



# 药剂学

周建平 主编



化学工业出版社  
教材出版中心

# 药 剂 学

周建平 主编



化学工业出版社

教材出版中心

·北京·

(京)新登字 039 号

图书在版编目 (CIP) 数据

药剂学/周建平主编. —北京: 化学工业出版社,  
2004. 2

高等学校教材

ISBN 7-5025-5046-1

I. 药… II. 周… III. 药剂学-高等学校-教材  
IV. R94

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2004) 第 003788 号

---

药 剂 学

周建平 主编

责任编辑: 何曙霓

责任校对: 洪雅妹

封面设计: 潘 峰

\*

化学工业出版社 出版发行  
教材出版中心

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

发行电话: (010) 64982530

<http://www.cip.com.cn>

\*

新华书店北京发行所经销

北京红光印刷厂印刷

北京红光印刷厂装订

开本 787 毫米×1092 毫米 1/16 印张 19¼ 字数 472 千字

2004 年 3 月第 1 版 2004 年 3 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-5046-1/G · 1355

定 价: 31.00 元

---

版权所有 违者必究

该书如有缺页、倒页、脱页者, 本社发行部负责退换

# 前 言

任何一种药物用于临床时都必须制成适合于患者使用的给药形式（即剂型），任何一种用于临床给药的具体品种（即制剂）必须具备安全、有效、稳定三大基本要素，药剂学即是研究药物制剂和剂型的综合性应用技术学科，其主要内容包括：配制理论、生产技术、质量控制和合理应用等。药剂学不仅涉及学科知识较多，使用范围广，且发展速度快，特别是速效、缓控释、靶向制剂等新技术的发展和创断，进一步提高了药剂学在国民经济中的地位和重要性。

药剂学是药学类专业的主干课程之一，对涉及药品研究、开发、生产、使用，质量控制，市场流通、监督和管理等有关人员都必须具备一定的药剂学知识。目前，我国成人教育事业正在蓬勃发展之中，但相应教材的严重缺乏在一定程度上限制了其发展速度，为了更好地实现成人教学的培养目标和要求，提高成人教学效果以及人才培养质量，本教材编写组坚持以基础性知识为主，发展性知识为辅，结合适用性和国内现行的执业药师制度的原则进行编写。

本教材以药物制剂和剂型为主线，共分二十一章。第一章～第七章主要介绍药剂学的一些基本概念、技术以及具有共性的基本常识；第八章～第十四章主要讲述各大剂型的含义、特点、质量要求、处方及其制备工艺等基础性知识；第十五章～第十七章主要阐述药物新制剂和新剂型等发展性知识；第十八章～第二十一章简单介绍有关药师必须掌握的一般性知识。

本教材适合于药学类成人专科和本科（专升本）学员的学习，其中，第一章～第十四章、第十八章～第二十一章内容主要适合于专科学员，第十五章～第十七章内容主要适合于本科学员。鉴于药剂学知识的广泛性和发展性，限于编者的水平和时间仓促，错误之处在所难免，诚请读者批评指正。

编 者

2003年12月

## 内 容 简 介

药剂学是药学类专业的主干课程之一。对涉及药品研究、开发、生产、使用、质量控制、市场流通、监督和管理的科技人员都必须具备一定的药剂学知识。本教材以药物制剂与剂型为主线、分二十一章讲述：第一章~第七章介绍药剂学的基本概念、技术和共性常识；第八章~第十四章介绍各大剂型含义、特点、质量要求、处方及制备工艺等基础性知识；第十五章~第十七章阐述药物新剂型及其发展；第十八章~第二十一章简单介绍药师必须掌握的一般性知识。

本教材适合于药学、成人教育（包括专科和本科）、函授以及药师自学考试；也适合于药学专业高等、高职院校的师生参考。

# 目 录

<b>第一章 总论</b> .....	1	三、外观与质量间的关系	17
<b>第一节 概述</b> .....	1	<b>第二节 药物制剂的色香味</b> .....	17
一、药剂学的定义、特点和范畴 .....	1	一、色香味的作用与意义 .....	18
二、药剂学的主要任务及研究内容 .....	1	二、生理基础 .....	18
三、药剂学在药学实践和国民经济中的		三、色香味调配的基本原则 .....	18
地位、作用及特点 .....	3	四、常用矫味剂 .....	19
<b>第二节 药剂学的发展和任务</b> .....	3	五、常用着色剂 .....	20
一、药剂学的发展简史 .....	3	六、掩味技术的应用 .....	20
二、药剂学分支学科的发展 .....	5	<b>第四章 药品的包装</b> .....	22
三、药剂学的主要任务 .....	6	<b>第一节 包装的基本概念</b> .....	22
<b>第三节 药典、处方和 GMP</b> .....	8	一、药品包装的定义 .....	22
一、药典 .....	8	二、药品包装的作用 .....	22
二、《中华人民共和国药典》与药品标准	8	<b>第二节 药包材</b> .....	24
三、其他国家药典 .....	8	一、药包材的种类 .....	24
四、处方 .....	8	二、药包材的质量要求 .....	28
五、GMP 等其他法规 .....	9	<b>第三节 药品软包装</b> .....	29
<b>第二章 药物制剂及剂型</b> .....	10	一、铝塑泡罩包装 .....	29
<b>第一节 剂型的分类及重要性</b> .....	10	二、复合膜条形包装 .....	30
一、剂型的分类 .....	10	三、输液软袋包装 .....	31
二、剂型的重要性 .....	11	<b>第四节 药品包装的有关法规</b> .....	33
<b>第二节 药物制剂和剂型的发展历程</b> .....	11	一、《中华人民共和国药品管理法》 .....	33
一、基本理论的发展 .....	11	二、《药品包装管理办法》 .....	33
二、基础工业的发展 .....	12	三、《药品包装用材料、容器生产管	
三、药物制剂和剂型的发展历程 .....	12	理办法》(试行) .....	33
<b>第三节 药物制剂与多学科</b> .....	13	四、《药品包装用材料、容器管理办	
一、物理化学、有机化学、分析化学 .....	13	法》(暂行) .....	33
二、药理学、生理学、临床医学 .....	13	五、《直接接触药品的包装材料和容	
三、流变学、粉体学、动力学 .....	14	器管理办法》 .....	34
<b>第四节 常用制剂通则</b> .....	14	六、《药品包装、标签和说明书管理	
一、片剂通则 .....	14	规定》(暂行) .....	34
二、注射剂通则 .....	14	七、《非处方药专有标识管理规定》	
三、胶囊剂通则 .....	14	(暂行) .....	34
四、软膏剂通则 .....	15	八、药包材国家标准 .....	34
五、栓剂通则 .....	15	<b>第五章 药物制剂的稳定性</b> .....	35
<b>第三章 药物制剂的外观与色香味</b> .....	16	<b>第一节 概述</b> .....	35
<b>第一节 药物制剂的外观</b> .....	16	一、研究药物制剂稳定性的意义 .....	35
一、外观的作用与意义 .....	16	二、药物制剂稳定性研究范围 .....	35
二、各剂型外观特征的识别 .....	16	三、化学动力学 .....	35

