

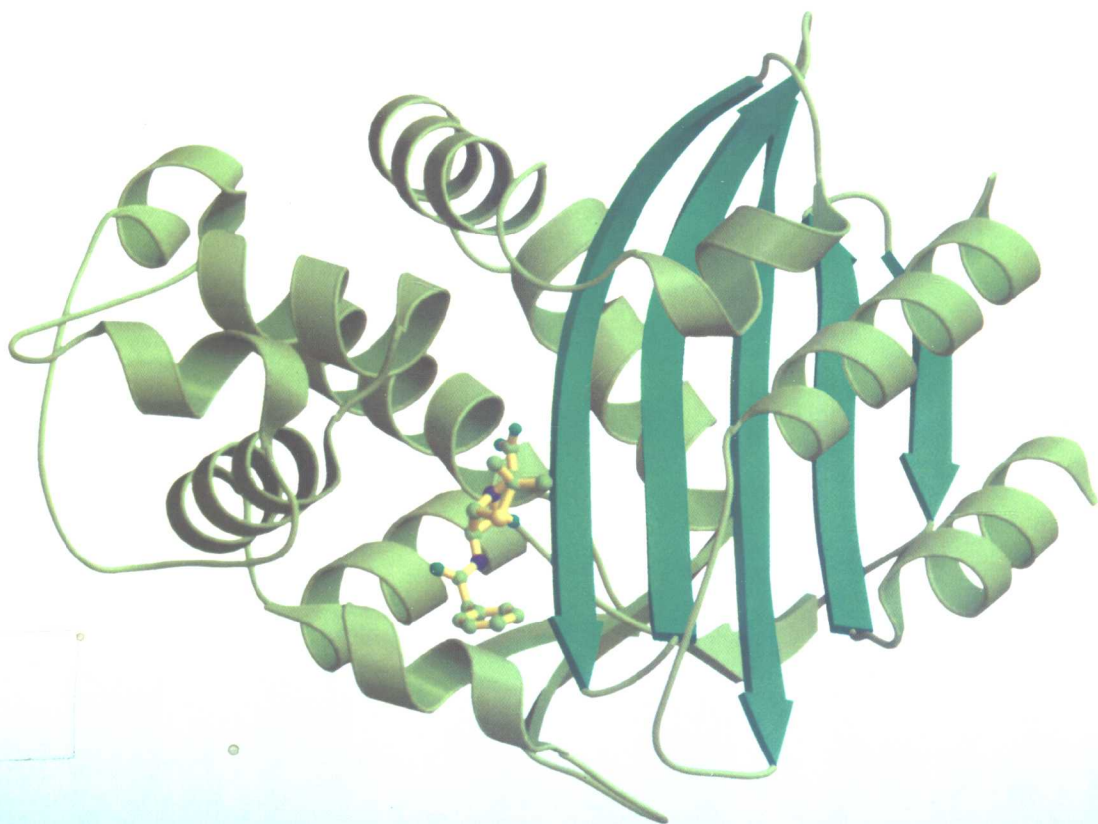
上海医药工业研究院药物制剂部
药物制剂国家工程研究中心

编 著

YAOYONG FULIAO YINGYONG JISHU

药用辅料应用技术

第 二 版



中国医药科技出版社

药用辅料应用技术

(第二版)

上海医药工业研究院药物制剂部
药物制剂国家工程研究中心 编著

主编	侯惠民	王浩	张光杰
主审	王其灼		
编者	陈乐权	陈允发	侯惠民
	何雯	黄胜炎	刘明孙
	刘镡	陆伟根	彭望成
	史玉亭	沈慧凤	王大林
	王浩	吴文祺	徐家栋
	谢保源	谢星辉	张光杰

中国医药科技出版社

登记证号：(京) 075 号

内 容 提 要

本书较全面地论述了药物制剂各种剂型所用辅料的选用原则、作用原理、有关的生产技术和要求。较系统地介绍了各种剂型中的常用辅料约 500 余种，特别是详细介绍了近年来国外的新型药用辅料。全书给出了大量的应用实例和制备工艺。

本书可供医药生产、教学、科研、药事管理、药检、医院药房和药品供应等方面的工作人员使用，也可供食品、化妆品工业技术人员及医务工作者参考。

图书在版编目 (CIP) 数据

药用辅料应用技术/上海医药工业研究院药物制剂研究中心，药物制剂国家工程研究中心编著. —2 版.

