

李 钧 主编

药用辅料 及其管理

YAOYONG FULIAO
JIQI GUANLI



化学工业出版社
生物·医药出版分社

李 钧 主编

药用辅料 及其管理



化学工业出版社
生物·医药出版分社

· 北 京 ·

本书简要论述药用辅料作用的重要性,按类别剂型介绍常用辅料品种,重点阐述药用辅料的注册管理和生产质量管理等方面的要求。本书可供药用辅料生产企业和制药企业作为培训教材进行全员培训,可供从事新药及药用辅料研究开发人员、药品生产企业及医院的药学技术人员和管理人员参考,也可供中、高等医药院校的师生阅读。

图书在版编目(CIP)数据

药用辅料及其管理/李钧主编. —北京:化学工业出版社, 2009. 5
ISBN 978-7-122-04939-1

I. 药… II. 李… III. 制剂辅料(医药) IV. TQ460.4

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2009)第 030047 号

责任编辑:李少华 余晓捷

文字编辑:焦欣渝

责任校对:凌亚男

装帧设计:史利平

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 刷:北京永鑫印刷有限责任公司

装 订:三河市万龙印装有限公司

720mm×1000mm 1/16 印张 14 字数 258 千字 2009 年 8 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: 39.00 元

版权所有 违者必究

编写人员名单

主编 李 钧

编者 王俊平 李志宁

李 钧

前言

药用辅料是构成药物制剂的重要部分，它赋予了药物剂型以必要的物理、化学、药理和生物学性质，对于各类药物制剂的稳定性、保证药品质量、开发新剂型和新品种、满足医疗需求等都起着重要的作用。对于每一位药学工作者来说，不仅要熟悉药理学、药物化学等专业知识，而且要重点掌握药剂学知识，其中关键的要领之一是掌握药用辅料知识。因为没有药用辅料，就没有制剂，就没有药剂学；没有新药用辅料的研究和开发，就没有药剂学的发展。

在人类社会发展的历史中，一宗宗药害事件催人警醒；在世界范围内，因为药用辅料（例如甘油、丙二醇）产品质量问题而导致的药害事件不胜枚举。70多年前的美国磺胺酞剂事件致死107人（实际上负责研发磺胺酞剂的主任化学师因不堪内疚痛苦而自杀，死亡108人），近十几年来此类药害事件也层出不穷。1996年在海地（Haiti）80多名儿童由于服用污染有二甘醇的治疗咳嗽和感冒的甘油糖浆而导致死亡；2006年巴拿马使用该国一公司购买的化工原料“替代甘油”（TD甘油）作为药用甘油而生产的甘油糖浆，最终导致上百人死亡；2006年在国内发生的“齐二药”亮菌甲素注射剂假药案，导致十几名患者死亡。这些药害事件的直接原因就是生产商在生产中没有遵循GMP规程。

由于历史的原因，国内药用辅料的生产和使用还存在诸多不规范的现象。要解决这些问题，就必须以科学发展观为理念，循序渐进，标本兼治，有重点地逐步解决。为此，本书尝试为国内药用辅料生产企业和制药企业进行全员培训提供一本培训教材，为从事新药及药用辅料研究和开发的人员、药品生产企业及医院的药学技术人员及管理人员提供一本参考书籍，为中、高等医药院校的师生提供一本课外读物。