第二节 药物制剂中药物化学降解途径 .....	36	四、微囊的性质 .....	64
一、水解 .....	36	五、微囊质量的评价 .....	66
二、氧化 .....	36	六、微囊在制剂学上的应用 .....	66
三、其他反应 .....	37	第三节 环糊精包合物 .....	67
第三节 影响药物制剂降解的因素及稳定		一、基本概念 .....	67
化方法 .....	37	二、包合物分类 .....	67
一、处方因素 .....	37	三、包合材料 .....	67
二、非处方因素 .....	39	四、常用的包合技术 .....	68
第四节 固体制剂稳定性的特点 .....	40	五、包合机理及其影响因素 .....	68
一、固体药物与固体制剂稳定性的一般		六、包合物的验证 .....	70
特点 .....	40	七、环糊精包合物在药剂学中的应用 .....	70
二、药物晶型与稳定性的关系 .....	40	<b>第八章 液体制剂</b> .....	72
三、固体药物之间的相互作用 .....	40	第一节 概述 .....	72
四、固体药物分解中的平衡现象 .....	40	一、液体制剂的定义 .....	72
第五节 药物稳定性试验方法 .....	41	二、液体制剂的分类 .....	72
一、影响因素试验 .....	41	三、液体制剂的特点和质量要求 .....	72
二、加速试验 .....	41	四、分散度与疗效 .....	73
三、长期试验 .....	42	第二节 流变学概述 .....	73
四、稳定性重点考查项目 .....	42	一、牛顿流体 .....	74
五、经典恒温法 .....	42	二、非牛顿流体 .....	74
<b>第六章 灭菌与空气净化技术</b> .....	43	第三节 常用溶剂 .....	75
第一节 灭菌与无菌技术 .....	43	一、极性溶剂 .....	75
一、概述 .....	43	二、非极性溶剂 .....	76
二、物理灭菌技术 .....	43	第四节 增加药物溶解度的方法 .....	76
三、化学灭菌法 .....	46	一、溶解和溶解度 .....	76
四、无菌操作法 .....	47	二、增加药物溶解度的方法 .....	77
五、灭菌参数 ( $F$ 值和 $F_0$ 值) .....	47	第五节 表面活性剂 .....	78
第二节 空气净化技术 .....	49	一、定义 .....	78
一、洁净室空气净化标准 .....	49	二、常用的表面活性剂 .....	79
二、浮尘浓度测定方法和无菌检查法 .....	50	三、表面活性剂的性质 .....	80
三、洁净室的空气净化技术 .....	51	四、表面活性剂在药剂中的应用 .....	82
四、洁净室的设计 .....	52	五、表面活性剂的生物学性质 .....	83
<b>第七章 制剂新技术</b> .....	56	第六节 溶液型液体制剂 .....	83
第一节 固体分散技术 .....	56	一、溶液剂 .....	83
一、载体 .....	56	二、芳香水剂 .....	84
二、制备方法 .....	57	三、糖浆剂 .....	84
三、固体分散体的类型 .....	58	四、酏剂 .....	85
四、固体分散体的物相鉴定 .....	58	第七节 胶体溶液 .....	85
五、固体分散体的速效与缓效原理 .....	59	一、分子胶体 (高分子溶液) .....	85
六、固体分散体的老化 .....	60	二、微粒胶体 .....	86
第二节 微型包囊技术 .....	60	三、胶体溶液型液体制剂 .....	87
一、药物微囊化的特点 .....	60	第八节 乳剂 .....	88
二、囊心物与囊材 .....	60	一、乳剂的形成 .....	89
三、制备方法 .....	61	二、决定乳剂类型的因素 .....	90

