

高职高专示范院校建设成果系列教材

YAOWU ZHIJI JISHU

# 药物 制剂技术

万刘静 编著



电子科技大学出版社

高职高专示范院校建设成果系列教材

YAOWU ZHIJI JISHU

# 药物 制剂技术

万刘静 编著



电子科技大学出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药物制剂技术 / 万刘静编著. —成都: 电子科技

大学出版社, 2013.11

ISBN 978-7-5647-2187-9

I. ①药… II. ①万… III. ①药物—制剂—高等职业  
教育—教材 IV. ①TQ460.6

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2013) 第 009091 号

## 药物制剂技术

万刘静 编著

出 版: 电子科技大学出版社 (成都市一环路东一段 159 号电子信息产业大厦 邮编: 610051)

策划编辑: 罗 雅

责任编辑: 罗 雅

主 页: [www.uestcp.com.cn](http://www.uestcp.com.cn)

电子邮箱: [uestcp@uestcp.com.cn](mailto:uestcp@uestcp.com.cn)

发 行: 新华书店经销

印 刷: 四川川印印刷有限公司

成品尺寸: 180mm×240mm 印张 12.5 字数 300 千字

版 次: 2013 年 11 月第一版

印 次: 2013 年 11 月第一次印刷

书 号: ISBN 978-7-5647-2187-9

定 价: 35.00 元

■ 版权所有 侵权必究 ■

- ◆ 本社发行部电话: 028-83202463; 本社邮购电话: 028-83201495。
- ◆ 本书如有缺页、破损、装订错误, 请寄回印刷厂调换。

# 重庆市示范性高职院校优质核心课程系列教材

## 建设委员会成员名单

主任委员 宋正富

副主任委员 彭光辉 陈电容

委员 (按姓名汉语拼音排序)

勾纯静 胡 敏 胡相云

贾庭华 李玲玲 罗 红

罗合春 谭明权 田春美

万刘静 王恩东 吴晓林

武兴菲 熊 竹 徐安书

杨明霞 杨忠良 查 杰

张 兵 张其昌 张先淑

张玉礼

# 序

随着高等职业教育“工学结合，校企合作”人才培养模式的不断发展，示范院校示范专业的课程建设进入全新的阶段，特别是在《教育部关于推进高等职业教育改革创新引领职业教育科学发展的若干意见》（教职成[2011]12号）的文件是1号文件的正式出台，标志着我国高等职业教育以课程为核心的改革与建设成为高等职业院校当务之急。重庆工贸职业技术学院经过十年的改革探索和三年的示范性建设，在课程改革和教材建设上取得了一些成就，纳入示范建设的8门生物制药技术专业优质核心课程的物化成果之一——教材现已结稿付梓，即将与同行和同学们见面交流。

本系列教材力求以职业能力培养为主线，以工作过程为导向，以典型工作任务和生产项目为载体，立足行业岗位要求，参照相关的职业资格标准和行业企业技术标准，遵循高职学生成长规律、高职教育规律和行业生产规律进行开发建设。教材建设过程中广泛吸纳了行业、企业专家的智慧，按照任务驱动、项目导向教学模式的要求，在内容选取上注重了学生可持续发展能力和创新能力培养，教材具有典型的工学结合特征。

本套以工学结合为主要特征的系列化教材的正式出版，是学院不断深化教学改革，持续开展工作过程系统化课程开发的结果，更是重庆市示范高职院校建设的一项重要成果。本套教材是我们多年来按生物制药生产流程开展教学活动的一次理性升华，也是借鉴国外职教经验的一次探索尝试，这里面凝聚了各位编审人员的大量心血与智慧。希望该系列教材的出版能为推动全国高职高专生物制药技术专业建设起到引领和示范作用。当然，系列教材涉及的工作领域较多，编者对现代教育理念的理解不一，难免存在各种各样的问题，希望得到专家的斧正和同行的指点，以便我们改进。

本教材的正式出版得到了全国生物技术职业教育教学委员会副主任陈电容教授、华兰生物重庆有限公司张其昌技术总监、葵花药业重庆有限公司贾庭华工程师和罗红工程师、重庆中宝生物制药有限公司勾纯静工程师，以及娃哈哈集团重庆饮料有限公司刘炜、重庆涪陵榨菜集团张玉礼、重庆市第四农产品检测中心郭建等专家的大力支持，对于他们多年来关心和支持我校生物制药技术专业的建设和发展，在此表示感谢！