—北京：中国医药科技出版社，2001.9

ISBN 7-5067-2509-6

I. 药… II. ①上…②药… III. 药物-辅助材料-基本知识 IV. TQ460.4

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2001) 第 053424 号

中国医药科技出版社 出版
(北京市海淀区文慧园北路甲 22 号)
(邮政编码 100088)

北京昌平精工印刷厂 印刷
全国各地新华书店 经销

*

开本 787×1092mm $\frac{1}{16}$ 印张 30 $\frac{3}{4}$

字数 740 千字

2002 年 7 月第 2 版 2002 年 7 月第 1 次印刷

定价：198.00 元

本社图书如存在印装质量问题，请与本社联系调换 (电话：62244206)

序

药用辅料是构成各种药物制剂必不可少的组分。它在制剂中虽无药效，但如选用得当，工艺合理，不仅能使生产顺利，保证药品质量、延长贮存期，且能在给药后对药物的体内释放、吸收、分布、排泄等过程起一定的有利影响，从而最大限度地发挥药物的效，降低毒副反应。近二十余年来，国外药物制剂工业非常重视辅料的研究、开发与应用，涌现出大量的新型辅料，为制剂质量的改进和新型“给（输）药系统”的创制提供了丰富的物质条件，大大提高了制剂生产技术水平，加快了制剂工业的发展。国内开展辅料工作尚处于初始阶段，远远不能满足我国制剂生产和医疗事业发展的形势需要。如何加快我国药用辅料的发展，是当前医药工作者面临的一个重大课题。

书刊、文献是知识的重要媒介和传递工具。国外发表辅料研究资料甚多，国内亦有不少的研究和综述报道。惜乎内容分散，有欠完整性。至于“药用辅料”专著，国内尚属缺门。

《药用辅料应用技术》一书，系由上海医药工业研究院有关研究员，高级工程师编撰而成。著者根据他们数十年从事药品生产、科研的经验与资料累积，参阅国内外辅料研究与应用的最新成就，以辅料在剂型中所起作用为重点，理论与实践相结合，论述了制剂生产要点、辅料应用的必要性、作用机理、以及使用不当时可能带来的诸多弊端和潜在危害。并按赋形及附加剂分类，对常用、新型辅料约五百余种列举实用处方例，分别作了较详尽的介绍。全书约百余万字，附图表三百余幅。书末附有国产辅料品种产地目录，辅料中、英名称索引，便于读者查阅。

概览本书内容，取材较全面而有系统，具有很强的说理性和实用意义。可以认为是著者提供给广大药剂人员的一部有价值的常用参考书，能使人们在制剂领域内扩大视野、开阔思路。对加强我国药用辅料研究、开发、生产、应用和管理工作的提高我国药剂科研究生水平将产生积极的影响。

中国药学会顾问 顾学裘

1990年5月

序 言

药物制剂正在向高、精、尖的目标前进，在研究和生产中，针对药品疗效和毒副作用问题，利用辅料、特别是新型辅料，提高产品质量和生物利用度。创制新剂型，改进主药的药物动力学作用，使药物剂型进入定时、定向、定位、高效的精密化给药新阶段，以适应现代医疗发展的需要。许多最近发展起来的新给药系统，自报产以来，大大提高了医疗用药效果，创造了巨大的社会效益和经济效益。因此，药用辅料应用技术，对于传统剂型制剂的改革和新剂型——亦即新型给药系统的研制，就显得更加迫切需要。

药物剂型都是由主药和辅料所组成，按照医疗所需的作用和要求设计、生产而成。凡是主药都有它的主、副两方面作用。对于患者而言，是如何突出药物的主要作用而降低或消除毒副作用，措施之一，就是利用辅料来控制剂型结构、释药速度及其体内吸收与分布。为了发展新剂型的需要，就有必要采用天然的、或化学合成、半合成等方法、寻求适当的辅料。因此，应将辅料看成是处方组成的一个重要部分，对其物理的、化学的、生物学的性质，以及毒副作用的影响，均应与主药同样认识与要求，已为多数药学工作者所肯定了。

本书系统概括了中外常用制剂辅料，结合我国实际，科学性强。启发读者认识辅料的重要性，并从理论上引导结合具体药物，正确选用辅料。无疑地、本书是国内首次编撰、极有价值的专业用书，将在教学、科研和生产创新上起到推进作用。