由于笔者水平有限，书中疏漏之处，敬请专家和读者批评指正。

编者

2009年4月

目 录

第一章 药用辅料概论	1
第一节 辅料在药物剂型构成中的作用	2
一、药物剂型的分类及发展	2
二、从剂型的重要性来看辅料的重要性	5
三、药用辅料应满足药物剂型的要求	7
四、一般剂型中辅料在构成中的作用	8
五、缓释剂型中辅料在构成中的作用	8
六、控释剂型中辅料在构成中的作用	11
七、靶向给药系统中辅料在构成中的作用	12
八、药用辅料的分类	13
第二节 辅料对制剂稳定性的影响	16
一、有关药物稳定性的术语及其定义	16
二、辅料对药物的化学变化的影响	17
三、辅料对药物制剂的物理变化的影响	18
四、微生物污染引起的变化	19
五、药物制剂稳定性试验的国际技术要求	19
六、增加药物制剂的稳定性	20
第三节 辅料对药物吸收的影响	20
一、溶剂对药物吸收的影响	21
二、固体制剂辅料对药物吸收的影响	22
三、软膏及栓剂的基质对药物吸收的影响	23
四、表面活性剂辅料对药物吸收的影响	24
第四节 辅料对药物体内分布的影响	25
一、辅料与药物体内分布的动力学过程密切相关	26
二、辅料在靶向给药中发挥着重要作用	26
第五节 药用辅料是药品的重要组成部分	26
一、药用辅料是药吗?	27
二、药用辅料是药品不可缺少的要素	27
第二章 药用辅料管理概论	29
第一节 药用辅料评价注册管理	29
一、药用辅料的安全性评价	29

二、药用辅料的功效性评价	31	四、其他标准	33
三、药用辅料的质量可控性评价	31	五、完善标准体系建设,提高辅料质量水平	33
第二节 药用辅料标准管理	32	第三节 药用辅料生产质量管理	34
一、国家药典标准	32	一、国际标准的药用辅料 GMP	34
二、注册标准(部/局颁标准)	33	二、我国的药用辅料 GMP	34
三、地方标准	33		
第三章 药用辅料分类概述	37		
第一节 药用高分子辅料及表面活性剂辅料	37	应用	55
一、用作片剂及一般固体制剂的高分子辅料	38	二、湿润剂和黏合剂的应用	55
二、用作缓释、控释制剂的高分子辅料	39	三、崩解剂的应用	56
三、用作液体制剂或半固体制剂的高分子辅料	39	四、润滑剂、助流剂和抗粘剂的应用	57
四、用作生物黏附剂的高分子辅料	40	五、吸收剂的应用	58
五、常用高分子辅料简介	40	六、着色剂和芳香矫味剂的应用	58
六、表面活性剂概念	44	七、常用片剂辅料简介	58
七、表面活性剂的分类	45	八、片剂的包衣及其材料	64
八、表面活性剂的基本性质和应用	45	第四节 胶囊剂辅料	66
九、表面活性剂的生物学性质	46	一、硬胶囊剂型的制备及其所用辅料	67
十、常用表面活性剂简介	46	二、软胶囊剂型的制备及其所用辅料	68
第二节 注射剂辅料	48	三、胶囊剂辅料品种简介	69
一、注射剂的溶剂	49	第五节 微囊材料和包合材料	69
二、注射用灭菌粉末、冻干剂的赋形剂及附加剂	50	一、微囊材料的应用	70
三、常用注射剂辅料简介	51	二、微囊材料品种简介	72
第三节 片剂的辅料	54	三、包合材料的应用	73
一、填充剂(稀释剂)的		四、包合材料品种简介	74
		第六节 软膏剂基质	75
		一、软膏剂中影响药物透皮吸收的因素	75

