

药学专业 本科生复习考试 指导丛书
研究生入学考试

主编 武凤兰 周建平
曹德英 杨 丽

药剂学 应试指南

- 供本科生复习考试用
- 供研究生入学考试用
- 供同等学力人员申请硕士学位考试用

北京大学医学出版社

R9
2009
1

药学专业 本科生复习考试
研究生入学考试 指导丛书

药剂学应试指南

主 编 武凤兰 周建平 曹德英 杨 丽

编 委 (按姓氏笔画排序)

王学清 (北京大学药学院)

吕慧侠 (中国药科大学)

李守唐 (兰州大学药学院)

李维凤 (西安交通大学药学院)

杨 丽 (沈阳药科大学)

张 烜 (北京大学药学院)

张典瑞 (山东大学药学院)

张淑秋 (山西医科大学药学院)

武凤兰 (北京大学药学院)

周田彦 (北京大学药学院)

周建平 (中国药科大学)

曹德英 (河北医科大学药学院)

滕 亮 (新疆医科大学药学院)

图书在版编目 (CIP) 数据

药剂学应试指南/武凤兰, 周建平, 曹德英等主编. —北京: 北京大学医学出版社, 2009. 1

ISBN 978-7-81116-140-3

I. 药… II. ①武…②周…③曹 III. 药剂学—医学院校—教学参考资料 IV. R94

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2007) 第 190643 号

药剂学应试指南

主 编: 武凤兰 周建平 曹德英 杨丽

出版发行: 北京大学医学出版社 (电话: 010-82802230)

地 址: (100191) 北京市海淀区学院路 38 号 北京大学医学部院内

网 址: <http://www.pumpress.com.cn>

E - mail: booksale@bjmu.edu.cn

印 刷: 莱芜市圣龙印务有限责任公司

经 销: 新华书店

责任编辑: 张彩虹

责任校对: 杜 悦

责任印制: 郭桂兰

开 本: 787mm×1092mm 1/16

印张: 28.5

字数: 730 千字

版 次: 2009 年 1 月第 1 版 2009 年 1 月第 1 次印刷

印数: 1 - 3000 册

书 号: ISBN 978-7-81116-140-3

定 价: 45.00 元

版权所有 违者必究

(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

前 言

药剂学是药学专业尤其是药剂学专业的主要专业课程之一，居药剂学专业课程群之首。在医药科技飞速发展的今天，药剂学学科得到更加深入的发展，为此，《药剂学》教材在加强基本理论、基本知识和基本技能的原则下，为适应新的要求，不断地充实与更新教学内容。目前高等医药院校本科教学使用的《药剂学》教材，除人民卫生出版社出版的第五版《药剂学》教材外，一些院校根据自身教学的需要，编写了具有不同特点的《药剂学》教材及参考书。为了配合药剂学课程教学，我们组织编写了《药剂学应试指南》一书，主要供在读本科生及报考药剂学专业硕士学位的考生学习《药剂学》课程时，在复习各章内容的基础上，更好地掌握各章的要点与难点，并进行自我水平测试。此外，本书也可用于教师备课及指导学生复习与考试命题。

《药剂学应试指南》全书共分三部分。第一部分由 22 章构成，每章分为内容精讲、复习思考题、测试题与参考答案。内容精讲是对一章主要内容进行归纳、梳理，使内容更加条理化，便于学生掌握。复习思考题集中体现了近年来新出版的一些药剂学教材及教学参考书的基本要求，以标题与问题的形式列出，作为本章的重点复习内容。测试题分为翻译并解释名词与术语、填空题、单项与多项选择题、判断是非题、简答与计算题、处方分析、工艺简述及处方与工艺的设计，对每章内容从不同角度、以不同形式进行训练，使学生更好地把握各章的基本内容与要求，加深对基本理论与基本知识的理解，以提高学生的应试能力。同时，为提高学生的专业英语水平，在内容精讲部分的各章中，剂型、一些辅料与添加剂、技术与方法等给出了英文专业名词与术语，在测试题中也有英文命题。参考答案可帮助学生复习的效果进行自我检查与评价。第二、第三部分分别为“本科生药剂学考试样卷”与“硕士学位研究生入学考试药剂学模拟试题”。“本科生药剂学考试样卷”由国内九所医药院校提供，共 9 套样卷。“硕士学位研究生入学考试药剂学模拟试题”由国内八所医药院校提供，共 11 套试题。这两部分内容为考生顺利通过药剂学课程的考试及参加药剂学专业硕士研究生入学考试提供指导与帮助。

本书由北京大学药学院、中国药科大学、沈阳药科大学、河北医科大学药学院、山西医科大学药学院、山东大学药学院、西安交通大学药学院、新疆医科大学药学院、兰州大学药学院共同编写完成。对本书的疏漏与不足之处，敬请读者提出宝贵意见。