本书由张光杰研究员主持和组织编写，张光杰研究员从事药物制剂的理论和实践研究工作达半世纪，为药学事业作出了卓越贡献。参加编写人员都有从事三、四十年以上制剂生产研究工作的丰富实践经验。他们认为辅料问题是发展我国制剂的重要关键，从提高制剂生产技术水平考虑编写了本书。我非常同意他们的作法。

中国药科大学教授 刘国杰
1990年12月30日于南京

前 言

药用辅料是构成药物制剂不可缺少的基本成分，它可以赋予药物制剂型以必要的物理、化学、药理和生物学性质。对于各类药物制剂成型与稳定性、保证药品质量、开发新剂型和新品种、满足医疗使用要求等都起着积极的、关键性的作用。

制剂生产及其应用的实践表明：药物、剂型与临床效果三者密切相关，而辅料则是剂型的一个重要物质条件。一个有药理活性的物质只有配合适宜的辅料，通过合理的生产工艺，制成优良稳定的剂型，才能充分发挥药效、降低毒副作用，适应医疗要求。

近二十年来，制剂研究根据医疗需要利用剂型及辅料控制药物在体内的释放与转运，以达到给药合理化和精密化，于是出现了各种新的给药系统。新型药用辅料特别是高分子化合物的不断涌现，为剂型改进与创新提供了丰富的物质基础。目前各类辅料品种繁多，各具特性。辅料的研究与应用已成为现代制剂生产的重要一环。因此药剂工作者了解有关药用辅料及其应用知识显得特别需要。

有鉴于此，作者等结合多年从事药物制剂科研和生产工作的实践经验，学习并参考了国内外有关资料，编写了《药用辅料应用技术》一书，希望它对读者在设计剂型处方、选用辅料的实际工作中有所助益。

限于作者的水平，难免存在疏漏之处，欢迎专家和读者批评指正。

张光杰
1987年6月

再 版 说 明

本书于 1991 年 12 月出版受到欢迎，成为广大药学工作者案头常备的参考书。1995 年，出版社要求我们再版，鉴于原主编张光杰等几位先生去世，一些编者年事已高，其他编者也忙于研究工作，故而一拖再拖。后在新成立的药物制剂国家工程研究中心的支持下，增加了若干年轻的编者，邀请中国医药工业杂志的总编王其灼先生担任全书的主审，第二版修订工作才得以进行，不想至今已过了 7 年，使很多读者企盼良久，深以为歉。

第二版对全书的章节进行了调整和增补，增加了高分子材料的理化性质及透皮给药系统材料两章，口服缓释、控释辅料合并为一章，增溶剂和助溶剂合成一章，增加了国内外新型的药用辅料品种，删除了第一版的许多重复的内容，对第一版的不当之处进行了修正。

本版特请王其灼先生主审，使全书从内容到体例都更趋严谨。中国医药科技出版社的余晓捷编辑对于全书的再版做了大量的工作，在此一并致谢。

尽管再版工作进行了七年，全书仍是不尽如人意，欢迎专家和读者指正。

侯惠民

2002 年 5 月

目 录

第一章 绪论	(1)
第一节 概述	(1)
第二节 辅料在剂型结构中的作用	(1)
一、一般剂型	(2)
二、缓释剂型	(2)
三、控释给药系统	(4)
四、靶向给药系统	(4)
第三节 辅料对药物制剂稳定性的影响	(4)
一、化学变化	(5)
二、物理变化	(5)
三、微生物污染引起的变化	(5)
第四节 辅料对药物吸收的影响	(6)
一、溶剂	(6)
二、固体制剂辅料	(6)
三、基质	(7)
四、固体分散体辅料	(7)
五、延缓释药的高分子辅料	(8)
六、表面活性剂	(8)
第五节 辅料对药物体内分布的影响	(9)
第二章 药用高分子	(11)
第一节 高分子化合物的分类和聚合反应机制	(11)
一、高分子化合物的分类	(11)
二、连锁聚合反应	(15)
三、逐步聚合反应	(16)
第二节 聚合反应方法	(16)
一、连锁聚合反应的聚合方法	(16)
二、逐步聚合反应的聚合方法	(17)
三、聚合物的加工方法	(17)
第三节 高分子化合物的理化性质	(18)