宋正富

2013年10月

# 前 言

本教材是在全国生物技术教学指导委员会的指导下，根据教育部有关高职高专教材建设的文件精神，以高职高专生物制药技术学生的培养目标为依据编写的。在本教材的编写过程中，广泛地征求了生产一线工程技术专家的意见，紧密地结合了生产实际，具有极强的实用性。该教材是生物制药技术专业的专业核心课教材，适用于高职高专生物制药技术、中药制药技术、生化制药技术等专业的教学使用。

本教材共分十三章：绪论，粉碎、筛分和混合，颗粒剂生产技术，片剂生产技术，胶囊剂生产技术，制剂用水生产技术，无菌制剂生产技术，浸出制剂生产技术，丸剂生产技术，膏剂生产技术，栓剂生产技术，气雾剂生产技术，膜剂生产技术以及相关实训，适用于边学边做，“教、学、做”一体化的教学形式。本书编写的宗旨就是提高学生的综合素质能力，培养技能型、应用型人才，突出高职高专职业教育的特色。

本教材在编写过程中的得到了全国生物技术职业教育教学委员会副主任陈电容教授等职教专家的悉心指导，以及华兰生物工程重庆有限公司张其昌、葵花药业重庆有限公司贾庭华和罗红、重庆中宝生物制药有限公司勾纯静等专家和工程师的大力支持，在此表示诚挚的感谢！

由于编者水平所限以及时间仓促，书中难免有不妥和错误之处，恳请读者批评指正。

编 者  
2013年10月

## 目 录

第一章 绪论 .....	1
第二章 散剂生产技术 .....	10
第一节 概述 .....	10
第二节 散剂的制备 .....	10
第三节 散剂的质量检查 .....	21
第三章 颗粒剂生产技术 .....	25
第一节 基础知识 .....	25
第二节 造粒技术 .....	25
第三节 颗粒剂质量检查 .....	26
第四章 片剂生产技术 .....	30
第一节 基础知识 .....	30
第二节 压片技术 .....	36
第三节 包衣技术 .....	51
第四节 片剂的质量检查 .....	55
第五节 片剂的包装 .....	56
第五章 胶囊剂生产技术 .....	61
第一节 基本知识 .....	61
第二节 胶囊剂的生产 .....	62
第三节 胶囊剂的质量检查与包装贮存 .....	65
第六章 制剂用水生产技术 .....	69
第一节 基本知识 .....	69
第二节 纯化水的生产 .....	75
第三节 注射用水的生产 .....	76
第四节 注射用水质量检查 .....	77
第七章 无菌制剂生产技术 .....	82
第一节 基本知识 .....	82
第二节 水针剂生产技术 .....	84

第三节	大输液生产技术 .....	93
第四节	粉针剂生产技术 .....	97
<b>第八章</b>	<b>浸出制剂生产技术 .....</b>	<b>102</b>
第一节	基本知识 .....	102
第二节	普通浸出技术 .....	103
第三节	浸出操作 .....	105
第四节	蒸发与干燥技术 .....	109
第五节	常用的浸出制剂 .....	112
第六节	浸出制剂的质量控制 .....	115
<b>第九章</b>	<b>丸剂生产技术 .....</b>	<b>118</b>
第一节	基本知识 .....	118
第二节	滴丸的生产 .....	119
第三节	中药丸剂的生产 .....	120
第四节	丸剂质量检查 .....	123
<b>第十章</b>	<b>膏剂生产技术 .....</b>	<b>125</b>
第一节	基本知识 .....	125
第二节	软膏剂的生产 .....	133
第三节	眼膏剂的生产 .....	135
第四节	凝胶剂的生产 .....	136
第五节	软膏剂的质量检查 .....	138
<b>第十一章</b>	<b>栓剂生产技术 .....</b>	<b>142</b>
第一节	基本知识 .....	142
第二节	栓剂的制备 .....	146
第三节	栓剂的质量检查 .....	147
<b>第十二章</b>	<b>气雾剂生产技术 .....</b>	<b>150</b>
第一节	基本知识 .....	150
第二节	气雾剂的组成 .....	152
第三节	气雾剂的生产 .....	157
第四节	气雾剂的质量检查 .....	160
<b>第十三章</b>	<b>膜剂生产技术 .....</b>	<b>162</b>
第一节	基本知识 .....	162
第二节	膜剂的生产 .....	163
第三节	膜剂质量检查 .....	164