编者

目 录

第一章 绪论..... (1)	五、药物稳定性试验方法..... (30)
内容精讲..... (1)	六、药物制剂的物理稳定性和微生物学稳定性..... (32)
一、药剂学的概念..... (1)	复习思考题..... (33)
二、药剂学的重要性..... (1)	测试题..... (33)
三、药物制剂的分类与命名..... (1)	测试题参考答案..... (42)
四、药剂学的任务与发展..... (3)	第四章 药用高分子与流变学..... (47)
五、药剂学的分支学科..... (5)	内容精讲..... (47)
六、药典与处方..... (5)	一、药用高分子材料..... (47)
七、新药与新制剂的注册管理办法..... (6)	二、流变学..... (52)
八、药品生产质量管理规范与药品安全试验管理规范..... (7)	复习思考题..... (54)
复习思考题..... (8)	测试题..... (55)
测试题..... (8)	测试题参考答案..... (62)
测试题参考答案..... (12)	第五章 表面活性剂..... (67)
第二章 增加药物溶解度的方法..... (15)	内容精讲..... (67)
内容精讲..... (15)	一、表面活性剂的定义与结构特征..... (67)
一、药物的溶解与溶解过程..... (15)	二、常用表面活性剂的分类..... (67)
二、溶解度及其表示方法..... (15)	三、表面活性剂的基本性质..... (69)
三、影响药物溶解度与溶解速度的因素..... (15)	四、表面活性剂的应用..... (71)
四、溶解度的测定..... (17)	复习思考题..... (72)
五、增加药物溶解度的方法..... (17)	测试题..... (72)
复习思考题..... (18)	测试题参考答案..... (79)
测试题..... (18)	第六章 液体制剂..... (84)
测试题参考答案..... (21)	内容精讲..... (84)
第三章 药物制剂的稳定性..... (24)	一、概述..... (84)
内容精讲..... (24)	二、液体制剂的溶剂和附加剂..... (85)
一、概述..... (24)	三、低分子溶液剂..... (88)
二、制剂中药物的化学降解途径..... (24)	四、高分子溶液剂..... (90)
三、影响药物降解的因素及稳定措施..... (26)	五、溶胶剂..... (92)
四、固体制剂化学稳定性的特点与降解动力学..... (29)	六、混悬剂..... (93)
	七、乳剂..... (97)
	八、其他液体制剂..... (103)
	九、液体制剂的包装与贮存..... (104)

复习思考题.....	(104)	复习思考题.....	(192)
测试题.....	(105)	测试题.....	(192)
测试题参考答案.....	(112)	测试题参考答案.....	(202)
第七章 灭菌与无菌制剂 I (注射剂与 输液剂)	(118)	第十一章 固体制剂 II (片剂)	(207)
内容精讲.....	(118)	内容精讲.....	(207)
一、灭菌与空气净化.....	(118)	一、片剂的概念和特点.....	(207)
二、注射剂.....	(125)	二、片剂的分类.....	(207)
三、输液剂.....	(132)	三、片剂的常用辅料.....	(208)
复习思考题.....	(133)	四、片剂的制备.....	(211)
测试题.....	(133)	五、片剂成型的影响因素.....	(212)
测试题参考答案.....	(151)	六、片剂制备中可能发生的问题 及其原因分析.....	(212)
第八章 灭菌与无菌制剂 II (眼用制剂 与无菌粉末制品)	(159)	七、片剂的包衣.....	(213)
内容精讲.....	(159)	八、片剂的质量检查.....	(214)
一、眼用制剂.....	(159)	九、片剂的包装.....	(214)
二、无菌分装粉末.....	(160)	复习思考题.....	(215)
三、其他灭菌与无菌制剂.....	(162)	测试题.....	(215)
复习思考题.....	(163)	测试题参考答案.....	(227)
测试题.....	(163)	第十二章 软膏剂	(233)
测试题参考答案.....	(167)	内容精讲.....	(233)
第九章 粉体学基础	(170)	一、概述.....	(233)
内容精讲.....	(170)	二、软膏剂的基质.....	(233)
一、粉体的基本性质.....	(170)	三、软膏剂的附加剂.....	(235)
二、粉体的密度与孔隙率.....	(172)	四、软膏剂的制备.....	(236)
三、粉体的流动性与充填性.....	(173)	五、软膏剂的质量检查.....	(237)
四、粉体的吸湿性与润湿性.....	(174)	六、软膏剂的包装与贮存.....	(238)
五、粉体的黏附性与凝聚性.....	(174)	七、眼膏剂.....	(238)
六、粉体的压缩性质.....	(175)	八、凝胶剂.....	(238)
复习思考题.....	(176)	复习思考题.....	(239)
测试题.....	(176)	测试题.....	(239)
测试题参考答案.....	(182)	测试题参考答案.....	(245)
第十章 固体制剂 I (散剂、颗粒剂、 胶囊剂、滴丸剂)	(187)	第十三章 栓剂	(248)
内容精讲.....	(187)	内容精讲.....	(248)
一、固体制剂概述.....	(187)	一、栓剂的概念.....	(248)
二、散剂.....	(187)	二、栓剂的种类和特点.....	(248)
三、颗粒剂.....	(190)	三、栓剂的质量要求.....	(248)
四、胶囊剂.....	(190)	四、栓剂的基质与添加剂.....	(248)
五、滴丸剂.....	(191)	五、栓剂处方的设计.....	(250)
		六、栓剂的制备.....	(251)
		七、栓剂的质量评价与包装.....	(252)