三、乳化剂 .....	90	四、滴眼剂处方及制备工艺分析 .....	131
四、乳化剂的选择和使用 .....	91	第七节 其他灭菌与无菌制剂 .....	133
五、乳剂的稳定性 .....	91	一、体内植入制剂 .....	133
六、乳剂的制备 .....	92	二、创面用制剂 .....	134
七、乳剂的质量评价 .....	94	三、手术用制剂 .....	134
八、复合乳剂 .....	94	<b>第十章 固体制剂</b> .....	136
九、微型乳剂 .....	95	第一节 概述 .....	136
第九节 混悬剂 .....	96	一、固体制剂的口服吸收过程 .....	136
一、稳定性 .....	96	二、固体制剂的溶出 .....	136
二、混悬剂的稳定剂 .....	98	第二节 粉体学概论 .....	137
三、混悬剂的制备 .....	99	一、粉体粒子大小及其测定 .....	137
四、混悬剂质量评价方法 .....	99	二、粉体的基本参数及性质 .....	139
<b>第九章 灭菌制剂与无菌制剂</b> .....	101	第三节 常用固体制剂辅料 .....	140
第一节 概述 .....	101	一、制剂的辅料 .....	140
一、灭菌制剂与无菌制剂的定义与分类 .....	101	二、薄膜包衣材料 .....	145
二、冷冻干燥技术 .....	101	第四节 增加药物溶出度的方法 .....	146
第二节 注射剂 .....	103	一、溶出度及影响溶出度的因素 .....	146
一、注射剂的分类和给药途径 .....	103	二、增加药物溶出度的方法 .....	146
二、注射剂的特点和一般质量要求 .....	104	第五节 散剂 .....	148
三、注射剂处方组分 .....	105	一、散剂的定义、分类与特点 .....	148
四、注射剂的等渗与等张调节 .....	107	二、散剂的制备 .....	148
第三节 注射剂的制备 .....	109	三、实例 .....	151
一、注射剂的制备工艺流程图 .....	109	第六节 颗粒剂 .....	151
二、注射用水的质量要求及其制备 .....	110	一、颗粒剂的制备 .....	152
三、热原 .....	112	二、颗粒剂的质量检查 .....	152
四、注射剂的制备 .....	113	三、举例 .....	152
五、注射剂的质量检查 .....	120	第七节 胶囊剂 .....	153
六、典型注射剂处方与制备工艺分析 .....	120	一、硬胶囊剂 .....	153
第四节 输液 .....	122	二、软胶囊 .....	156
一、输液的分类与质量要求 .....	122	三、肠溶胶囊剂 .....	159
二、输液的制备 .....	122	四、胶囊剂的质量检查 .....	159
三、输液的质量检查 .....	123	<b>第十一章 片剂</b> .....	161
四、存在的主要问题及解决方法 .....	124	第一节 概述 .....	161
五、输液的包装、运输与贮存 .....	124	一、片剂的特点 .....	161
六、典型输液处方及制备工艺分析 .....	124	二、片剂的分类与质量要求 .....	161
第五节 注射用无菌粉末 .....	127	第二节 片剂成型理论 .....	163
一、注射用无菌分装产品 .....	127	一、片剂成型 .....	163
二、注射用冻干制品 .....	128	二、影响片剂成型的因素 .....	164
第六节 眼用制剂 .....	129	三、压片过程中可能出现的问题及解决方法 .....	165
一、眼用药物的吸收途径及影响吸收的因素 .....	129	第三节 片剂的制备及包衣 .....	166
二、滴眼剂与洗眼剂 .....	130	一、片剂的制备 .....	166
三、眼用液体型制剂的制备 .....	131	二、片剂的包衣 .....	172
		第四节 片剂的质量评价 .....	177



一、外观 .....	177	三、栓剂的质量评价 .....	196
二、片重差异 .....	177	四、包装与贮存 .....	196
三、硬度与脆碎度 .....	177	五、栓剂举例 .....	197
四、崩解时限 .....	177	第二节 五官科制剂 .....	197
五、含量均匀度 .....	178	一、眼用制剂 .....	197
六、溶出度 .....	178	二、鼻用制剂 .....	198
七、释放度测定法 .....	178	三、口腔用制剂 .....	199
八、卫生学检查 .....	178	四、耳用制剂 .....	199
第五节 片剂的处方设计及分析 .....	178	<b>第十四章 半固体制剂及其他制剂</b> .....	200
一、处方和工艺设计前工作 .....	178	第一节 定义、分类与特点 .....	200
二、拟定处方, 确定生产工艺 .....	179	一、定义 .....	200
三、片剂处方举例与分析 .....	179	二、特点及分类 .....	200
<b>第十二章 气雾剂、干粉吸入剂与喷</b>		第二节 软膏剂 .....	201
<b>雾剂</b> .....	184	一、质量要求 .....	201
第一节 概述 .....	184	二、常用基质 .....	201
一、气雾剂的特点 .....	184	三、软膏剂的制备及举例 .....	204
二、气雾剂的分类 .....	184	四、软膏剂的质量评定 .....	205
第二节 呼吸系统对药物的吸收 .....	185	五、软膏剂的包装与贮藏 .....	207
一、药物在肺部的吸收 .....	185	第三节 凝胶剂 .....	207
二、影响药物吸收的因素 .....	185	一、水性凝胶基质 .....	207
三、药物在肺部吸收的研究模型 .....	185	二、水凝胶剂的制备及处方举例 .....	208
第三节 气雾剂的组成 .....	185	第四节 硬膏剂 .....	208
一、抛射剂 .....	186	一、硬膏剂的制备 .....	208
二、药物与附加剂 .....	187	二、质量要求 .....	210
三、耐压容器 .....	187	第五节 涂膜剂 .....	210
四、阀门系统 .....	187	一、基本组成 .....	210
第四节 气雾剂的制备 .....	188	二、制备方法 .....	210
一、气雾剂的处方 .....	188	第六节 膜剂 .....	210
二、气雾剂的制备工艺 .....	189	一、成膜材料基本质量要求 .....	210
三、常用气雾剂灌装设备 .....	189	二、常用成膜材料 .....	211
第五节 气雾剂的质量检查 .....	190	三、膜剂的基本组成 .....	211
一、安全、漏气检查 .....	190	四、制备工艺 .....	211
二、喷射剂量与喷次检查 .....	190	<b>第十五章 缓释与控释制剂</b> .....	213
三、喷射速度检查 .....	190	第一节 概述 .....	213
四、雾粒大小的测定 .....	190	一、缓释、控释制剂的定义 .....	213
第六节 干粉吸入剂 .....	190	二、缓释、控释制剂的特点 .....	213
一、干粉吸入剂的处方 .....	191	第二节 缓释与控释制剂的类型 .....	214
二、干粉吸入剂装置 .....	191	一、口服缓释、控释制剂类型 .....	214
三、吸入方式及体外流速的评价 .....	192	二、腔道和黏膜用控释制剂 .....	215
第七节 喷雾剂 .....	192	三、注射控释制剂 .....	215
<b>第十三章 栓剂与五官科制剂</b> .....	193	四、植入制剂 .....	215
第一节 栓剂 .....	193	第三节 缓释、控释制剂的释药原理和	
一、栓剂基质 .....	193	方法 .....	216
二、栓剂的处方设计与制备工艺 .....	195	一、溶出原理 .....	216