实训一 散剂的制备 .....	167
实训二 维生素 C 颗粒剂的制备 .....	169
实训三 片剂的制备 .....	171
实训四 胶囊剂的制备 .....	173
实训五 注射剂的制备 .....	175
实训六 酞剂的制备 .....	177
实训七 丸剂的制备 .....	178
实训八 膏剂的制备 .....	180
实训九 栓剂的制备 .....	182
实训十 膜剂的制备 .....	184
参考文献 .....	186

# 第一章 绪 论

## 一、药物制剂技术的性质

药物制剂技术是研究药物制剂的制备理论、生产技术、质量控制与合理应用等内容的综合应用技术科学，是药学专业的一门主要课程。

任何药物在供临床使用前，都必须制成适合于治疗或预防应用的、与一定给药途径相适应的给药形式，称为药物剂型（drug dosage forms，简称剂型），如片剂、注射剂、胶囊剂等。剂型是在劳动人民与疾病作斗争的长期医疗实践过程中逐渐形成的。由于病有急缓，病情各异，所以对剂型的要求亦有不同，如对症患者，为使药效迅速，宜采用注射剂、气雾剂等；对于需要药物作用持久、延缓的则可用缓释制剂或控释制剂等。药物的性质不同，因此要求制成适宜的剂型应用，如胰酶遇胃酸易失效，不能采用普通口服剂型，可制成肠溶胶囊或肠溶片服用，使其在肠内发挥效用；若含有毒性药物或刺激性药物时，宜制成缓释片剂或其他长效剂型，使其在体内缓缓释放药物，既可延长药物作用时间也能防止过强的刺激或中毒；某些药物制成液体剂型不稳定时，可以制成固体剂型如片剂、散剂、粉针剂等；一些有机药物，由于颗粒大小或晶型不同而呈现不同的作用和疗效，故必须在其制剂中保持其有效的晶型，以保持和发挥药物的预期效能。为了应用、生产、携带、运输和贮存等的方便，往往也需要将药物制成不同剂型，如将中药浸出的有效成分，制成药酒、片剂、注射剂等剂型后，可以减小体积、便于服用；将儿童用的药剂，制成色、香、味俱全的制剂则可使儿童乐于用药。

药物和剂型之间存在着辩证关系，药物本身的疗效虽然是主要的，但在一定条件下，剂型对药物疗效的发挥也起着积极的作用，如有的药物，剂型不同其疗效就不一样。如硫酸镁制成溶液口服时，有致泻作用，若将其制成静脉注射剂，则作用就完全不同，可用于抗惊厥等症；灰黄霉素水中溶解度较低，如微粉化后应用，其疗效可大为增加，若将灰黄霉素高度分散在水溶性基质聚乙二醇 6000 中制成滴丸，服后在血液中的药物含量比微粉片剂（灰黄霉素粉碎后含  $5\mu\text{m}$  以下应不少于 85% 的微粉）又可高出一倍以上，且疗效确切，副作用小。因此，在设计一种药物剂型时，除了要满足医疗需要外，还必须从药物剂型的形成和发展的实践基础出发，综合药物性质、制剂的稳定性、安全性、有效性和质量控制，以及生产、使用、携带、运输和贮存等方面全面考虑。

药物制剂技术与物理药剂学、工业药剂学、生物药剂学、药动学、临床药剂学和药用高分子材料学有着紧密的联系，相互渗透相互促进。物理药剂学是运用物理化学原理、方法和手段，研究有关剂型、制剂的处方设计、制备工艺、质量控制等内容的学科。工业药剂学是研究药物制成稳定制剂的规律和工业生产与设计的一门应用技术科学。其主要任务是研究剂型及制剂生产的基本理论、工艺技术、生产设备和质量管理，以便为临床提供安