一、高分子化合物的结构与物理性能	(18)
二、高分子化合物的分子量和分子量分布	(19)
三、高分子溶液的理化性质	(20)
四、高分子材料的力学性质	(21)
第三章 注射剂赋形剂	(22)
第一节 概述	(22)
一、溶剂	(23)
二、注射用灭菌粉末、冻干剂及其赋形剂	(26)
第二节 注射剂赋形剂品种	(29)
一、水性溶剂	(29)
二、非水溶剂品种	(30)
三、注射用灭菌粉末、冻干剂辅料	(46)
第四章 片剂辅料	(53)
第一节 概述	(53)
一、填充剂 (稀释剂)	(53)
二、湿润剂和粘合剂	(54)
三、崩解剂	(55)
四、润滑剂、助流剂和抗粘剂	(56)
五、吸收剂	(58)
六、着色剂和矫味剂	(58)
第二节 片剂辅料品种	(60)
一、填充剂 (稀释剂)	(60)
二、湿润剂和粘合剂	(69)
三、崩解剂	(73)
四、润滑剂、抗粘剂和助流剂	(75)
五、吸附剂	(77)
第五章 薄膜包衣材料	(79)
第一节 概述	(79)
一、薄膜包衣的优点	(79)
二、薄膜包衣材料必须具备的性能	(79)
三、薄膜包衣材料分类	(79)
第二节 薄膜包衣材料品种	(80)
一、纤维素及其衍生物	(80)
二、丙烯酸树脂类	(83)
三、乙烯聚合物及其他类	(88)

第六章 胶囊剂辅料	(91)
第一节 概述	(91)
一、胶囊剂 (硬胶囊剂)	(91)
二、胶丸剂 (软胶囊剂)	(92)
第二节 胶囊剂和胶丸剂辅料品种	(95)
第七章 微囊材料和包合材料	(100)
第一节 微囊材料	(100)
一、概述	(100)
二、囊心物质、包裹材料、作用相和固化剂	(101)
三、微囊的制备法	(102)
第二节 微囊材料品种	(106)
一、水溶性包裹材料	(106)
二、水不溶性包裹材料	(110)
第三节 包合材料	(113)
一、概述	(113)
二、包合材料品种	(114)
第八章 软膏剂基质	(121)
第一节 概述	(121)
一、软膏剂的进展	(121)
二、软膏基质的性能和质量要求	(122)
三、软膏基质的质量检查	(122)
四、软膏基质的类型	(123)
第二节 软膏剂基质品种	(124)
一、天然甘油酯类	(124)
二、烃类	(124)
三、类脂	(126)
四、水包油 (油 / 水) 型基质	(128)
五、油包水 (水 / 油) 型基质	(133)
六、水溶性基质	(135)
第九章 栓剂基质	(141)
第一节 概述	(141)
一、栓剂的作用特点	(141)
二、栓剂的分类	(141)
三、栓剂的形状和大小	(142)

四、栓剂基质·····	(142)
五、栓剂基质理化性质的分析方法·····	(143)
第二节 栓剂基质品种·····	(145)
一、脂肪性基质·····	(145)
二、水溶性基质·····	(151)
第十章 滴丸剂基质·····	(155)
第一节 概述·····	(155)
第二节 滴丸基质品种·····	(155)
第十一章 气雾剂用抛射剂·····	(160)
第一节 概述·····	(160)
一、气雾剂的作用特点·····	(160)
二、气雾剂的组成·····	(160)
第二节 抛射剂品种·····	(167)
一、液化气体抛射剂·····	(167)
二、压缩气体抛射剂·····	(174)
第十二章 透皮给药制剂材料·····	(176)
第一节 概述·····	(176)
一、透皮给药制剂的特点和结构·····	(177)
二、透皮给药制剂中常用的材料·····	(178)
三、增加药物透皮吸收的方法·····	(179)
第二节 透皮给药系统用材料品种·····	(181)
一、化学促渗剂·····	(181)
二、胶粘剂·····	(182)
三、控释膜·····	(185)
第十三章 缓、控释制剂辅料·····	(186)
第一节 概述·····	(186)
一、传统剂型的缺点·····	(186)
二、缓、控释制剂的类型·····	(187)
第二节 缓、控释制剂的辅料·····	(191)
一、天然物辅料及其衍生物·····	(191)
二、纤维素衍生物·····	(200)
三、丙烯酸树脂类·····	(208)
四、聚乙烯类等聚合物·····	(213)
五、其他类·····	(219)