二、扩散原理 .....	216	二、栓塞靶向技术和制剂 .....	244
三、溶蚀与溶出、扩散相结合 .....	217	三、热敏靶向技术和制剂 .....	244
四、渗透压原理 .....	218	四、pH 敏感靶向技术和制剂 .....	244
五、离子交换原理 .....	218	<b>第十八章 浸出制剂</b> .....	246
<b>第四节 口服缓释、控释制剂的设计</b> .....	219	<b>第一节 概述</b> .....	246
一、设计口服缓释、控释制剂应考虑的因素 .....	219	一、定义与分类 .....	246
二、口服缓释、控释制剂的设计 .....	221	二、药材成分与疗效 .....	246
<b>第五节 口服缓释、控释制剂的制备</b> .....	221	三、浸出制剂的特点 .....	247
一、缓释、控释制剂的辅料 .....	221	<b>第二节 浸出溶剂</b> .....	247
二、缓释、控释制剂的制备 .....	222	一、常用浸出溶剂 .....	247
<b>第六节 口服缓释、控释制剂的体内外评价</b> .....	225	二、浸出辅助剂 .....	248
一、体外释放度试验 .....	225	<b>第三节 浸出原理</b> .....	248
二、体内试验 .....	226	一、浸出过程 .....	248
<b>第十六章 透皮吸收制剂</b> .....	227	二、影响浸出的因素 .....	250
<b>第一节 特点与分类</b> .....	227	<b>第四节 浸出方法</b> .....	251
一、特点 .....	227	一、药材品质检查 .....	251
二、分类 .....	227	二、药材的预处理 .....	251
<b>第二节 透皮促渗技术</b> .....	228	三、浸出方法 .....	251
一、渗透促进剂在 TTS 中的应用 .....	229	<b>第五节 常用剂型</b> .....	253
二、离子导入技术在 TTS 中的应用 .....	230	一、汤剂与中药合剂（口服液） .....	253
<b>第三节 透皮给药实验研究技术</b> .....	230	二、酒剂 .....	254
一、渗透装置 .....	230	三、酊剂 .....	254
二、扩散液和接收液 .....	231	四、流浸膏剂 .....	254
三、皮肤样品 .....	231	五、浸膏剂 .....	254
<b>第四节 TTS 的制备方法和常用材料</b> .....	231	<b>第六节 浸出制剂的质量控制</b> .....	254
一、常用材料 .....	231	一、药材的来源、品种与规格 .....	254
二、TTS 的制备方法 .....	233	二、制法规范 .....	254
<b>第五节 TTS 质量评价</b> .....	234	三、理化标准 .....	255
一、释放速率、透皮速率的测定 .....	234	四、卫生学标准 .....	256
二、粘贴性能的测定 .....	234	<b>第十九章 生物技术药物制剂</b> .....	257
三、含量与生物利用度测定 .....	235	<b>第一节 概述</b> .....	257
<b>第十七章 靶向制剂</b> .....	236	一、生物技术 .....	257
<b>第一节 被动靶向技术</b> .....	236	二、生物技术药物 .....	257
一、脂质体 .....	236	三、生物技术药物的特点与制剂研究 .....	258
二、乳剂 .....	240	<b>第二节 蛋白质的结构与理化性质</b> .....	258
三、微球 .....	241	一、蛋白质分子结构 .....	258
四、纳米囊和纳米球 .....	242	二、蛋白质的结构与功能的关系 .....	259
<b>第二节 主动靶向技术</b> .....	243	三、蛋白质的一般理化性质 .....	259
一、修饰的药物载体 .....	243	<b>第三节 蛋白质药物的不稳定性</b> .....	260
二、靶向前体药物 .....	243	一、蛋白质的化学不稳定性 .....	260
<b>第三节 物理化学靶向制剂</b> .....	244	二、蛋白质的物理不稳定性 .....	260
一、磁性靶向技术和制剂 .....	244	<b>第四节 蛋白质药物制剂的处方与工艺</b> .....	261
		一、蛋白质类药物制剂处方举例 .....	261
		二、蛋白质类药物液态制剂的稳定化	

方法 .....	262
三、蛋白质类药物固态制剂的稳定性 与工艺 .....	262
第五节 蛋白质、多肽药物的新给药 系统 .....	264
一、蛋白质、多肽药物的注射给药 系统 .....	264
二、蛋白质、多肽药物的非注射给 药系统 .....	265
三、蛋白质、多肽药物的新给药载 体举例 .....	265
<b>第二十章 药物制剂的体内吸收及生物     利用度 .....</b>	<b>268</b>
第一节 药物的吸收 .....	269
一、胃肠道给药 .....	269
二、影响胃肠道吸收的因素 .....	270
三、注射给药 .....	273
第二节 剂型与药物吸收 .....	274
一、溶液型制剂 .....	275
二、混悬剂 .....	275
三、乳剂 .....	275
四、散剂与胶囊剂 .....	276
五、片剂 .....	276
六、缓、控释制剂 .....	276
七、辅料的影响 .....	276