全、有效、稳定和便于使用的优质产品。生物药剂学是研究药物及其剂型在体内的吸收、分布、代谢与排泄过程，阐明药物的剂型因素，机体生物因素和药物疗效之间相互关系的科学。药动学是应用动力学原理与数学处理方法，定量描述药物在体内动态变化规律的学科，对指导制剂设计、剂型改革、安全合理用药等提供量化指标，已成为研究药物及其制剂在体内变化的重要工具学科。临床药剂学是应用现代医药理论和技术，紧密结合临床实践，研究药物制剂及合理用药的一门应用科学，主要研究药物的剂型设计与使用方法、给药方案的关系。药用高分子材料学主要介绍药剂学的剂型设计和制剂处方中常用的合成和天然高分子材料的结构、制备、物理化学特征以及其功能与应用。

## 二、药物制剂常用术语

### （一）药物与药品

药物是指用以防治人类和动物疾病以及对人体生理机能有影响的物质，按来源可分为天然药物和合成药物两大类。药品是指用于预防、治疗、诊断人的疾病，有目的地调节人的生理机能并规定有适应证、用法和用量的物质，包括中药材、中药饮片、中成药、化学原料药及其制剂、抗生素、生化药品、放射性药品、血清疫苗、血液制品和诊断药品等。所以药物与药品是两个不完全等同的概念。药物内涵比药品大得多，并非所有能防治疾病的物质都是药品。

### （二）剂型

药物经加工制成的适合于预防、医疗应用的形式称作剂型。一般是指药物制剂的类别，如散剂、颗粒剂、片剂、注射剂、软膏剂等。根据药物的使用目的和药物的性质不同，可制备适宜的不同剂型；不同剂型的给药方式不同，其结果药物在体内的行为也不同。不同的药物可以制成同一剂型，如利巴韦林片、抗坏血酸片、阿司匹林片、阿莫西林片等；同一种药物也可制成多种剂型，如甲硝唑片、甲硝唑泡腾片、甲硝唑胶囊、甲硝唑栓、甲硝唑注射液等。

### （三）制剂

根据药典、药品标准、处方手册等所记载的应用比较普遍且较稳定的处方，将原料药按某种剂型制成的具有一定规格的药物制品（药剂）称为制剂。制剂可直接用于临床治疗或预防疾病（如牛黄益金片、银黄含化片等），也可作为其他制剂或方剂的原料（如流浸膏剂等）。制剂多在药厂中生产，也可在医院制剂室中制备。

### （四）方剂

方剂是根据医师处方专为某一病人或某种疾病配制的药剂。方剂具有明确的使用对象、剂量和用法。方剂的配制一般都在医院制剂室中进行，可在持有《药品经营许可证》且通过《药品经营质量管理规范》（GSP）认证的销售机构（零售药房）中调配。研究方剂配制、使用等有关技术和理论的科学称为调剂学。

### （五）成药

成药是根据疗效确切、性质稳定、应用广泛的处方，将原料药物加工配制成的具有一定剂型和规格的制剂。其特点是一般都给以通俗名称（如清凉油、伤湿止痛膏、银翘解毒片等），标明其作用、用法、用量等。成药的生产、销售必须经药品监督管理部门批准。

### （六）毒药和剧药

毒药指药理作用剧烈，极量与致死量很接近，虽服用量很小，但在超过极量时即有可能引起中毒或死亡的药品，如洋地黄毒苷、砒霜等。剧药指药理作用强烈，极量与致死量比较接近，在服用超过极量时，有可能严重危害人体健康，甚至引起死亡的药品，如巴比妥、水合氯醛等。

### （七）麻醉药品

麻醉药品指连续使用后易产生生理依赖性、能成瘾癖的药品，如吗啡、可待因等。麻醉药品应与临床应用的麻醉剂如乙醚、氯仿（三氯甲烷）和普鲁卡因等有所区别，后者虽具有麻醉作用，但不会成瘾，所以不属于麻醉药品。毒药、剧药和麻醉药品应该由专人、专柜加锁保管，并有指定医师的正式处方时才可发出，处方医师还应在用量上签字或盖章。毒药、剧药和麻醉药品的标签式样和颜色亦应与普通药品有明显的区别，在购买、调配、保管和使用等方面也都必须严格执行有关规定。