二、软膏基质的类型组成	76	简介	93
三、软膏剂基质品种简介	77	第十三节 助溶剂和增溶剂	97
第七节 栓剂基质	80	一、增加药物溶解的方法	97
一、栓剂的作用特点及分类	80	二、助溶剂和增溶剂品种简介	99
二、栓剂基质品种简介	81	第十四节 乳化剂	102
第八节 滴丸剂基质	82	一、乳化剂的基本要求及分类	102
一、滴丸剂的主要特点及其基质分类	82	二、乳化剂品种简介	104
二、滴丸剂基质品种简介	83	第十五节 抑菌防腐剂	106
第九节 气雾剂用抛射剂及附加剂	83	一、抑菌防腐剂的质量要求及分类	107
一、气雾剂的特点及组成	84	二、抑菌防腐剂品种简介	108
二、气雾剂抛射剂的分类	84	第十六节 混悬液稳定剂	110
三、气雾剂附加剂的应用	84	一、混悬液稳定剂的分类	111
四、气雾剂抛射剂品种简介	85	二、混悬液稳定剂品种简介	113
第十节 透皮给药制剂材料	86	第十七节 等渗调节剂、pH 调节剂和局部止痛剂	114
一、透皮给药制剂的特点及结构分类	87	一、等渗调节剂及其主要品种	114
二、透皮给药制剂中常用的材料	87	二、pH 调节剂及其主要品种	115
三、透皮给药系统常用材料品种简介	88	三、局部止痛剂及其主要品种	115
第十一节 缓、控释制剂辅料	89	第十八节 矫味剂和着色剂	115
一、缓、控释制剂的类型	89	一、选用矫味着色辅料的注意事项	115
二、缓、控释制剂辅料简介	89	二、常用矫味剂和着色剂品种简介	116
第十二节 抗氧化剂和抗氧化增效剂	92		
一、抗氧化剂的作用机制及分类	93		
二、抗氧化剂及抗氧化增效剂品种			
第四章 药用辅料评价及注册管理	121		
第一节 药品及药用辅料评价依据	123		
注册概论	121	二、药用辅料评价注册的范围	124
一、药用辅料评价注册的法律			

三、药用辅料注册申报资料	药用明胶注册申报
要求概述 124	资料要求 132
四、新药注册是对主药与辅料的	一、综述资料的要求 133
综合评价 125	二、药学研究资料的要求 133
第二节 新的药用辅料注册申报	第六节 药用辅料补充申请注
资料要求 126	册申报资料要求 134
一、综述资料的要求 126	一、报国家食品药品监督管理局
二、药学研究资料的要求 126	批准的事项 134
三、药理毒理研究资料的	二、报省级食品药品监督管理局
要求 127	审批的事项 138
四、临床研究资料的要求 128	第七节 药用辅料再注册申报
第三节 进口药用辅料注册申报	资料要求 139
资料要求 128	一、境内生产药用辅料再注册
一、综述资料的要求 128	的要求 139
二、药学研究资料的要求 129	二、进口药用辅料再注册的
三、药理毒理研究资料的	要求 139
要求 130	第八节 提高药品及药用辅料
四、临床研究资料的要求 130	审评注册质量 140
第四节 已有国家标准的药用辅	一、科学审评的重点是安全性、
料注册申报资料要求 130	有效性和质量可控性 140
一、综述资料的要求 131	二、科学审评注册的制度
二、药学研究资料的要求 131	保证 141
第五节 已有国家标准的药用空	三、审评审批全过程的质量
心胶囊、胶囊用明胶和	管理 141
第五章 药用辅料质量标准管理 143	
第一节 质量标准建立的基本	一、药用辅料质量研究用样品
过程 143	和对照品 146
一、质量研究内容的确定 143	二、药用辅料质量研究的一般
二、方法学研究的两个方面 144	内容 146
三、质量标准项目及限度的	三、方法学研究的基本要求 146
确定 144	第三节 质量标准的制定 146
四、质量标准的制定 144	一、质量标准制定的一般
五、质量标准的修订 145	原则 147
第二节 药用辅料的质量研究 145	二、质量标准项目和限度的