第十四章 抗氧剂和抗氧增效剂	(235)
第一节 概述	(235)
一、氧化作用	(235)
二、药物的主要氧化途径	(236)
三、抗氧剂的作用机制	(237)
四、抗氧剂的化学组成	(237)
五、抗氧增效剂	(238)
第二节 抗氧剂品种	(240)
一、亚硫酸盐	(240)
二、维生素 C 衍生物	(248)
三、硫代化合物	(250)
四、氨基酸类	(256)
五、有机酸类	(261)
六、酚类	(264)
七、胺类	(266)
八、油溶性抗氧剂	(266)
九、螯合剂	(273)
第十五章 助溶剂和增溶剂	(278)
第一节 概述	(278)
一、生成盐类	(278)
二、控制 pH 值	(279)
三、采用复溶剂	(280)
四、加入助溶剂	(280)
五、胶团增溶	(286)
第二节 助溶剂和增溶剂品种	(288)
一、酰胺类及尿素衍生物	(288)
二、胺类	(292)
三、氨基酸类	(294)
四、醇类	(297)
五、无机酸、有机酸及其盐类，糖类，糖酸盐类	(300)
六、其他类	(305)
七、增溶剂品种	(307)
第十六章 乳化剂	(311)
第一节 概述	(311)
一、乳浊液的理论	(311)

二、乳化剂的乳化和稳定作用·····	(312)
三、乳化剂的选择和使用·····	(314)
四、乳化剂的类别·····	(317)
第二节 乳化剂品种·····	(318)
一、天然乳化剂·····	(318)
二、半合成乳化剂·····	(325)
三、阴离子型合成乳化剂·····	(326)
四、非离子型合成乳化剂·····	(330)
第十七章 抑菌防腐剂·····	(344)
第一节 概述·····	(344)
一、常见污染药品的微生物·····	(344)
二、微生物生长的条件·····	(345)
三、防腐剂的作用及其要求·····	(346)
四、防腐剂分类及其用量·····	(347)
第二节 抑菌防腐剂品种·····	(348)
一、酸及其盐类·····	(348)
二、中性类·····	(357)
三、季铵化合物类·····	(362)
第十八章 混悬液稳定剂·····	(366)
第一节 概述·····	(366)
一、混悬液稳定性·····	(366)
二、混悬液的质量控制·····	(368)
三、混悬液稳定剂的分类·····	(370)
四、常用的混悬剂辅料·····	(371)
第二节 混悬液稳定剂品种·····	(372)
一、表面活性剂·····	(372)
二、保护胶体·····	(372)
三、絮凝剂和反絮凝剂·····	(379)
四、其他·····	(379)
第十九章 pH 和等渗调节剂及局部止痛剂 ·····	(383)
第一节 pH 调节剂和缓冲剂 ·····	(383)
一、概述·····	(383)
二、pH 调节剂和缓冲剂品种 ·····	(388)
第二节 等渗调节剂·····	(400)
一、概述·····	(400)

二、等渗调节剂品种·····	(401)
第三节 局部止痛剂·····	(402)
一、概述·····	(402)
二、局部止痛剂品种·····	(403)
第二十章 矫味剂和着色剂·····	(407)
第一节 概述·····	(407)
一、药剂的矫味和矫臭·····	(407)
二、药剂的着色·····	(412)
第二节 矫味剂和着色剂品种·····	(414)
一、甜味剂·····	(414)
二、芳香剂·····	(419)
三、色素品种·····	(436)
英文索引·····	(452)
中文索引·····	(463)

第一章 绪 论

第一节 概 述

药物是一类能改变人体局部或全身的某些生理功能而常用于保健、预防、诊断、治疗疾病的生物活性物质，其中也包括一些处理或防止环境、用具污染的物质，如消毒剂、灭菌剂等。药物可来源于天然的动物、植物、矿物，也可用人工方法通过生物发酵提取或化学合成制得。这些物质大多因使用不便或其他原因而不能直接使用，一般称为医药原料，或简称原料药。

为适应医疗用药需要，将原料药制成各种便于给药的“形态”后，就总称为药物制剂(pharmaceutics)，简称制剂。

制剂有法定制剂、配方制剂和新药三类。法定制剂是按药典的规定生产，且其名称、成分、规格、质量等符合药典标准者；配方制剂或称方剂是根据医师处方临时调配，或在医院药剂室中按“协定处方”配制备用的制剂；新药是指新研制的，经医药监督管理部门及药检部门审查批准生产的药品。