### （八）中草药

中草药一般指我国民间根据经验所用的有效植物药材，也包括一些动物和矿物药材。

### （九）中药

中药是指在中医基础理论指导下用以防病治病的药物，亦称传统药。中药包含中药材、中药饮片、中成药、民族药。据国家卫生行政部门统计，目前中药剂型已达 40 多种，市售中成药 8500 多种。

## 三、药物制剂技术的任务

药物制剂技术的基本任务是研究如何将药物制成适宜的剂型，并能批量生产，具有有效性、安全性、稳定性并质量可控的药品。其具体任务可概述如下。

### （一）研究药物制剂的基本理论与生产技术

药物制剂基本理论的研究对提高药剂的生产技术水平，制成安全、有效、稳定、方便的药物制剂具有重要意义。例如利用药动学知识对药剂进行稳定性预测及质量控制；利用增溶与助溶理论进行药剂制备；利用药物微粉化、固体分散法及微囊化等促进和控制药物的溶解和吸收的速率；利用片剂成型理论及全粉末直接压片技术生产片剂；利用流变学的基本理论对混悬液、乳浊液和软膏剂等剂型的质量进行控制；利用生物药剂学的有关知识，为正确评价药剂质量，合理制药和合理用药等提供重要依据等。可见，提高药物制剂学基本理论，特别是剂型设计原理的研究水平，对改进药剂的生产技术，开发新剂型、新品种、

新工艺及提高产品质量都有重要的指导意义。

## （二）开发新剂型和新制剂

随着科学技术的发展和人们生活水平的不断提高，原有剂型和制剂已不能完全满足人们的需求。剂型是药物应用的具体形式，普通剂型如片剂、胶囊剂、溶液剂、注射剂等，很难完全满足高效、速效、长效、低毒、低副作用、控释和定向释放等多方面的要求，现普遍受到关注的是缓释、控释制剂，靶向制剂，经皮吸收制剂，口腔、鼻黏膜及肺部吸收制剂，生物技术药物制剂等新型给药系统的研究。新型给药系统可以提高药物的有效性，适当延长药物在体内的作用时间，增加药物作用的持久性和对靶组织或器官的选择性以提高药物的疗效、降低毒副作用。目前，我国药物制剂技术的研究水平与发达国家相比还有较大差距，剂型种类和制剂品种较少，且能够出口的制剂品种不多，因此，积极开发新剂型和新制剂有重要的意义。

## （三）积极研究和开发药用新辅料

药物制剂中除主药外，还含有各种辅料。剂型不同所需辅料也不相同。如片剂所用辅料与软膏剂、栓剂等所用辅料就大不相同。药物剂型的改变和发展、产品质量的提高、生产工艺设备的革新、新技术的应用以及新剂型的研究等工作，都要求有各种各样制剂辅料的密切配合。尽管目前药用辅料的种类很多，但仍然满足不了药物制剂发展对新辅料的需要。制剂工业发达的国家仅几种主要剂型所用的辅料就达 200 余种，目前，我国也正在积极进行药用新辅料的开发，但品种与质量都有待于进一步提高。因此，辅料的研究和开发，在药物制剂领域中的位置越来越重要，没有优质的辅料就很难实现药物制剂的发展。

## （四）整理与开发中药剂型

中药是中医用以防治疾病的主要武器，是中医赖以生存的物质基础，是中华民族的宝贵遗产。新中国成立以来，在继承和发扬中医中药理论和中药传统剂型（丸、散、膏、丹、胶、露、酒等）的同时，研制和开发了 20 多种中药新剂型，如片剂、颗粒剂、胶囊剂、滴丸剂、栓剂、软膏剂、注射剂、气雾剂等。目前，中成药生产品种已达数千个，不仅丰富和发展了中药剂型和品种，而且提高了中药的疗效，扩大了临床应用范围。但质量控制方法等尚无法与国际接轨，产品大多无法走出国门。依靠现代科学技术，遵循严格的规范标准，研制出优质、高效、安全、稳定、质量可控、服用方便并符合国际标准的新一代中药，并使之走向国际市场，是药物制剂工作者研究的重要任务。