第三节 药物的分布、代谢、排泄 .....	277
一、药物分布 .....	277
二、药物代谢 .....	280
三、药物排泄 .....	280
第四节 生物利用度 .....	281
一、生物利用度的概念 .....	281
二、吸收程度 .....	282
三、药物制剂人体生物利用度和生物等 效性试验设计 .....	282
<b>第二十一章 药物制剂的配伍变化与相     互作用 .....</b>	<b>285</b>
第一节 配伍变化的类型 .....	285
一、疗效配伍变化 .....	285
二、物理配伍变化 .....	285
三、化学配伍变化 .....	285
第二节 物理化学配伍变化 .....	285
一、物理化学配伍变化现象 .....	286
二、注射剂的物理化学配伍变化 .....	287
第三节 药物相互作用 .....	289
一、药物动力学方面的相互作用 .....	289
二、药效学相互作用 .....	291
第四节 配伍变化处理原则与方法 .....	291
一、处理原则 .....	291
二、处理方法 .....	291
<b>主要参考文献 .....</b>	<b>293</b>

# 第一章 总 论

## [学习要求]

1. 掌握药剂学、药典、处方等基本概念；
2. 熟悉药剂学的主要任务及研究内容；
3. 了解药剂学的发展和分支学科；
4. 了解有关药品法律文件的意义。

## 第一节 概 述

### 一、药剂学的定义、特点和范畴

药剂学 (pharmaceutics) 是研究药物剂型的配制理论、生产技术、质量控制及合理应用等内容的一门综合性技术科学。药剂学主要由制剂学和调剂学两部分组成, 制剂学是以研究药物制剂的生产工艺和理论以及质量控制为主要内容的科学, 调剂学是以研究方剂调配、服用等有关技术和理论为主要内容的科学。药剂学的特点是密切结合现代化的生产实践和医疗应用实践, 将药物设计制备成安全、有效、稳定的临床给药形式, 满足患者临床使用, 以利于药物最大限度地达到医疗、诊断和预防的目的。

药剂学是既涉及药品生产又涉及药品应用的一门科学, 是以数学、物理化学、有机化学、生物化学、药理学、生物学以及医学基础学科 (如生理学、解剖学、病理学、临床治疗学等) 理论为基础, 结合具体药物的体内外性质、作用机理、临床特殊要求等, 研究药物制剂的设计理论、生产技术、质量控制以及合理、方便用药。随着现代科学技术的发展, 基础学科的进一步深入研究和各学科间的相互渗透, 在近 20~30 年内, 药剂学制备理论及技术取得了突破性的发展, 如缓控释理论、透皮释药理论、脉冲释药及靶向理论等基础理论的建立, 使得药物制剂的研究开发进入了一个崭新的发展时期, 其研究内容更加丰富深入, 涉及领域更为广泛, 新制剂、新剂型层出不穷。

任何经化学、生物合成或提取、精制的药物, 在供临床使用前都必须制成适合于医疗、诊断和预防应用的形式, 称为剂型 (dosage-form), 如注射剂、片剂、胶囊剂、丸剂、气雾剂、栓剂、软膏剂、贴剂等。剂型属于集合名词, 其中任何一个具体品种称为制剂 (preparations), 如阿司匹林片、葡萄糖注射剂、东莨菪碱贴剂等。按医师处方专为某一患者调制并明确指明用法和用量的药剂称为方剂。方剂一般在医院药房中调制, 质量控制标准和方法一般由医院药剂科制定; 制剂主要在制药企业生产, 部分在医院制剂室制备, 其处方、制备工艺及质量标准必须符合国家药典、部颁标准及其他法定文件或标准。随着医药工业的发展及药品管理法规的实施, 绝大部分药物制剂均在制药企业中生产, 故以工业化制剂为主要讲述内容是本教材的宗旨。

### 二、药剂学的主要任务及研究内容

药剂学的基本任务是研究将药物制成适宜的剂型, 确保以高质量的药剂满足医疗卫生的需要。其根本任务是研究提高药物制剂的生产水平和在临床治疗中的应用水平。鉴于药物种

种类繁多，药物制剂及剂型日趋复杂，药剂学的任务日益加重，根据我国制剂工业发展现状，结合国内外药剂学发展趋势，与创制现代化制剂密切相关的药剂学的主要任务及研究内容可概述如下。

### 1. 基本理论的创建

药剂学的发展必须建立在一定的理论基础上，没有理论基础的研究必将事倍功半，基本理论的研究涉及到各有关学科的发展，采纳基础学科的有关研究成果并与本学科研究成果有机结合，是创建药剂学基本理论的有效途径。如化学动力学对提高药物制剂稳定性的预测及质量控制；体内药理学对药物制剂的生物学特性及质量评价；增溶、助溶以及片剂成型理论对液体、固体药剂的制备；缓控释、透皮及时辰药理学等理论对缓控释制剂、透皮给药制剂及脉冲给药制剂等新型药物传递系统（drug delivery system）的研究、开发等，均奠定了理论基础。

### 2. 生产技术的创新

药剂学研究的核心内容是药物制剂的处方及其制备工艺设计，以及高效率生产技术的推广，这对全面改进药物制剂生产和提高产品质量具有一定的指导意义。如微粉化技术，固体分散技术，微囊化技术，环糊精包合技术等对促进和控制药物释放和吸收速率；干法制粒技术，粉末直接压片技术等对湿、热不稳定药物制剂的制备；流化床干燥、制粒、包衣技术，微波干燥、灭菌等技术在药物制剂生产上的应用等，均有效地提高了药物制剂的生产效率。