制剂按不同给药方式、不同给药部位等而制成的不同“形态”称为剂型(dosage form)，如口服有片剂、胶囊剂、丸剂等，外用有软膏剂、栓剂等，注射有注射剂、输液等。剂型的种类很多，近年来又新发展了很多有特殊性能的新剂型。

药物被加工成各种类型的制剂时，绝大多数都要加入一些无药理作用的辅助物质，称为药用辅料(pharmaceutical aids)，使制剂成品具有某些必要的理化特征或生理特性。辅料一词实际上是很多物质的总称，包括范围很广，品种繁多，多数品种间不具有共同性。根据剂型的不同、医疗要求的不同以及加入的目的不同，辅料一般分为赋形剂(excipient, vehicle)和附加剂(additive)两大类。赋形剂主要作为药物载体，赋予各种制剂以一定的形态和结构；附加剂主要用以保持药物和剂型的质量稳定性。

第二节 辅料在剂型结构中的作用

为发展疗效更好、安全性更高的给药方法，医药工作者一直在为药物剂型的改进和创新不断探索。各种新型辅料的涌现为剂型结构的改变提供了有利条件。近年来具有独特性能的“给药系统”已经投放市场，标志着药物剂型的研究和生产有了重大的进展。目前药物剂型已发展为四大类：第一类为一般剂型，如片剂、丸剂、胶囊剂、注射剂等；第二类为缓释剂型；第三类为控释给药系统；第四类为靶向给药系统^[1]。

一、一般剂型

一般剂型有固体、半固体、溶液、乳浊液、混悬液等多种形态,同一剂型也有不同组成、结构和性质。如片剂有一般内服片、双层片、含片、泡腾片、植入片等;包衣片剂有糖衣、薄膜衣、胃溶性、胃肠两溶性、肠溶性、不溶渗透性;胶囊剂有硬胶囊、软胶囊(胶丸);软膏剂有油脂性、乳剂型、水溶性;栓剂有油脂性及水溶性;乳剂有 O/W 型、W/O 型以及复合乳剂等。都是应用不同的赋形剂、附加剂等辅料结合相应工艺来构成特有的剂型。

任何剂型都必须根据给药途径、医疗要求、生理适应性,特别是药物的溶解度、晶态、结晶大小、稳定的 pH 范围、对氧敏感性等理化性质来选择适宜辅料,并研究药物与辅料之间可能发生的相互作用以及辅料对最终产品的质量影响,以获得一个稳定、有效而且安全的剂型。辅料的选择和应用适当与否,往往是决定剂型结构优劣的关键。

二、缓释剂型^[2,3]

缓释制剂主要应用药代动力学的原理,通过制剂工艺学的方法选择适宜辅料合理设计剂型,延缓药物从该剂型中释放速率,使吸收徐缓,产生较平稳的血药浓度,以延长药物作用时间。

(一) 延缓吸收

长效肌肉注射剂大都用油类或高分子化合物为赋形剂来延缓药物吸收,使药物在注射部位组织的吸收变慢,以延长其作用。如苯甲酸雌二醇油注射液药效可维持 2~5 天,戊酸雌二醇油注射液药效可维持 10~20 天。又如明胶用于肝素、维生素 B₁₂ 等注射剂;PVP 用于肾上腺皮质激素、脑垂体后叶素、可的松、局部麻醉药以及前列腺素等;羧甲基纤维素钠用于盐酸普鲁卡因等,均起延效作用。

(二) 延缓释放

延缓释药的方法大多应用于口服制剂,使药物到达肠胃后由剂型中缓慢释放以供吸收。其中包括化学方法和药剂学方法,以后者应用较多,主要为油脂性、溶蚀性、亲水胶体、肠溶性等高分子辅料作阻滞剂,来延缓药物释放。其处方组成一般包括两个部分:能立即建立治疗血药浓度的“速释”部分和具有与药物释放、吸收、消除速度相等的“缓释”或“恒释”部分。它们的配比是根据药物在体内吸收消除的代谢动力学规律设计的,因此避免了一般制剂所共有的血药浓度时高时低的“峰谷”现象,不仅能较长时间稳定地维持治疗所必需的血药浓度,而且其血药浓度与发生毒副作用的最低浓度距离较远,保证了用药的安全有效。为了延长药物释放和吸收而设计的剂型根据所用辅料种类和工艺学方法不同而有各种类型结构。