## （五）研究和开发制剂的新机械和新设备

制药机械和设备是制剂生产的重要工具。它们的研究与开发对研究开发新制剂、提高制剂质量、增加制剂产量、提高劳动生产率、降低成本等都具有重要意义。原国家药品监督管理局于 1998 年发布《药品生产质量管理规范》(GMP)及国家食品药品监督管理局 2002 年 12 月发布修订的《药品生产质量管理规范认证管理办法》，对制剂机械和设备的发展提出了要求。为了更好地保证药品质量，保障人体用药安全，制剂生产正从机械化、联动化

向封闭式、高效型、多功能、连续化、自动化及程控化的方向发展。例如固体制剂生产所用的一步制粒机、高速搅拌制粒机、挤出滚圆制粒机、离心制粒机等使制粒物更加致密、球形化；高效全自动压片机的问世，使片剂的质量和产量大大提高；程序控制喷雾包衣装置，使包衣时间缩短，生产效率提高；在注射剂的生产方面，高效喷淋式加热灭菌器、粉针灌封机与无菌室组合整体净化层流装置等减少了人员走动和污染机会。研制适合我国实际情况的新型制药机械和设备，对赶超世界先进水平，提高制剂质量，将制剂产品打入国际医药市场，具有重要意义。

#### （六）新技术的研究与开发

新剂型的开发离不开新技术的应用。近几年来蓬勃发展的固体分散技术、包合技术、微囊化技术、脂质体技术、球晶制粒技术、包衣技术、缓释及控释技术、纳米技术、生物技术等，为新剂型的开发、新制剂品种的增加及制剂质量的提高奠定了良好的技术基础。但有些技术欠完善，难度大、成本高，应用于批量生产有待进一步发展。

### 四、药物剂型的分类

药物剂型的种类很多，为便于学习、应用，可将剂型按以下几种方法分类。

#### （一）按形态分类

可分为液体剂型（如洗剂、滴剂、溶液剂、注射剂等），固体剂型（如散剂、片剂、植入剂等）。

形态相同的剂型，其制备特点和医疗效果有类似之处。如在制备时液体剂型多需溶解；固体剂型多需粉碎、混合、成型；半固体剂型多需溶化或研匀。而不同形态的剂型对机体的作用速度往往也不相同，一般液体剂型作用最快，固体剂型则较慢。这种分类方法比较简单，没有考虑到制剂的内在特性和使用方法等，但在制备、贮存和运输上具有一定指导意义。

#### （二）按分散系统分类

将一种或几种物质的粒子分散于另一种物质中所形成的体系称为分散系统。被分散的物质称为分散相，容纳分散相的物质则称为分散媒或分散介质。将各种剂型按分散系统分类是根据剂型内在的结构特性，把所有剂型都看作是各种不同的分散系统加以分类。

1. 真溶液型 真溶液剂型是指药物分散在分散介质中所形成的均匀的液体分散系统。其中药物是以分子或离子状态存在，直径小于 1mm，如芳香水剂、溶液剂、糖浆剂、甘油剂等。

2. 胶体溶液型 胶体溶液剂型系指一定大小的固体颗粒药物或高分子药物分散在分散介质中所形成的不均匀（溶胶）或均匀（高分子溶液）的液体分散系统。分散相质点的直径一般在 1~100nm，如胶浆剂、涂膜剂、溶胶剂等。

3. 乳状液型 乳状液剂型是指液体分散相和液体分散介质所组成的不均匀的液体制剂，如乳剂、静脉乳剂等。

4. 混悬液型 混悬液类剂型是指固体药物以微粒分散在液体分散介质中所形成的不均匀的液体制剂,如混悬剂、混悬滴剂、混悬注射剂等。

5. 气体分散型 气体分散类剂型是指液体或固体药物以微粒状态分散在气体分散介质中所形成的不均匀分散系统的制剂,如气雾剂等。

6. 固体分散型 固体分散类剂型是指药物与辅料混合呈固体状态存在的制剂,如散剂、丸剂、片剂等。

这种分类方法基本上可以反映出药物制剂的均匀性、稳定性以及对制法的要求等,但却不能反映出给药途径对剂型的要求,还会出现一种剂型由于辅料和制法的不同而必须划分到几个分散系统中的情况,如注射剂中就有溶液型、混悬型、乳浊型制剂及粉针等。