### 3. 新制剂、新剂型的研究开发

药物新制剂及新剂型的研究开发是药剂学当前研究的一个主要任务，其根本目的是：最大限度地降低药物的毒副作用，提高药物的临床治疗效果，增加药物的稳定性。其总体发展方向是：“三小”（剂量小、毒性小、副作用小）、“三效”（高效、速效、长效）和“三定”（定量、定时、定位）。研究开发药物新制剂及新剂型不仅对满足人们日益提高的生活水平，全面提高我国医疗水平具有较大的社会效益，而且对生产企业乃至国家的利益具有重要的意义。一个国家制剂水平的高低，在一定程度上反映出这个国家医疗质量的优劣，也是国家综合实力的体现。研究开发高质量的药物制剂，立足于国际市场，从过去以出口原料药为主转变为出口制剂为主，是我国过去几十年乃至今后较长时间内需努力实现的目标。

### 4. 新辅料、新机械的研究开发

新辅料、新机械是研究开发药物新制剂、新剂型的物质基础，是提高药物制剂质量的保证，也是目前制约我国制剂工业发展的主要“瓶颈”所在。如性质优良的崩解剂是研制分散片的先决条件；生物黏附性好、药物易穿透的压敏胶是制备透皮制剂的关键；磷脂质量的优劣制约着脂质体靶向制剂的发展。缺乏性能稳定、高效率生产机械是我国制剂质量不稳定、缺乏国际市场竞争力的主要原因。研究开发药物制剂新辅料、新机械需要有关学科和部门的共同协作研究，随着制剂、剂型种类的日趋增多繁杂，制剂质量要求日益严格，没有符合各种需要的优质辅料，没有符合现代化生产的制药机械设备，就难以实现艰巨的药剂学任务。

### 5. 中药剂型的整理、研究及创新

中医中药是我国的宝贵遗产，在近几十年里，对中成药的研究和生产虽然取得了较大的成就（如复方丹参等中药滴丸剂、西瓜霜喷雾剂、生脉注射剂等新剂型），但与日本等发达国家相比，中药制剂及剂型还存在较大的差距，特别是中药内在作用机理方面的研究较少，制剂基本理论较缺乏，制约了中药制剂的发展。中药制剂的研究和创新不仅要吸取西药制剂的长处，将中药制剂西药化，而更应从中药的作用特性出发，采用适合中药的制剂技术（如固体分散技

术、微粉化技术等), 以提高中药制剂的疗效。随着我国加入 WTO (世界贸易组织) 以及处方药与非处方药 (OTC) 分类管理制度的实施, 中药新制剂、新剂型的研究开发, 对促进我国制剂工业的长远发展, 提高企业市场竞争力, 弘扬中药事业具有重要意义。

### 三、药剂学在药学实践和国民经济中的地位、作用及特点

药剂学是一门研究药物剂型的科学, 它既为药物剂型服务, 又对发展药物剂型具有主导作用。

#### 1. 理论方面

- (1) 剂型是一切药物施与机体前的最终形式, 必须保证具体制剂符合各项规定要求;
- (2) 剂型质量的优劣直接关系到治病救人的速度和质量, 亦涉及到经济成本;
- (3) 优良的剂型患者乐于使用, 毒副作用小, 疗效显著, 便于服用、运输和储存;
- (4) 剂型生产的情况体现着一个国家的医疗用药水平和工业生产水平。

#### 2. 实践方面

在药品的研究、生产、使用等领域, 乃至销售环节, 都必须具备一定的药剂学知识。

(1) 在研究领域 任何原料药都必须制成适于一定给药途径的剂型, 以发挥其最佳治疗效果, 这就需要在掌握药物性质和药效的基础上, 熟练地应用药剂学的理论和技术确定剂型, 给药途径不同, 药物的吸收程度和速度不同, 药效亦存在差异; 不同剂型的处方设计、制备工艺的选择、制剂稳定性研究、制剂质量的控制等工作, 均必须具备坚实的药剂学理论和实践知识才能完成; 新剂型的研究开发和剂型改革, 更需要药剂学理论作为指导。

(2) 在药品生产领域 企业生产的药物制剂都是经药品监督部门核准的品种, 具有处方成熟、工艺规范、制剂稳定、疗效确切、质量标准可行的特点, 但由于原辅料来源、规格、批号的变化, 制药机械参数的波动, 操作人员技术熟练程度的差异, 甚至气候环境的影响, 都可能使制剂生产出现各种各样的困难和问题, 这就需要有丰富的药剂学理论知识和生产实践经验的药学技术人才去解决。新产品的试制、中试放大等过程, 都是药剂学工作者应承担的重要工作。

(3) 在药品使用领域 药剂师主要从事药品的发放和使用工作, 他们不仅应掌握基本的药剂学知识, 还应具备丰富的药物相互作用、药物剂量及其换算、制剂稳定性以及外观质量鉴别等多方面的知识, 开展临床药学工作的人员, 对临床用药方案的设计、药效的观察、用药剂量的调整、血药浓度的监控、生物利用度的研究及评价、医药信息的收集与管理等工作, 都离不开药剂学理论知识的指导。

(4) 在药品销售环节 如果药品销售人员不熟悉药物剂型的作用特点, 一般较难与临床单位及患者沟通, 介绍药品特点及使用知识时说服力不强。如缓控释制剂的作用特点, 血药浓度平稳、作用平缓; 毒副作用降低; 给药间隔延长、服药顺应性提高等。这些都涉及很多药剂学知识, 药品销售人员应该掌握。