确定	147	二、质量标准修订的一般	
三、质量标准的格式和用语	147	原则	148
四、质量标准的起草说明	147	三、质量标准的阶段性	148
第四节 质量标准的修订	148	四、提高现有辅料质量标准	
一、质量标准修订的必要性	148	意义重大	148
第六章 药用辅料生产质量管理	151		
第一节 药用辅料生产质量		一、药用辅料 GMP 第四章的	
管理的总则	151	条款内容	160
一、药用辅料 GMP 总则的		二、设备的设计安装的基本	
条款内容	151	原则	161
二、辅料生产质量管理的		三、设备的校验与维修保养	161
基本准则	151	四、水处理系统的设计、安装	
三、药用辅料管理的法律		和维护	162
基础	153	第五节 物料	162
四、药用辅料管理的科学		一、药用辅料 GMP 第五章的条	
基础	154	款内容	163
第二节 机构、人员和职责	155	二、建立健全物料管理系统，	
一、药用辅料 GMP 第二章的		强化对供应商综合能力的	
条款内容	155	评估审核	163
二、组织机构要适应质量保		三、制定并执行物料管理	
证及 GMP	156	制度	164
三、人员是生产的首要条件	156	四、科学仓储管理	164
四、职责制度在企业文化结		五、对来源于生物的物料的	
构层次中的地位	157	管理	164
第三节 厂房和设施	157	第六节 卫生	165
一、药用辅料 GMP 第三章的		一、药用辅料 GMP 第六章的	
条款内容	158	条款内容	165
二、厂房的总体设计与布局		二、良好卫生规程的基本	
应科学合理	158	做法	165
三、空气处理系统及温、湿度		三、在辅料生产中要防止哪些	
的要求	159	媒介传播污染	166
四、人流、物流及其他防污染		四、清洁卫生规程的主要内容	
设施	159	有哪些	166
第四节 设备	160	五、设备清洗规程应遵循的	

原则	166	六、非无菌辅料的灭菌要求 ...	180
六、GMP 对人员卫生如何		七、对包装及储存条件的	
要求	167	要求	180
第七节 验证	167	八、辅料生产过程中的一些	
一、药用辅料 GMP 第七章的		要求	181
条款内容	168	九、对不合格批的管理及返工	
二、如何理解“验证”与		要求	182
“确认”	168	十、对自动化控制系统的	
三、GVP 的原则	169	要求	182
四、验证方案及其内容	170	第十节 质量保证和质量	
五、什么是生产工艺验证	170	控制	183
六、清洁验证及其程序	171	一、药用辅料 GMP 第十章的	
七、验证文件内容	171	条款内容	183
第八节 文件	171	二、质量管理部门在实施 GMP	
一、药用辅料 GMP 第八章的		工作中的地位及作用	184
条款内容	172	三、质量检验的主要记录	185
二、文件管理的目的	173	四、GMP 对试剂和试液的书面	
三、建立一套完备的文件系		规程要求	186
统的主要目的	173	五、GMP 对检验方案的	
四、药用辅料 GMP 将文件分		规定	186
为几种类型	174	六、GMP 对成品检验的	
五、编制文件应符合的原则 ...	175	规定	187
六、文件编码的原则	175	七、GMP 对留样的稳定性考	
七、填写记录的要求	175	察的规定	187
第九节 生产管理	176	八、GMP 对一些要素变更的	
一、药用辅料 GMP 第九章的条		规定	187
款内容	176	第十一节 销售	188
二、认识质量也源于生产的重		一、药用辅料 GMP 第十一章的	
要性，确保生产工艺连续		条款内容	188
稳定	179	二、销售记录及其管理	188
三、GMP 对生产中物料平衡的		三、对退货的处理	188
规定	179	第十二节 自检和改进	189
四、药用辅料生产环境的		一、药用辅料 GMP 第十二章的	
要求	179	条款内容	189
五、对工艺用水的要求	180	二、自检和改进的目的—	

