微球中药物的释放	345
五、微囊与微球的质量评价	346
参考文献	347

第一节 概述	348
一、缓（控）释制剂的概念	348
二、缓（控）释制剂的特点	348
三、缓（控）释制剂的分类	349
第二节 缓（控）释制剂的释药原理和处方设计	349
一、释药原理	349
二、处方设计	353
第三节 缓（控）释制剂的处方和制备	354
一、骨架型缓（控）释制剂	354
二、膜控型缓（控）释制剂	356
三、渗透泵型缓（控）释制剂	358
四、微丸型缓（控）释制剂	360
五、其他类型缓（控）释制剂	363
第四节 缓（控）释制剂的体内外评价方法	364
一、体外释药行为评价	364
二、体内过程评价	367
三、体内外相关性评价	369
参考文献	370

第十四章 经皮吸收制剂 / 371

第一节 概述	371
一、经皮给药制剂的概念与特点	371
二、经皮给药制剂的质量要求	372
三、经皮给药制剂的分类	372
第二节 药物经皮吸收机制及促进方法	374
一、药物经皮吸收机制	374
二、影响药物经皮吸收的因素	375
三、药物经皮吸收的促进方法	376
第三节 经皮吸收制剂的处方组成	378
一、药物及附加剂	378
二、控释材料	379
三、压敏胶	379
四、背衬材料及保护层	380
第四节 经皮吸收制剂的制备	380
一、膜材的加工	380
二、制备工艺	380
三、经皮给药贴剂的处方举例	381
第五节 经皮吸收制剂的质量评价	382
一、经皮制剂体外评价方法	382
二、经皮制剂体内评价方法	383
三、黏性的测定	384
参考文献	385

第十五章 靶向制剂 / 386

第一节 概述	386
一、靶向制剂的概念与特点	386
二、靶向制剂的分类	386
三、靶向性评价	389
第二节 脂质体	390
一、脂质体的概念与特点	390
二、脂质体的组成与结构	392
三、脂质体分类	394
四、脂质体的理化性质	395
五、脂质体的制备方法	396
六、脂质体的修饰	398
七、脂质体的质量评价	399
第三节 纳米粒	399
一、纳米粒的概念、特点和分类	399
二、固体脂质纳米粒	400
三、纳米粒的修饰	401
第四节 聚合物胶束	402

一、聚合物胶束的概念和特点	402
二、聚合物胶束的分类及组成	402
三、聚合物胶束的制备方法（载药方法）	403
第五节 纳米乳	404
一、纳米乳的概念和特点	404
二、纳米乳的制备方法	405
三、纳米乳作为药物载体的应用	407
参考文献	408

第十六章 生物技术药物制剂 / 409

第一节 概述	409
一、生物技术药物的概念	409
二、生物技术药物的分类	410
三、生物技术药物的结构	411
四、生物技术药物的理化性质	412
五、生物技术药物与制剂设计相关的特性	415
第二节 生物技术药物注射给药系统	416
一、普通注射给药系统	416
二、新型注射给药系统	419
第三节 生物技术药物非注射给药系统	427
一、生物技术药物的经皮给药制剂	427
二、生物技术药物的黏膜给药制剂	428
三、生物技术药物的口服给药制剂	431
第四节 生物技术药物制剂的质量评价	434
一、生物技术药物的质量控制	434
二、生物技术药物的稳定性评价	435
参考文献	435

第十七章 药物制剂的稳定性 / 436

第一节 概述	436
一、研究药物制剂稳定性的意义及内容	436
二、药物制剂的主要化学降解途径	436
三、药物制剂稳定性研究的化学动力学基础	440
第二节 影响药物制剂降解的因素及稳定化方法	441
一、处方因素和稳定化方法	441
二、非处方因素和稳定化方法	445
三、药物制剂稳定化的其他方法	447
第三节 固体药物制剂的稳定性	447
一、固体制剂稳定性的一般特点	448
二、影响固体制剂稳定的因素及稳定化方法	448
第四节 药物制剂稳定性试验方法	450
一、稳定性试验的目的和基本要求	450

二、药物稳定性试验指导原则规定的试验内容	450
三、药物制剂稳定性研究的其他方法	453
参考文献	455

第十八章 药品的包装 / 457

第一节 概述	457
一、药品包装的概念及重要性	457
二、药品包装的基本功能	458
三、药品包装的分类	459
四、药品包装的要求	460
第二节 药用包装材料	461
一、玻璃药包材	461
二、塑料药包材	464
三、金属药包材	466
四、复合包装材料药包材	468
第三节 药包材的质量评价	471
一、药包材的生物学试验方法	471
二、理化性质检查方法	472
三、药包材与药物的相容性	474

参考文献 / 479

中文索引 / 480

英文索引 / 489