总之, 药剂学在医疗卫生实践和药品生产实践中占据着极其重要的地位, 对医药工业及其相关科学的发展具有较大的推动作用。

## 第二节 药剂学的发展和任务

### 一、药剂学的发展简史

我国古代医药学起源极早, 医药遗产极为丰富, 药剂学是其重要组成部分, 了解我国药

剂学的形成和发展，对于学习、继承和发扬我国传统医药学具有一定的指导意义。我国药剂学的发展过程，根据其发展年代及研究内容，总体上可划分为三个时期：古代药剂学，近代药剂学和现代药剂学。

### 1. 古代药剂学

早在神农时代的古书即有“神农尝百草，始有医药”的记载。古人在寻找食物的同时就发现了药材，药材原先大多是将新鲜植物捣碎使用，随后为了更好地发挥药效、方便使用便开始加以修治和加工制成一定剂型的演变过程。随着生产力的逐渐发展和长期的医药实践，药剂制备技术不断得到提高和完善，剂型种类日渐丰富，逐渐形成了古代药剂学。在夏禹时代（公元前 2140 年），先人逐渐从酿酒中发现了酒和曲的功用，到公元前 577 年已知用曲治胃病，实为曲剂之始而至今仍用之。

汤剂为最早使用的剂型之一，在商代（公元前 1766 年）即已创用，远在希波克拉底（公元前 460~377 年）及格林（公元 131~201 年）之前。明代李时珍（公元 1518~1593 年）总结了 16 世纪以前我国的医药实践的经验，编著了著名的《本草纲目》一书，载的药物达 1892 种，近 40 种剂型及 11096 则附方，充分展现了我国古代医药学中丰富的药物剂型。总而言之，我国古代药物制剂的制造较早，剂型较多，制药技术富有科学性和实用性，这不仅提供了现代药剂学的研究资料，对世界药学的发展亦有重大贡献。

### 2. 近代药剂学

在 19 世纪初至 20 世纪 50 年代的一百多年间，由于西洋医药的传入，对我国近代药剂学的发展产生了一定的影响，如片剂、胶囊剂、注射剂等药物剂型的生产和应用。在 20 世纪 80 年代之前，我国药剂学研究工作几乎处于停滞阶段。进入 80 年代，随着改革开放政策的实施，综合国力逐渐增强，人们生活水平不断提高，对医药产品的要求亦随之发生改变，基本观念从“有病治病”转变为“无病防病”，过去人们常问“这药疗效怎么样？”，现在则常听到“这药毒副作用怎么样？”，由于国家对医药领域的投入亦不断增加，特别是从“六五”计划开始，我国将药物制剂的研究开发列入了国家攻关项目，从此，我国医药事业进入了快速发展时期，在近 20 年的时间里，我国医药工业获得了前所未有的成就，医药产业作为一个新兴产业在国民经济中的地位逐年提高，并逐渐成为国家支柱产业之一，进入 21 世纪，我国药剂学已从近代药剂学逐渐向现代药剂学时期发展。

### 3. 现代药剂学

现代药剂学的核心内容是药物制剂与剂型的现代化。无论何种新、老剂型，只要其包含现代科学技术，则都属于现代药剂学范畴。因此，现代药剂学发展的总体方向是：①常规药物剂型的挖掘、改造、完善和提高；②新剂型、新辅料、新技术、新工艺及新设备的研究开发；③研究药剂学理论与方法的创新。

(1) 常规药物剂型 片剂、胶囊剂、注射剂、软膏剂在常规剂型中仍占据主导地位，这些剂型是药物制剂的基本形式，在今后很长时期内仍将发挥其重要作用，各种速释、高效型药物制剂仍需采用这些形式给药，即使目前迅速发展的药物传递系统最终也离不开它们。挖掘、改造、完善和提高常规剂型在药物临床用药中的作用，是现代药剂学研究发展的重要内容之一，常规制剂一旦与现代科学技术相结合，其对现代药剂学发展的贡献将不可低估。以片剂为例，无论其制剂外观还是内在质量，现代药剂学技术的应用使该剂型取得了巨大的发展。如心型片、环型片、微型片、薄膜衣片、多层片、包芯片、口溶片及分散片等新型片剂的制备，以及溶出度、释放度、含量均匀度及生物利用度等有关制剂内在质量标准的提高，

不仅提高了临床用药的安全性和有效性，而且充实了现代药剂学的研究内容。

(2) 药物传递系统 (drug delivery system, DDS) 药物传递系统是现代药剂学中新剂型和新制剂研究成果的典型代表，是现代科学技术进步的结晶。该系统无论在理论系统的研究、新型制剂和制备工艺的设计方面，还是临床治疗中的应用方面都取得了重大的进展，主要包括口服缓控释系统、透皮给药系统和靶向给药系统。

① 口服缓控释系统 (sustained-release and controlled-release system) 该系统是现代药剂学中发展速度最快的一类新型给药系统，它主要是在常规剂型（如片剂、胶囊剂、颗粒剂及溶液剂等剂型）的基础上，采用缓控释制备技术延缓和控制药物的释放速度，以提高药物疗效，降低毒副作用，延长给药间隔以及提高患者服药顺应性。

② 透皮给药系统 (transdermal drug delivery system) 该系统系指药物经皮肤吸收入血发挥作用的一类新型给药系统，突破了生理学“皮肤屏障”的常规知识，开创了一种新型给药途径。

③ 靶向给药系统 (target drug delivery system) 该系统系指采用一定的制剂技术将药物定向地浓集于病变部位（靶区）的一类新型给药系统，可极大地提高药物的治疗效果，降低毒副作用。