致性	189	一、GMP 是质量管理体系的	
三、质量体系的持续改进	190	组成部分	193
四、与自检和改进有关的		二、GMP 与环境管理体系紧密	
规程	191	关联	194
第十三节 附则	191	三、GMP 与职业健康安全管理	
一、药用辅料 GMP 第十三		体系紧密关联	194
章的条款内容	191	四、社会责任管理体系是 GMP	
二、19 个术语的含义	192	存在的基础	194
第十四节 GMP 与四大管理		五、实施一体化管理体系	195
体系的关系	192		
第七章 制药企业的辅料管理	197		
第一节 强化制药企业辅料管		二、严格对药用辅料的验收	
理的法制观念	197	检验的管理	200
一、《药品管理法》的有关		三、健全物料管理的制度与	
规定	197	系统, 加强仓储管理	201
二、《中国药典》的有关		第三节 药用辅料的科学规范	
规定	197	使用	201
三、《药品注册管理办法》及		一、科学合理地选用辅料	201
《药用辅料注册申报资料		二、应选用安全性更好的无药理	
要求》的有关规定	198	活性的惰性辅料品种	202
四、药品 GMP 的有关规定	198	三、所选用辅料应满足药用级别	
第二节 严把药用辅料采购		要求	203
审验关	199	四、严格按照 GMP 要求规范	
一、依法对物料供应商质量体系		使用辅料	203
进行评估	199		
第八章 药用辅料及其管理的发展与展望	205		
第一节 药用辅料科学技术的		重要的发展方向	206
发展与展望	205	四、提高我国辅料生产和制剂生	
一、新辅料在新剂型与新技术		产的工艺技术水平	207
中的应用	205	第二节 药用辅料管理的法制化、	
二、多学科的发展促进新辅料的		科学化和规范化的发展	
研发	206	与展望	208
三、药物传输系统辅料的研发是		一、健全药用辅料的标准	

体系	208	法制体系	209
二、健全药用辅料的管理		四、政策的支持引导，促	
体制	208	进辅料产业成长	209
三、健全药用辅料管理的			
参考文献	210		
后记	211		

第一章 药用辅料概论

药用辅料 (pharmaceutical excipients) 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起着积极的关键性的作用。进一步说, 药用辅料是生产药品和调配处方时所用的赋形剂或附加剂, 由于制剂配方中辅料占大部分, 因而对药品质量和安全起着至关重要的作用。品质优良的辅料不仅可以增强主药的稳定性, 延长药品的有效期, 调控主药在体内外的释放速度, 而且还可以改变药物在体内的吸收状态, 提高其生物利用度等。

国际药用辅料协会 (international pharmaceutical excipients council, IPEC) 的定义是: 药用辅料是在药物制剂中经过合理的安全评价的不包括生理有效成分或前体的组分。它的作用有:

- (1) 在药物制剂制备过程中有利于成品的加工。
- (2) 加强药物制剂稳定性, 提高生物利用度或病人的顺应性。
- (3) 有助于从外观鉴别药物制剂。
- (4) 增强药物制剂在贮藏或应用时的安全和有效性。

因此可以说, 没有辅料, 活性药理成分的原料药就不可能加工成型, 服用剂量就不好掌握, 就无法保证人们用药的安全有效; 甚至可以说, 没有辅料及新辅料研发, 就没有药剂学及其发展。

由于历史的原因, 国内药用辅料的生产和使用还存在诸多不规范的现象。自2006年发生齐二药事件^①以来, 药用辅料的规范生产和使用问题越来越受到各方的重视, 规范药用辅料的生产和使用已经成为目前医药行业亟待解决的问题之一。

良好的产品质量是企业发展的根本保证, 药用辅料生产企业只有自觉按照国家规范生产符合药用要求的高质量辅料, 才能确保药用辅料行业的健康发展, 才

^① 齐齐哈尔第二制药有限公司 (简称齐二药) 在生产亮菌甲素注射液时未经检验而使用了不法商人提供的假冒丙二醇辅料的“二甘醇”溶剂, 致使广东15名患者出现急性肾衰或神经系统损害等中毒症状, 十几人死亡。