1. 油脂性分散型

亦称侵蚀性骨架制剂,系将药物溶解或混悬于固体脂肪、蜡类、脂类等辅料中,制成大小适宜、含有药物的颗粒,将使用不同用量阻滞剂所得的不同释药速率的颗粒按一定比例混合装入胶囊或压片而成。脂类、蜡类辅料是低熔点高分子物质,不溶于水,但受 pH 和酶的影响可表现出不同程度的水解现象,一般在酸性介质中比较稳定,而碱性胰酶液可

加速蜡的水解。分散于油脂性辅料中的药物可通过片剂或颗粒的连续表面蚀解而释放,也可以通过不溶性孔隙结构扩散而释放。

2. 高分子阻滞型

这是将药物分散于具有无数孔隙结构的惰性高分子化合物、多孔性载体、亲水凝胶体或在胃肠道内能膨胀成海绵状结构的辅料中所制成的缓释制剂。胃肠液渗入骨架孔隙后,药物溶解并通过骨架中错综复杂的具极细孔径的通道,缓缓向外扩散而释放。有以下几种结构类型:

(1) 塑料骨架型 系将药物粉末与塑料粉末混合或将药物与塑料的固体分散体制粒压片,适用于水溶性药物口服片剂。常用的塑料有聚乙烯类、聚丙烯酸类、纤维素衍生物类等。

(2) 多孔性载体型 系将药物嵌入惰性多孔性载体如硅橡胶、聚二甲基硅氧烷或经特殊处理的二氧化硅、氧化铝中而制成的一种缓释剂型,有口服片剂、腔内埋植剂等,较多用于制成含避孕药的植入膜、植入胶囊、子宫环等。一种以聚二甲基硅氧烷为载体含18-甲基炔诺酮 50mg 的阴道环,体内试验表明,释药量可达避孕要求。

(3) 亲水凝胶型 系将药物与在胃肠道中不易被消化的亲水性胶体物质如纤维素衍生物、PVP、PEG 6000、聚羧乙烯等及适量的易溶性稀释剂(如乳糖)混匀制粒压片而得,口服后片剂表面的药物很快溶解,然后片剂与消化液交界处的胶体由于水合作用呈凝胶状,在片剂周围形成一层稠厚的凝胶屏障,从而使片中药物通过凝胶层缓慢向外扩散至表面层消化液中,以达到延缓药物释放的目的。凝胶的种类和浓度对药物的释放速度和持续时间有显著的影响,同时药物本身的理化性质对释放也有一定影响,药物应有较大的水溶性。

(4) 海绵型 根据所用辅料和工艺不同而有两种剂型结构:一种是将药物溶解或混悬于虫胶-聚乙二醇或聚醋酸乙烯-聚乙二醇溶液中,加入赋形剂后制成明胶胶丸。这种制剂与消化液接触后,胶壳很快溶解,胶囊内的填充物吸水膨胀形成海绵状结构,药物从海绵小孔通道中向外扩散释放,开始阶段由于形成的海绵状壁较薄,因此药物释放迅速,以后随着海绵状壁厚度的增加,药物释放逐渐减慢。另一种是将药物与海藻酸钠、磷酸氢钙及其他赋形剂混匀,将此干燥混合物压制成片剂,如硝酸异山梨醇长效片。这种片剂与消化液接触后,海藻酸钠、磷酸氢钙逐渐被溶解并相互作用,自片剂外部向内部逐渐形成海藻酸钙的海绵层结构,药物通过溶解、扩散逐渐释放出来。

3. 包衣型

系用水不溶性但可被水渗透的高分子材料的有机溶液在药物颗粒或片剂表面包上缓释衣,以达到缓释目的。常用的包衣材料有聚丙烯酸树脂等以及一些天然产品,如虫胶、纤维素衍生物、蜂蜡、单硬脂酸甘油酯等。用塑料作包衣材料时其药物释放主要依靠渗透、扩散,释放速度取决于药物溶解度和包衣膜上孔径大小、数量及膜的厚度;若用蜂蜡、虫胶、脂肪酸酯包衣,其药物是通过包衣层的溶蚀和水分的渗透而释放的,释放速度取决于包衣的组成及厚度。

4. 缓释微囊微球型

利用微型包囊技术将药物包裹在微囊内,然后制成胶囊剂、片剂、丸剂或混悬剂,药