### (三) 按给药途径和方法分类

人体共有十多个给药途径,如口腔、消化道、呼吸道、血管、皮下、肌肉、直肠、阴道等,可将用于同一给药途径的剂型归为一类。

1. 经胃肠道给药的剂型 此类剂型的药物制剂经口腔给药后,进入胃肠道吸收发挥疗效,如溶液剂、糖浆剂、混悬剂、散剂、片剂及胶囊剂等。采用口服给药的方法最为简单,易受胃酸破坏的药物(如红霉素)可经肠溶包衣后口服。某些药物直肠给药较口服给药吸收好,可经直肠黏膜吸收后起全身作用,且不受或少受肝脏的代谢破坏。

2. 不经胃肠道给药的剂型 此类药物剂型是指采用除胃肠道和直肠给药以外的其他给药途径的剂型。

(1) 注射给药: 主要指注射剂,给药途径包括静脉注射、肌肉注射、皮下注射、皮内注射及穴位注射等。

(2) 呼吸道给药: 主要有吸入剂、气雾剂、吸入粉雾剂等。

(3) 皮肤给药: 通过皮肤给药,药物在皮肤局部起作用或经过皮肤吸收发挥全身作用,如外用溶液剂、洗剂、搽剂、软膏剂、外用膜剂和贴剂等。

(4) 黏膜给药: 此类剂型利用眼部黏膜、鼻黏膜、口腔黏膜以及尿道、阴道黏膜等给药,可起局部或全身作用,如滴眼剂、滴鼻剂、含漱剂、舌下片、栓剂、膜剂等。

这种分类方法可与临床应用紧密结合,并能反映给药途径和应用方法对剂型制备的特殊要求。其缺点是一种制剂由于给药途径或给药方法的不同,可能在多种剂型中出现。如氯化钠溶液,可在注射剂、滴眼剂、灌洗剂等许多剂型中出现。

### (四) 按制法分类

这种分类方法是将用同样方法制备的剂型列为一类。如浸出制剂(包括酊剂、流浸膏剂及浸膏剂等)是指用浸出方法制备的剂型;无菌制剂是经灭菌处理或无菌操作法制备的制剂,如注射剂、滴眼剂、眼膏剂、眼用膜剂等。这种分类方法较少应用,因为制备方法随着科学的发展而改变,所以其指导意义不大。

上述分类方法各有一定优缺点,本教材根据医疗、生产实践、教学和科学研究等方面的长期沿用习惯,在总结各种分类方法的特点后,采用综合分类法,即在以分散系统分类



法为主的基础上, 将用浸出法制备的各种剂型按制法分类单列一章, 以保持这些剂型在制备方法上的系统性; 另外在液体制剂一章中, 把耳鼻喉科和口腔科中常用的剂型如洗剂、滴耳剂、滴鼻剂、滴牙剂等按给药途径与应用方法分类单列一节叙述, 不仅可与临床用药密切结合, 也可体现出这些剂型的应用特点。

## 五、药物剂型的历史与发展

### (一) 药物剂型的历史

汤剂是我国应用得最早的中药剂型, 在商代已在使用。夏商周时期医书《五十二病方》《甲乙经》《山海经》已记载将药材加工制成汤剂、酒剂、洗浴剂、饼剂、曲剂、丸剂、膏剂等剂型使用。东汉张仲景的《伤寒论》和《金匱要略》著作中共收载有栓剂、糖浆剂、洗剂等十余种剂型。两晋、南北朝时期, 史籍记载的药学专著已达 110 种, 这时中医学逐渐形成独立的学科。明代李时珍编著的《本草纲目》总结了 16 世纪以前我国劳动人民医药实践的经验, 收载药物 1892 种, 剂型近 61 种, 附方 11 098 则, 现已被译成多国文字, 对世界药学的发展也有重大贡献。

与中国古代药剂学进程相呼应的欧洲古代药剂学也在迅速发展。希腊人希波克拉底创立了医药学, 希腊医药学家格林奠定了欧洲医药学基础, 由他制备的各种植物药浸出剂称为格林制剂。18 世纪的工业革命给世界带来翻天覆地的变化, 生产力极大发展, 推动了科学技术的飞跃发展和进步。在工业革命的浪潮中, 药物制剂终于走出了医生的小诊所和个体生产者的小作坊, 进入机械化生产的大工厂。片剂、注射剂、胶囊剂、橡胶硬膏剂等近代剂型的相继出现, 标志药物剂型发展到了一个新阶段。