能确保药品生产企业的正常生产，才能确保用药的安全有效。

药物剂型的合理设计和处方需要，应考虑在制备成药物产品中所用的所有药物与药用辅料的物理、化学及生物学特性。药物与所使用的药用辅料必须能相互配伍，以制备成一种易于使用，安全性、有效性、稳定性和实用性俱佳的药品。药品应在适当的质量控制条件下生产，具有适当的稳定性，并包装在适宜的容器内。产品应该贴有标签，说明正确的使用方法，以及在什么条件下贮存能保证其最长的贮存期。

本章前两节是从剂型构成以及制剂稳定性方面，或者说从制剂和处方方面来考虑剂型设计，来说明药用辅料在剂型构成中的作用，以及辅料对制剂稳定性的影响；本章三、四两节则侧重于生物药剂学和药物动力学方面考虑，主要是吸收和体内分布方面对剂型设计的影响。第五节强调了药用辅料应视同药品一样管理。

第一节 辅料在药物剂型构成中的作用

药物（drug）是人类用来预防、治疗、诊断疾病，或为了调节人体功能、提高生活质量、保持身体健康的特殊化学品。为适应医疗用药的需要，根据药品监督管理部门制定的药品标准，将原料药加工制成一定规格的制品，称为药物制剂（pharmaceutics），简称制剂（preparations），如片剂、注射剂等。

每一个制剂产品本身就是一个独特的处方，除了具有治疗作用的活性成分（active pharmaceutical ingredient）（即原料药）外，还有若干非活性成分（即药用辅料）。药用辅料（pharmaceutical aids）就是指药物被加工成各种类型的制剂时需要加入的一些无药理作用的辅助物质，使制剂成品具有某些必要的理化特征或生理特征。

一、药物剂型的分类及发展

药物剂型，或简称剂型（dosage form），就是指将药物加工制成适合于患者需要的给药形式。药物都应制成一定的剂型，以制剂的形式应用于治疗、预防和诊断疾病，而制剂的安全性、有效性和质量可控性、经济性，则反映了医药的水平，决定了用药的效果。人类社会科技的发展也带动了药物剂型的发展。第一代药物剂型是简单加工供口服与外用的“膏丹丸散”；随着工业的机械化、自动化发展，产生了片剂、注射剂、胶囊剂和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）；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，又发展成为第四代的靶向给药系统，而反应时辰生物技术与生

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(即发病高峰时期在体内自动释药的给药系统),将在现代给药系统的发展中脱颖而出。由于疾病的复杂性与药物性质的多样性,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,以适应临床治疗的不同需要。例如,治疗心血管疾病的药物最好做成缓释、控释给药系统,抗癌药宜制成靶向给药系统,胰岛素更适宜制成自调式或脉冲式给药系统。虽然在相当长的时期内,第二代剂型仍是人们使用的主要剂型,但是第二代剂型会不断与新剂型、新技术相结合,形成具有新内容、更加有效的给药系统。目前常用的剂型有四五十种,药剂学上常按形态、分散系统或给药途径、给药体系进行分类。

1. 按形态分类的药物剂型

- (1) 固体剂型 如散剂、片剂、丸剂、胶囊剂、膜剂等。
- (2) 半固体剂型 如软膏剂、眼膏剂、糊剂等。
- (3) 液体剂型 如芳香水剂、溶液剂、注射剂、合剂、洗剂、搽剂等。
- (4) 气体剂型 如气雾剂、喷雾剂等。

形态相同的剂型,制备特点比较相近。例如液体剂型制备时多采用溶解、分散法;半固体剂型多采用熔融与研和法;固体剂型多采用粉碎、混合、成形法。由于剂型的形态不同,药物发挥作用的速度也不同,如口服给药时液体剂型发挥作用快,固体剂型则较慢。