复习思考题.....	(253)	测试题参考答案.....	(298)
测试题.....	(254)	第十七章 制剂新技术	(305)
测试题参考答案.....	(256)	内容精讲.....	(305)
第十四章 膜剂与涂膜剂	(259)	一、固体分散体	(305)
内容精讲.....	(259)	二、微囊	(307)
一、膜剂的定义、分类与特点	(259)	二、包合物	(309)
二、成膜材料	(259)	复习思考题.....	(311)
三、膜剂的制备工艺	(260)	测试题.....	(311)
四、膜剂的质量要求	(261)	测试题参考答案.....	(315)
五、涂膜剂	(261)	第十八章 靶向制剂	(318)
复习思考题.....	(261)	内容精讲.....	(318)
测试题.....	(262)	一、靶向制剂的概念与分类 ..	(318)
测试题参考答案.....	(264)	二、被动靶向制剂	(318)
第十五章 气雾剂	(266)	三、主动靶向制剂	(327)
内容精讲.....	(266)	四、物理化学靶向制剂	(329)
一、气雾剂的概念	(266)	复习思考题.....	(330)
二、气雾剂的特点	(266)	测试题.....	(330)
三、气雾剂的分类	(267)	测试题参考答案.....	(335)
四、气雾剂中药物的吸收	(267)	第十九章 经皮给药系统	(339)
五、延长药物在肺部滞留时间的制剂学方法	(268)	内容精讲.....	(339)
六、气雾剂的组成	(268)	一、概述	(339)
七、气雾剂的制备	(269)	二、药物的经皮吸收	(340)
八、气雾剂的质量评价	(272)	三、经皮吸收制剂的设计与研究	(341)
九、喷雾剂	(273)	四、经皮吸收制剂的制备	(342)
十、粉雾剂	(273)	复习思考题.....	(343)
复习思考题.....	(274)	测试题.....	(344)
测试题.....	(274)	测试题参考答案.....	(346)
测试题参考答案.....	(279)	第二十章 生物技术药物制剂	(348)
第十六章 缓释、控释制剂	(282)	内容精讲.....	(348)
内容精讲.....	(282)	一、概述	(348)
一、概述	(282)	二、生物技术药物的结构特点与理化性质	(348)
二、释药原理和方法	(283)	三、蛋白质类药物制剂的处方设计与工艺	(351)
三、处方与工艺设计	(285)	四、蛋白质类药物的释放系统	(354)
四、制备	(287)	五、蛋白质类药物制剂质量评价的方法	(356)
五、常用辅料	(289)	复习思考题.....	(356)
六、体内外评价	(290)		
复习思考题.....	(291)		
测试题.....	(292)		

测试题.....	(356)	测试题参考答案.....	(382)
测试题参考答案.....	(358)	本科生药剂学考试样卷.....	(385)
第二十一章 药物制剂的设计	(361)	试题一	(385)
内容精讲.....	(361)	试题二	(387)
一、药物制剂设计的目的与 主要内容	(361)	试题三	(391)
二、药物制剂设计的基础	(361)	试题四	(395)
三、药物制剂的处方前研究 ...	(364)	试题五	(400)
四、药物制剂处方的优化设计	(367)	试题六	(403)
五、药品包装的设计原则	(368)	试题七	(408)
六、新药制剂的研究与申报 ...	(368)	试题八	(412)
复习思考题.....	(369)	试题九	(415)
测试题.....	(369)	硕士学位研究生入学考试药剂学	
测试题参考答案.....	(371)	模拟试题.....	(421)
第二十二章 浸出制剂	(375)	试题一	(421)
内容精讲.....	(375)	试题二	(424)
一、浸出制剂的概念、特点与 分类	(375)	试题三	(426)
二、浸提原理与影响因素	(375)	试题四	(427)
三、常用的浸提方法与设备 ...	(377)	试题五	(428)
四、常用的浸出制剂	(378)	试题六	(431)
复习思考题.....	(379)	试题七	(435)
测试题.....	(379)	试题八	(438)
		试题九	(442)
		试题十	(444)
		试题十一	(446)

第一章 绪 论

内容精讲

一、药剂学的概念

药剂学 (pharmaceutics) 是研究药物制剂的处方设计、基本理论、制备工艺、质量控制和合理应用的综合性技术科学。制剂学是研究制剂生产工艺技术及相关理论的科学, 调剂学是研究方剂的调配技术与服用方法的科学, 制剂学与调剂学也往往总称为药剂学。

任何一种药物 (drug), 包括化学原料药、抗生素原料药、生物制品、中药提取的有效成分与有效部位、基因药物等, 用于防病治病, 必须制成适合患者应用的适宜的给药形式, 即称为药物的剂型 (dosage form), 如片剂、注射剂、软膏剂等。剂型是一类制剂的集合名词, 同一种药物可以制成不同的剂型, 用于不同的给药途径。药物制剂 (preparation) 或称为制剂, 是根据国家药品标准将某种药物制成适合临床需要与要求, 并符合一定质量标准的药物的具体应用形式, 是剂型中的具体品种, 即通常讲的药品。

二、药剂学的重要性

药品是特殊商品。药剂学研究是药品研究的最后一环, 药物制剂是医药工业的最终产品, 是药物研究开发的最终体现, 药品的质量、疗效、安全性和稳定性均与药剂学研究密切相关。药物制剂的生产是集药物、辅料、工艺、设备、技术为一体的系统工程, 如某些药物可因处方、辅料、制备工艺等差异, 可能导致制剂无效、低效、高效或引起毒副反应。