## 二、药剂学分支学科的发展

药剂学在 19 世纪即成为一门独立的学科，在 20 世纪 40 年代之前，药剂学的主要内容是：阐明原料药物制成剂型的工艺、经验、用法和色香味等外观方面的各项要求。除了对化学合成药物中已知少数有效成分的植物药材的制剂用化学有效成分定量评价其质量外，绝大多数的制剂质量几乎都是以外观、定性及一些经验方法评价，在质量标准中经常是主观性指标多于客观性指标。随着科学技术的快速发展，目前药剂学已完成了从单一经验型向多方位研究型的转变过程，以现代科学理论为指导的现代药剂学实现了“量变”到“质变”的跨越，并逐步发展、建立了各有侧重研究方向的药剂学分支学科（如物理药剂学、工业药剂学、生物药剂学、药物动力学及临床药学等），组成了一个较为完整的现代药剂学学科体系。

### 1. 工业药剂学 (industrial pharmacy)

工业药剂学是研究药物制剂工业化生产设计的一门应用科学。该学科以物理药剂学为理论指导，以生物药剂学、药物动力学和临床药学对药物制剂在体内运动规律、临床疗效等研究成果为基础，与工业生产直接相关，是整个药剂学学科体系的主体。其宗旨是：研究适合工业化生产的药物剂型和生产工艺，实施药物制剂的规模化生产，向社会大量提供安全、有效、稳定、价格低廉、服用方便的药物制剂，为人类健康服务。其主要内容包括工业化生产方面的基本理论（如剂型成型理论等）研究、生产工艺设计、生产设备改进及产品质量控制等。药物制剂处方中各组分的作用、用途和合理配伍，以及制备工艺的合理设计是其中心内容。

### 2. 物理药剂学 (physical pharmacy)

物理药剂学是应用物理化学的基本原理、方法和手段研究药剂学中有关药物剂型设计的一门理论科学。在 20 世纪 50 年代该学科已基本形成相对独立的学科体系，主要通过对物质的化学、物理变化规律与机理的认识，指导药物制剂、剂型的生产科研实践。如应用胶体化学及流变学的基本原理，指导混悬剂、乳剂、软膏剂等药物剂型的处方、工艺的设计和优化；应用粉体学原理指导药物固体剂型的处方、工艺的设计和优化；应用化学动力学原理评价、提高药物制剂稳定性；应用表面化学和络合原理阐述药物的增溶、助溶的机理等。物理



药剂学涉及的研究范围很广泛，并随着新学科、新技术的发展而不断扩展，如生物物理学、分子药理学、基因工程学、酶化学等现代学科的建立和发展，为药物靶向制剂的研究、开发奠定了坚实的理论基础；纳米芯片等微电子技术的发展，在不久的将来可能实现人体内机械给药装置的临床使用。总之，物理药剂学是药物新剂型发展的理论基础，重大基础理论的建立和突破必将导致药剂学学科的“飞跃”。

### 3. 生物药剂学 (biopharmaceutics)

生物药剂学是研究药物、剂型、生物等因素与药效（包括疗效、副作用和毒性）间关系的科学。该科学于20世纪60年代迅速发展成为一门独立的科学，主要研究药物在体内的量变规律及其影响因素，是药剂学学科体系中的主要基础学科之一，该科学的发展为合理设计药物剂型和给药方案、优化制剂处方和制备工艺、提高药品质量和临床疗效提供了科学保障。研究手段常常采用测定药物及其代谢产物在体内的吸收、分布、代谢和排泄的变化与疗效间的关系，阐明药物理化性质（如化学结构、溶解度、溶解速度、粒径、晶型等）、制剂处方（如原料、辅料种类及配比、附加剂等）、制备工艺、包装及贮存条件等剂型因素，以及生物因素（如年龄、种族、性别、遗传、生理、病理、心理等）和其他因素（如食物、气候环境等）对药物疗效的影响。生物药剂学涉及面广、内容丰富，与生物化学、生理学、药理学、药物治疗学、药物动力学等有密切联系。

### 4. 药物动力学 (pharmacokinetics)

药物动力学是研究药物在体内存在的方式与量变规律的科学。该科学始于20世纪30年代，60年代才普遍为人所重视，70年代已发展成为一门独立的科学，主要研究药物在体内的存在位置、数量（或浓度）的变化与时间的关系，亦是药剂学学科体系中的主要基础学科之一，是研究药物在体内变化的重要工具。该学科根据药物在体内的配置状况，建立了“隔室模型”基本理论，通过对药物在不同“室”间的转运方式、速度、级数和分布浓度的数学计算，从药物浓度变化和时间关系中寻找适当的数学模型和参数，采用特定的数学方程式定量描述药物在体内过程的动态规律。这些规律的发现，对科学地阐明药物的疗效、毒性和药物浓度间的关系，对临床合理用药、药物剂型设计、药物结构改造及新药设计等均具有重要指导作用。

### 5. 临床药学 (clinical pharmacy)

临床药学是以患者为对象研究合理、有效、安全用药的科学，是医学和药学相互渗透、有机结合的交叉性学科。该科学始于20世纪60年代，70年代发展为独立科学。其主要任务是指导临床正确选择和合理应用药物疗法。主要内容包括：药物制剂的临床研究及评价；药物制剂生物利用度研究及评价；药物配伍变化及相互作用研究和评价；临床用制剂和处方的研究；药物剂量的临床监控；个体化给药方案的设计及实施等。临床药学的出现，改变了医院部门中药剂工作者的传统观念，实现了以“药品为目标”到以“患者为目标”的观念转变，确立了药师指导临床用药的地位，为提高临床用药水平奠定了基础。

药剂学各分支学科间的相对独立、互为补充的关系，是促进现代药剂学快速发展的根本所在。

## 三、药剂学的主要任务

近二十年来我国制剂工业随着药剂学的高速发展，在剂型种类、制剂数量、产品质量等方面都取得了长足的进步，在较短的时间内基本完成了普通制剂制备理论及技术的研究，攻克了以片剂、胶囊剂、注射剂等为主要剂型的生产技术难关，改变了我国制药企业生产设备