2. 按分散系统分类的药物剂型

(1) 固体分散型 如散剂、颗粒剂、片剂、丸剂等,主要是固体药物以分散或聚集体状态存在的体系。

(2) 微粒分散型 如微球剂、微囊剂、纳米囊、纳米球等,通常以不同大小微粒呈液体或固体状态分散。

(3) 溶液型 如芳香水剂、溶液剂、糖浆剂、甘油剂、酊剂等,这一类剂型是由药物分散在分散介质中形成的均匀分散体系,药物以分子或离子状态存在,也称低分子溶液。

(4) 胶体溶液型 如胶浆剂、火棉胶剂、涂膜剂等,主要以高分子分散在分散介质中形成的均匀分散体系,也称高分子溶液。

(5) 乳剂型 如口服乳剂、静脉注射乳剂、部分搽剂等,主要是油类药物或药物油溶液以液滴状态分散在分散介质中形成的非均匀分散体系。

(6) 混悬型 如合剂、洗剂、混悬剂等,主要是固体药物以微粒状态分散在分散介质中形成的非均匀分散体系。

(7) 气体分散型 如气雾剂,主要是液体或固体药物以微粒状态分散在气体分散介质中形成的分散体系。

以分散系统分类的方法,便于应用物理化学的原理来阐明各类制剂特征;但不能反映用药部位与用药方法对剂型的要求,甚至一种剂型由于分散介质和制法不同,必须分到几个分散体系中,例如注射剂型中就有溶液型、混悬型、乳剂型及粉针剂型等。

3. 按给药途径分类的药物剂型

这种分类方法是将同一给药途径的剂型分为一类。人体共有十多个给药途径,包括:口腔及消化道(口腔、舌下、颊部、胃肠道),腔道(直肠、子宫、阴道、尿道、耳道、鼻腔),呼吸道(咽喉、支气管、肺部),血管组织(皮内、皮下、肌肉、静脉、动脉等),其他(皮肤、眼等)。这些给药途径除皮肤和注射给药外,主要是通过黏膜吸收药物。消化道黏膜的药物吸收因影响因素较多,有首过效应,与其他给药途径有较大差别,所以不列入黏膜给药,而且常以药物是否经胃肠道吸收而将按给药途径分类的剂型区分为两大类。剂型必须与给药途径相适应,也就是说,制备剂型必须按给药途径的特点、药物的性质来决定。例如,注射给药除植入剂外应以液体剂型使用;眼黏膜给药以液体、半固体剂型最为方便。当然,有些剂型(如溶液剂)可以多途径给药。

(1) 经胃肠道给药的剂型 药物制剂口服后进入胃肠道,经胃肠道吸收发挥药效,如溶液剂、乳剂、混悬剂、散剂、颗粒剂、胶囊剂、片剂、丸剂、胶丸剂等。口服给药方法简单,但易受胃肠道的破坏而降低药效甚至失效的药物不能口服给药。

(2) 非经胃肠道给药剂型 是指除口服给药以外的全部给药途径,包括以下几种:

- 注射给药:如注射剂,包括静脉注射、肌肉注射、皮下注射、穴位注射等几种注射途径。

- 呼吸道给药:如气雾剂、喷雾剂、粉雾剂等。

- 皮肤给药:如外用溶液剂、洗剂、搽剂、硬膏剂、糊剂、贴剂等,给药后在局部起作用,或者经皮吸收发挥全身作用。

- 黏膜给药:如滴眼剂、滴鼻剂、眼用软膏、含漱剂、舌下片剂等,黏膜给药可起局部作用,也可经黏膜吸收发挥全身作用。

按给药途径分类的方法与临床使用密切结合,并能反映给药途径与应用方法对剂型制备的特殊要求;缺点是,往往一种制剂由于给药途径和应用方法不同,可能在不同给药途径的剂型中出现。例如溶液剂可以在口服、皮肤、黏膜、直肠等多种给药途径出现。

上述分类方法,各有其优缺点。而在实践中往往采用综合的分类方法;现代的科学分类方法,其依据主要是“给药体系”。