剂型是药剂学中研究的重要内容, 任何一种药物都必须以某种剂型的形式用于防病治病。同一种药物因剂型不同, 其吸收的速度、程度、靶向性或药理作用均不相同, 因而生物利用度也不同。剂型的重要性与作用具体表现为: 剂型可以改变药物的作用性质; 剂型能够改变药物的作用速度; 改变剂型可降低药物的毒副作用; 剂型可产生靶向作用; 剂型可影响药物的疗效。

医药产业是当今四大重点技术创新产业之一, 在国民经济的发展中占有举足轻重的地位, 可以说一个国家的制剂工业是国民经济发展的缩影, 药物制剂较其原料药的经济效益会成倍增加, 即所谓附加值很高, 所以各国都非常重视药物制剂工业的发展。在我国, 制剂企业已占制药工业总数的 70% 左右, 工业总产值和实现利税均占制药工业的 60% 以上。

三、药物制剂的分类与命名

(一) 药物制剂的分类

1. 按制剂形态分类 可分为液体剂型、固体剂型、半固体剂型和气体剂型。制剂的形态相同时, 制备方式比较接近。不同形态的制剂起效的速率和作用时间往往不同, 一般液体制剂起效最快, 而固体制剂则起效较慢。此分类法的特点是简单明了, 对制备、贮藏和运输

有一定实际意义，但不足之处是没有给出制剂的内在特性和给药途径的信息。

2. 按分散系统分类 分散相分散于分散介质中形成的系统称为分散系统。药物制剂按分散系统可分为溶液型、胶体溶液型、乳状液型、混悬液型、气体分散型、固体分散型等。此分类法的特点是将所有的剂型看作分散系统，可以反映出制剂的分散状态以及对制法的一般要求，但不足之处是不能反映给药途径对制剂的要求，有时一种剂型由于辅料与制法的不同，可能同时属于不同的分散系统，如注射剂就有溶液型、混悬液型、乳状液型及固体分散型等。

3. 按给药途径分类 人体的给药途径包括口腔与消化道、呼吸道、其他腔道、血管、组织和其他部位等。可分为四类：口服给药、注射给药、皮肤给药、黏膜给药。此分类法的特点是与临床使用关系比较密切，能反映给药途径对于剂型制备的特殊要求，缺点是一种制剂由于给药途径的不同，可能多次出现，如氯化钠溶液可以是注射剂、滴眼剂、含漱剂或灌肠剂等。

此外，还有按制法分类的，主要是无菌制剂与灭菌制剂。

(二) 药物制剂的命名

1. 剂型的命名

(1) 按形状命名：片剂、胶囊剂、散剂（粉剂）、软膏剂、栓剂、气雾剂、乳剂、混悬剂、溶液剂等。

(2) 按给药途径命名：输液剂、注射剂、滴眼剂、滴鼻剂、贴剂、滴剂、洗剂、搽剂、灌肠剂和植入剂等。

(3) 形状与给药途径结合命名：注射用粉末剂、眼膏剂、鼻腔喷雾剂、阴道用栓剂、混悬型滴眼剂等。

(4) 形状与功能结合命名：缓释胶囊、缓释微球注射剂、控释片、渗透泵片、分散片、泡腾颗粒、结肠定位胶囊等。

(5) 按给药系统命名：速释给药系统、缓释给药系统、控释给药系统、经皮吸收给药系统、结肠定位给药系统、靶向给药系统等。

2. 制剂的命名

(1) 常规命名：规则是原料药名在前，剂型名称在后，单方制剂常用此规则，如磺胺嘧啶片、吡哆美辛胶囊、庆大霉素注射液、沙丁胺醇气雾剂、红霉素肠溶胶囊、硝苯地平渗透泵片等。如果有关于用途或特点的词汇时，一般用途或特点的词汇在前，药名在后，后可加制剂名，如注射用头孢呋辛钠、胶体酒石酸锑胶囊等。

(2) 复方制剂命名：对复方制剂的命名现已有新的规定。两个组分的制剂，原则上将两个药名并列，后加剂型名，如头孢他啶舒巴坦钠注射液、克拉维酸钾羟氨苄西林片等；三个组分的制剂，原则上从每个药名中取一到两个字（不用词干）并列组成，后加剂型名，如阿咖酚散（阿司匹林、咖啡因、乙酰氨基酚组成的复方散剂）；四个组分的制剂，原则上从每个药名中取一个字（不用词干）并列组成，后加剂型名，如氨非咖敏片（乙酰氨基酚、非那西丁、咖啡因、安苯那敏组成的复方片剂）；四个以上组分的制剂，前加复方两字，从两至三个药名中各取一至两个字并列组成，后加剂型名，如复方甲氧非那敏片等。

四、药剂学的任务与发展

（一）药剂学的任务

药剂学的基本任务是将药物制成适合临床需要与要求，并符合一定质量标准的制剂，以保证临床用药的安全、有效与质量可控。其主要任务有以下几方面。

1. 研究药剂学的基本理论与新技术 研究药剂学的基本理论和新技术将进一步促进药剂学的深入发展，而且对提高制剂生产的技术水平，对研制安全、有效、稳定和用药方便的药物制剂具有重要意义。药剂学中常涉及的基本理论包括流变学理论、增溶与助溶理论、片剂成型理论、释药动力学理论、分散体系的理论、化学动力学理论、表面现象和生物药剂学知识等；药剂学中常涉及的新技术包括微粉化技术、固体分散技术、包合技术、缓释与控释技术、乳化与微乳化技术、微囊化技术、纳米技术、脂质体制备技术、靶向给药技术、经皮给药技术、智能给药技术、生物技术药物制剂的制备技术、基因输送技术等。