### (二) 药物剂型的发展

药物都应制成一定的剂型, 以制剂的形式应用于治疗、预防或诊断疾病。所以, 药剂学的发展和进步也就是剂型和制剂的发展和进步; 制剂的安全性、有效性、合理性和精密性等, 则反映了医药的水平, 决定了用药的效果。随着医学的发展, 目前认为, 对人们危害最大的多发病、常见病集中在四个方面, 即癌症、心脑血管病、传染性疾病和老龄化疾病。要提高药物的疗效、降低药物的毒副作用和减少药源性疾病, 不断对药物制剂提出了更高的要求, 药物的新剂型和新技术也正发挥越来越大的作用。随着科学技术的飞速发展, 各学科之间相互渗透, 互相促进, 新辅料、新材料、新设备、新工艺的不断涌现和药物载体的修饰、单克隆抗体的应用等, 大大促进了药物新剂型与新技术的发展和完善。自 20 世纪 90 年代以来, 药物新剂型与新技术已进入一个新阶段。可以认为, 这一阶段的特点是理论发展和工艺研究已趋于成熟, 药物给药系统在临床较广泛的应用即将或已经开始。

药物剂型的第一代是简单加工供口服与外用的汤、酒、膏、丹、丸、散等; 随着临床用药的需要、给药途径的扩大和工业的机械化与自动化, 产生了片剂、注射剂、胶囊剂与气雾剂等第二代剂型; 以后发展到以疗效仅与体内药物浓度有关而与给药时间无关这一概念为基础的第三代的缓释、控释剂型, 它们不需要频繁给药、能在较长时间内维持体内药物有效浓度, 称为缓释、控释给药系统, 包括在胃内黏附或漂浮或肠道释药的缓释制剂,



和反映时辰生物学技术与生理节律同步的脉冲式给药，根据所接受的反馈信息自动调节释放药量的自调式给药，即在发病高峰时期在体内自动释药的给药系统；欲使药物浓集于靶器官、靶组织、靶细胞，提高疗效并降低全身毒副作用的靶向给药系统，称为第四代剂型。

可以预计，今后除开发特效的药物，包括治疗遗传疾病及肿瘤的基因工程药物，且更多地应用肽类、蛋白质类和天然产物作药物或疫苗外，药物新剂型的应用将使缓释和控释给药系统进一步代替有血药峰谷浓度的普通剂型，靶向性、脉冲式、自调式给药系统也将逐步增多。但由于疾病的复杂性及药物性质的多样性的理论、加工、剂型、标准等都有专门论述。唐代《新修草本》是我国第一部官修本草，也是世界上公开颁行最早的药典。适合于某种疾病和某种药物的给药系统不一定适合于另一种疾病和药物，因此必须发展多种多样的给药系统以适应不同的需要。如治疗心血管疾病的药物最好制成缓释、控释给药系统，抗癌药宜于制成靶向给药系统，胰岛素更宜于制成自调式或脉冲式给药系统等。虽然，在相当长的时期内，第二代剂型仍将是人们使用的主要剂型，但是第二代剂型会不断与第三、第四代等新剂型、新技术相结合，形成具有新内容的给药系统。

## 同步测试

### 一、简答题

1. 什么叫剂型？为什么要将药物制成剂型应用？
2. 药剂的基本质量要求是什么？主要工作依据有哪些？
3. 按分散系统和给药途径分别将剂型分成哪几类？

### 二、单项选择题

1. 有关《中国药典》正确的叙述是（ ）。
  - A. 由一部、二部和三部组成
  - B. 一部收载西药，二部收载中药
  - C. 分一部和二部，每部均由索引、正文和附录三部分组成
  - D. 分一部和二部，每部均由凡例、正文和附录三部分组成
  - E. 一部收载西药，二部收载生物药
2. 《中国药典》最新版本为（ ）。
 

A. 1995 年版	B. 2000 年版	C. 2002 年版
D. 2003 年版	E. 2010 年版	
3. 药品质量管理规范是（ ）。
 

A. GMP	B. GSP	C. GLP
D. GAP	E. GRP	
4. 不具法律性质的是（ ）。
 

A. 药典	B. 部颁标准	C. GMP
-------	---------	--------