2. 开发新剂型和新制剂 积极开发新剂型是药剂学的一个重要任务。普通剂型已很难满足高效、低毒、定时、定量和定位等的要求，新型给药系统可以提高药物的有效性，减低血药浓度的峰谷现象，延长药物的体内作用时间，增加药物对靶组织的选择性等，提高了药物疗效，降低了毒副作用，因此，大力开发新剂型和新制剂在药剂学研究中占有非常重要的位置。目前，进一步丰富和发展中药新剂型和新品种，改变国际市场上中药只占极小份额的局面是非常重要的任务。另外，生物技术药物发展迅速，其制剂的研究却相对滞后。如何运用药剂学的手段，研究蛋白多肽药物的非注射给药系统和载体给药系统等，解决生物技术药物吸收差、半衰期短、不稳定的问题，是药剂学工作者的一项新课题。

3. 开发新型的药用辅料 没有优质的辅料就没有优质的药品。目前药用辅料的种类很多，但仍然满足不了制剂工业发展对新辅料的需要。如 PLA（聚乳酸）和 PLGA（聚乙交酯丙交酯），国外已用于缓释微球的生产，而我国尚无药用的品种。我国辅料开发的落后，严重影响我国制剂工业的发展。发达国家几种主要剂型所用的辅料就达三百余种，药典收录的品种也较多。辅料的研发和生产在药物制剂中所占的位置将越来越重要。

4. 开发新型的制药机械和质控设备 没有先进的设备就没有高质量的药品。研究和开发新型制药机械和质控设备，对发展新剂型和新工艺、提高制剂质量、提高生产效率、降低生产成本、改变生产环境、缩短同国际先进国家的差距等都具有重要意义。目前，制药设备正向着一机多用、密闭式、多机联动和高度自动控制等方向发展，而质控设备的发展趋势是精密度和效率更高、信息量更大、应用面更广、操作更方便、工作时间更长。

（二）药剂学的发展

现代药剂学正是在传统制剂的基础上发展起来的。1983 年 Tomlinson 将现代药物制剂的发展过程划分为四个时代。第一代药物制剂包括片剂、注射剂、胶囊剂、气雾剂等，即所谓的普通制剂，这一时期主要是从体外试验控制制剂的质量。第二代药物制剂为口服缓释制剂或长效制剂，开始注重疗效与体内药物浓度的关系，即定量给药问题，这类制剂不需要频繁给药、能在较长时间内维持体内药物有效浓度。第三代药物制剂为控释制剂，包括透皮给药系统、脉冲式给药系统等。第四代药物制剂为靶向给药系统，目的是使药物浓集于靶器官、靶组织或靶细胞中，强调药物定位给药，可以提高疗效并降低毒副作用。也有人将智能给药系统称为第五代药物制剂。

（三）药剂学的研究进展

随着科学技术的飞速发展，各学科之间相互渗透和促进，新辅料、新设备、新技术和新理论不断涌现，极大地促进了药物新剂型的发展和完善。20 世纪 90 年代以来，药物新剂型与新技术已进入了一个新的阶段。

1. 药物普通剂型 虽然各种新型给药系统迅速发展，但目前临床用药中仍以片剂、注射剂、胶囊剂等常规剂型为主，片剂、注射剂和胶囊剂的产量仍将排在各剂型的前列。在将来很长一段时期内，这些常规剂型仍将发挥极其重要的作用。一方面这些常规剂型是制剂的基本形式，新的给药系统多数仍然需要使用这些剂型。另外，随着新技术、新材料、新设备的出现与应用，这些常规剂型本身无论是在外观指标上还是在内在质量上均在不断地改进与完善之中，保证了用药的有效性和安全性。

2. 药物新型给药系统 药物新型给药系统（new drug delivery systems, DDS）是现代科学技术发展与进步的结果。近年来新型给药系统在理论研究、剂型设计及制备方法等多方面都得到迅速发展，品种不断增加，在临床治疗中正在发挥日益重要的作用。

（1）口服缓、控释给药系统：口服缓、控释给药系统是指能在体内延长药物作用、减少服药次数的一类新型药物制剂。由于研究时间较长，口服缓释/控释给药系统在理论与技术上已比较成熟。目前，口服缓、控释给药系统一直是 DDS 的主流，其市场占有率达 DDS 的 50%。口服缓、控释给药系统又可进一步分为定速、定位与定时释放系统。

（2）经皮给药系统：经皮给药系统（transdermal drug delivery systems）也称透皮治疗系统（transdermal therapy systems, TTS），是通过皮肤敷贴给药使药物通过皮肤角质层的屏障而进入体内，维持稳定和长时间的有效血药浓度，达到全身治疗作用的目的。目前正在开发研究新的渗透促进剂及新的促渗技术，如离子导入技术、电致孔技术、超声波导入技术、激光技术、柔性脂质体技术、无针注射给药技术和微针技术等，其中超声波导入技术在海外理疗时应用较多，而离子导入技术已有产品问世，微针技术可能在近期推出产品。由于新技术的应用，经皮给药系统可能不再限于传统的小分子药物，因此应用前景非常广阔。

（3）靶向给药系统：靶向给药系统（targeting drug delivery system）也称靶向制剂，一般是指经由血管注射给药，通过特殊的载体或弹头将药物输送至特定部位（靶部位）的给药系统。有人将靶向给药系统分为三级：一级是将药物输送至特定的组织或器官（如肝）；二级是将药物输送至特定组织器官的特定部位（如肝中的肝癌部位）；三级是将药物输送至病变部位的细胞内（如肝癌细胞），故也称为细胞内靶向。按方式不同，还可将靶向制剂分为被动靶向制剂（如微粒给药系统等）、主动靶向制剂（如抗体介导的靶向制剂等）和物理化学靶向制剂（如磁导向制剂等）三大类。

（4）生物技术药物给药系统：生物技术是 21 世纪最具主导地位的高新技术之一。生物技术药物主要包括重组细胞因子药物、重组激素类药物、重组溶栓药物、基因工程疫苗、治疗性抗体、基因药物和反义核苷酸等，大多是蛋白多肽类药物。近年来已有近一百种生物技术药品问世。其发展速度快，前景非常广阔。蛋白多肽类药物的特点是：大多为内源性物质，用量小，活性高，副作用少。但对酸碱和酶的稳定性差，分子量大，吸收少，一般只能注射给药，而且大多半衰期很短。目前市售的生物技术药物主要是普通注射剂，包括溶液型（或混悬型）注射剂和注射用无菌粉末。现已开发成功控释型注射给药系统，包括控释微球制剂和控释植入剂，如曲普瑞林 PLGA 缓释微球，可缓慢释药 1 个月。一次注射的疫苗微球已取得很大进展。对蛋白质、多肽类药物的口服与黏膜给药系统的研究很广泛，其中对口服

服给药的研究最早最多，也最具有挑战性；对鼻腔给药的研究比较成功，已有相当数量的蛋白质、多肽类药物的鼻腔给药系统（如降钙素、催产素、去氧加压素等）上市；肺部给药也显示出较好的应用前景，如胰岛素的肺部给药系统已进入Ⅲ期临床研究；蛋白质、多肽类药物透皮给药系统的研究也有很多报道。

（5）中药新型给药系统：近年来，随着现代药剂学及有关药学科学的发展，全新研究手段及现代技术不断应用于中药制剂的研究和生产，使中药制剂突破了常规的传统观念，品种不断发展，工艺技术不断优化，成品质量不断提高，正在向高效、速效、长效、低毒、易携带、易服用、易保存的方向健康发展，为中药制剂的进一步发展开拓了广阔的前景。

五、药剂学的分支学科

（1）工业药剂学（industrial pharmaceutics）：是研究药物制剂在工业生产中的基本理论、技术工艺、生产设备和质量管理的科学。

（2）物理药剂学（physical pharmacy）：是运用物理化学的原理、方法和手段研究药剂学中有关处方设计、制备工艺、剂型特点、质量控制等内容的边缘科学。

（3）生物药剂学（biopharmaceutics）：是研究药物在体内的吸收、分布、代谢与排泄的机制及过程，阐明药物因素、剂型因素和生理因素与药效之间关系的边缘科学。

（4）药用高分子材料学（polymer science in pharmaceutics）：是研究各种药用高分子材料的合成方法、结构、性能与应用的科学。

（5）药物动力学（pharmacokinetics）：采用数学方法，研究药物及代谢物在生物体内的吸收、分布、代谢与排泄的经时过程的科学。

（6）临床药学（clinical pharmacy）：是一门以病人为对象，研究合理、有效与安全用药的科学。

六、药典与处方

（一）药典（pharmacopoeia）

药典是一个国家记载药品规格、标准的法典。它由国家组织的药典委员会编写，并由政府颁布施行，具有法律约束力。药典收载药效确切、副作用小、质量稳定的常用药物及其制剂，并规定其质量标准、制备要求、鉴别方法、杂质检查与含量测定等。药典可作为药品生产、检验、销售与使用的依据，在一定程度上可以反映一个国家的药品生产、医疗和科学技术水平。药典在保证人民用药安全有效、促进药品研究和生产方面有重大作用。药典出版后，每隔几年须修订一次，为了使新的药物和制剂能及时地得到补充和修改，往往在下一版药典出版前，出版一些增补本。

1. 中华人民共和国药典（Chinese Pharmacopoeia） 中华人民共和国第一部药典（以下简称中国药典）为1953年版。此后随着国家药物及其制剂的发展不断进行修订，先后有1963年、1977年、1985年、1990年、1995年、2000年与现行的2005年版中国药典。中国药典一般分为上、下两部，上部收载中药材及其中药制剂，下部收载化学药、生化药、抗生素、放射性药品、生物制品及其各类制剂。现行的2005年版中国药典分为一、二、三部。一部收载中药材及其中药制剂；二部收载化学药、生化药、抗生素、放射性药品及其制剂；三部收载生物制品及其各类制剂。

中国药典由凡例、正文和附录等部分构成。附录包括制剂通则和通用的检查方法。在制

剂通则中规定了各种剂型的概念、一般标准和常规检查方法等。2000 年版中国药典二部附录中，首次收录了药品标准分析方法验证等六项指导原则，对统一和规范药品标准试验方法有重要的指导作用。

2. 其他国家药典

(1) 美国药典 (Pharmacopoeia of the United States, USP): 现行版为第 XXVIII 版 (2005 年)。

(2) 英国药典 (British Pharmacopoeia, BP): 现行版为 2003 年版。

(3) 日本药局方 (Pharmacopoeia of Japan, JP): 现行版为第 XIV 改正版，即 2000 年版。

(4) 国际药典 (Pharmacopoeia Internationalis, Ph. Int): 由世界卫生组织 (WHO) 为统一世界各国药品的质量标准和质量控制的方法而编纂。

(二) 国家药品标准

国家药品标准与中国药典一样，具有同样的法律效力。国家药品标准包括：原《中华人民共和国卫生部药品标准》与《国家食品药品监督管理局药品标准》（现行由国家食品药品监督管理局审批的各类新的药品）及药典曾刊载而现行版药典未列入，仍在生产、使用但需修订标准的药品。

(三) 处方、处方药与非处方药

1. 处方的概念与分类 处方是指医疗与生产部门用于药剂调制的一项重要书面文件。可分为三类：

(1) 法定处方：主要指中国药典、国家药品标准收录的处方，具有法律效力，在制造或医师开写法定制剂时，均需遵照其规定。

(2) 协定处方：一般是根据某一地区或某一医院日常医疗用药的需要，由医院药剂科与医师协商共同制订的处方，同样具有法律意义。

(3) 医师处方：医师处方是医师对个别病人用药的书面文件。处方除了作为发给病人药剂的书面凭证之外，还具有法律、技术和经济上的意义。

2. 处方药与非处方药 凡必须凭医师处方才可配制、购买和使用的药品称处方药 (prescription drug or ethical drug)，而患者不需要凭医师处方即可自行判断、购买和使用的药品称非处方药 (over the counter, OTC)。处方药与非处方药的区别只是管理上的界定，是国际上通行的管理模式，不是药品本质属性上的差异与分类。所有药品都是经过 SFDA 批准，其安全性与有效性是有保障的。

七、新药与新制剂的注册管理办法

《药品注册管理办法》分别规定了中药与天然药物、化学药品、生物制品的注册分类及申报资料项目的要求等。

(一) 化学药品的注册分类

(1) 未在国内外上市销售的药品：包括：① 通过合成或半合成的方法制得的原料药及其制剂；② 天然物质中提取或者通过发酵提取的有效单体及其制剂；③ 用拆分或合成的方法制得的已知药物中的光学异构体及其制剂；④ 由已上市销售的多组分药物制备为较少组分的药物；⑤ 新的复方制剂。

(2) 改变给药途径且未在国内外上市销售的制剂。

(3) 已在国外上市销售，尚未在国内上市销售的药品：包括：① 已在国外上市销售的原料药及其制剂；② 已在国外上市销售的复方制剂；③ 改变给药途径，已在国外上市销售的制剂。

(4) 改变已上市销售盐类药物的酸根、碱基（或金属元素），但不改变其药理作用的原料药及其制剂。

(5) 改变国内已上市销售的药品的剂型，但不改变给药途径的制剂。

(6) 已有国家药品标准的原料药或制剂。

(二) 新药制剂的申报

新药制剂的申报与新药的申报一样，分为两个阶段，即申报临床（临床前研究完成后）与申报生产（临床研究完成后）。新药制剂的申报资料包括以下四个部分：

1. 综述资料 包括：① 药品名称；② 证明性文件；③ 立题目的与依据；④ 对主要研究结果的总结与评价；⑤ 药品说明书样稿起草说明及最新参考文献；⑥ 包装、标签设计样稿。

2. 药学研究资料 包括：① 药学研究资料综述；② 制剂处方及工艺的研究资料及文献资料；③ 确证化学结构或组分的试验资料及文献资料；④ 质量研究工作的试验资料及文献资料；⑤ 药品标准草案及起草说明，并提供标准品或对照品；⑥ 样品的检验报告书；⑦ 辅料的来源及质量；⑧ 药物稳定性研究的试验资料及文献资料；⑨ 直接接触药品的包装材料和容器的选择依据及质量标准。

3. 药理毒理研究资料 包括：① 药理毒理研究资料综述；② 主要药效学试验资料及文献资料；③ 一般药理研究的试验资料及文献资料；④ 急性毒性试验资料及文献资料；⑤ 长期毒性试验资料及文献资料；⑥ 过敏性（局部、全身和光敏毒性）、溶血性和局部（血管、皮肤、黏膜、肌肉等）刺激性等主要与局部、全身给药相关的特殊安全性试验资料及文献资料；⑦ 复方制剂中多成分药效、毒性、药代动力学相互影响的试验资料及文献资料；⑧ 致突变试验资料及文献资料；⑨ 生殖毒性试验资料及文献资料；⑩ 致癌试验资料及文献资料；⑪ 依赖性试验资料及文献资料；⑫ 药代动力学相互影响的试验资料及文献资料。

4. 临床研究资料 包括：① 国内外相关的临床研究资料综述；② 临床研究计划与研究方案；③ 临床研究者手册；④ 知情同意书样稿、伦理委员会批件；⑤ 临床研究报告。

(三) 新的药物制剂的主要研究内容

在新药制剂的开发研究中，主要涉及药学部分的研究内容，其中资料第2项，即制剂处方及工艺的研究资料及文献资料是研究的重点内容。处方筛选过程中应设计多个基本合理、不同的处方，尽量采用量化的适宜的科学指标进行比较，以获得最佳处方。对于结构全新的药物，应充分考察主药与各种辅料间的相互作用。在制备工艺的筛选过程中应设计不同的工艺参数，用科学指标进行比较，以获取最佳工艺。

八、药品生产质量管理规范与药品安全试验管理规范

(一) 药品生产质量管理规范

药品生产质量管理规范（good manufacturing practice, GMP）是 WHO 制订的世界医药工业生产和药品质量管理的指南与准则，是国际医药贸易相互监督与检查的统一标准。我国的 GMP 于 1982 年开始试行，后经不断修改与完善，1999 年由国家药品监督管理局重新颁布实施。颁布的《药品生产质量管理规范》（1998 年修订）共 14 章 88 条，对于从事药品

生产的人员及厂房、设备、卫生条件、原料、辅料、包装材料、生产管理、包装、贴签、管理文件、质量管理部门、自检、销售记录、用户意见、不良反应报告等都有非常具体的标准与要求。同时颁布的《药品生产质量管理规范》(1998年修订)附录中对无菌药品、非无菌药品、原料药、生物制品、放射性药品、中药制剂等生产和质量管理的特殊要求作了补充规定。

(二) 药品安全试验管理规范

药品安全试验管理规范(good laboratory practice, GLP)是试验条件下进行药理和动物试验(包括体内、体外试验)的指南和准则。GLP要求在进行急性、亚急性和慢性毒性试验,生殖试验,致癌、致畸、致突变及其他毒性试验时,按统一规范的实验设计、实验方法和实验管理进行,因此GLP是保证药品安全的有效法规。我国的GLP始于1999年,目前已建立了若干个国家级的GLP实验中心。

复习思考题

1. 简述药剂学、剂型与药物制剂的概念。
2. 剂型的重要性与作用体现在哪几方面?
3. 简述复方制剂的命名原则。
4. 药剂学包括哪些分支学科?
5. 简述药典的性质与作用。
6. 处方分为几类?其如何定义?
7. 何谓处方药与非处方药?
8. 试说明中国药典的性质、构成、收载内容及常用的国外药典。
9. 化学药品的注册分为哪几类?
10. 新的药物制剂申报资料包括哪几部分?
11. 简要说明新的药物制剂的主要研究内容。
12. 我国的GMP在哪些方面提出了具体标准与要求?
13. GLP在哪些试验方面进行统一规范管理?

测试题

一、翻译并解释下列名词与术语

- | | |
|---------------------|------------------------------|
| 1. pharmaceutics | 8. 医师处方 |
| 2. dosage form | 9. GMP |
| 3. 药物制剂 | 10. GLP |
| 4. 调剂学 | 11. industrial pharmaceutics |
| 5. pharmacokinetics | 12. physical pharmacy |
| 6. 法定处方 | 13. 药典 |
| 7. 协定处方 | |

二、填空题

1. _____是根据国家药品标准将某种药物制成适合临床需要与要求，并符合一定质量标准的药物的具体应用形式，是剂型中的具体品种。
2. 药物制剂的主要的分类方法为按_____、_____与_____分类。
3. 生物药剂学是研究药物在体内的_____机制及过程，阐明_____与药效之间关系的边缘科学。
4. 药典是一个国家记载药品规格、标准的_____。
5. 药典由_____的药典委员会编写，并由_____颁布施行，具有_____。
6. 药典可作为药品_____、_____、_____与_____的依据。
7. 处方是指_____与_____中用于药剂调制的一项重要书面文件。
8. 处方可分为_____、_____与_____。
9. 中国药典由_____、_____和_____等主要部分构成。
10. 常用外国药典的缩写词分别为：美国药典_____、英国药典_____、日本药典_____。
11. 药品生产质量管理规范简称为_____。
12. 药品安全试验管理规范简称为_____。
13. 药物制剂按给药途径可分为四类：_____、_____、_____、_____。
14. 药物制剂按形态可分为_____、_____、_____与_____。
15. 药剂学是研究药物制剂的_____、_____、_____、_____的综合性技术科学。

三、选择题

(一) 单项选择题

1. 药剂学的分支学科不包括（ ）
 - A. 工业药剂学
 - B. 物理药学
 - C. 方剂学
 - D. 药物动力学
 - E. 生物药剂学
2. 药品生产、检验、销售与使用的依据是（ ）
 - A. GMP
 - B. GLP
 - C. 药品法
 - D. OTC
 - E. 药典
3. 《中华人民共和国药典》一般几年修订一次（ ）
 - A. 2 年
 - B. 5 年
 - C. 10 年
 - D. 年限不定
 - E. 3 年
4. 现行的《中华人民共和国药典》为哪年版（ ）
 - A. 2005 年
 - B. 1995 年
 - C. 2000 年
 - D. 2002 年
 - E. 1993 年
5. 下列关于剂型的错误表述是（ ）
 - A. 药物用于防病治病，必须制成适宜的给药形式，即为药物的剂型
 - B. 剂型是一类制剂的集合名词
 - C. 同一种药物可以制成不同的剂型，用于不同的给药途径
 - D. 剂型可以改变药物的作用性质
 - E. 剂型是根据国家药品标准将某种药物