



普通高等教育“十一五”国家级规划教材

全国高等学校药学类规划教材

# 药 剂 学

主 编 张 志 荣



高等教育出版社  
Higher Education Press

普通高等教育“十一五”国家级规划教材  
全国高等学校药学类规划教材

# 药 剂 学

主 编 张志荣

副主编 张 强 潘卫三

编 者 (以姓氏笔画为序)

王 玮 王建新 尹宗宁 邓树海

龙晓英 吕万良 刘华钢 李 高

吴 伟 何 勤 张 强 张志荣

周建平 胡富强 黄 园 潘卫三

秘 书(兼) 尹宗宁 何 勤



高等教育出版社  
Higher Education Press

## 内容简介

药剂学是药学类专业的必修专业课。本教材依据生理解剖知识基础,采用临床给药途径与药物剂型相结合的方式划分篇章。全书分为总论、液体制剂、固体制剂、外用制剂、黏膜给药制剂、生物技术药物制剂、中药制剂、新型给药系统等8篇21章。在内容安排上,贯彻理论联系实际的原则,既有原理的阐述又有实例,以阐明剂型和制剂处方设计与组成、制备工艺、质量控制的基本理论、基本知识和基本技术为重点,同时介绍有关的新进展,对必要的设备以介绍工作原理为重点。在内容的阐述上,重视教材的科学性、先进性、逻辑性、启发性、实用性和教学适用性。

本教材适合药学类本科教学使用,也可作为医药相关人员参考用书。

## 图书在版编目(CIP)数据

药剂学/张志荣主编. —北京:高等教育出版社,  
2007.12

ISBN 978-7-04-022879-3

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

中国版本图书馆CIP数据核字(2007)第171834号

策划编辑 席雁 责任编辑 孙葵葵 封面设计 于文燕 责任绘图 朱静  
版式设计 王艳红 责任校对 张颖 责任印制 陈伟光

---

出版发行	高等教育出版社	购书热线	010-58581118
社 址	北京市西城区德外大街4号	免费咨询	800-810-0598
邮政编码	100011	网 址	<a href="http://www.hep.edu.cn">http://www.hep.edu.cn</a>
总 机	010-58581000		<a href="http://www.hep.com.cn">http://www.hep.com.cn</a>
经 销	蓝色畅想图书发行有限公司	网上订购	<a href="http://www.landaco.com">http://www.landaco.com</a>
印 刷	北京奥鑫印刷厂		<a href="http://www.landaco.com.cn">http://www.landaco.com.cn</a>
		畅想教育	<a href="http://www.widedu.com">http://www.widedu.com</a>
开 本	787×1092 1/16	版 次	2007年12月第1版
印 张	34.5	印 次	2007年12月第1次印刷
字 数	910 000	定 价	49.40元

---

本书如有缺页、倒页、脱页等质量问题,请到所购图书销售部门联系调换。

版权所有 侵权必究

物料号 22879-00

## 全国高等学校药学类规划教材

药学概论	主编 叶德泳
生药学	主编 蔡少青
药理学	主编 李元建
药剂学	主编 张志荣(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
药物分析学	主编 曾 苏(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
天然药物化学	主编 吴继洲(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
生物药剂学与药物动力学	主编 蒋新国
临床药理学	主编 蒋学华(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
药物设计学(第二版)	主编 仇缀百(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
临床药物治疗学	主编 胡晋红
药事管理学	主编 刘红宁(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
药学统计学	主编 罗 旭 毕开顺(普通高等教育“十一五”国家级规划教材)
药物经济学	主编 胡善联

### 其他药学类规划教材

药物化学(第二版)	仇文升 李安良(北京市精品教材)
大学化学基础	曹凤歧(普通高等教育“十五”国家级规划教材)
药学实用仪器分析	陈玉英(普通高等教育“十五”国家级规划教材)
药物化学	华维一(普通高等教育“十五”国家级规划教材)
生物技术药物学	吴梧桐(普通高等教育“十五”国家级规划教材)

# 前 言

药剂学是药学类专业的必修专业课,也是药学专业学生由学校学习走向药物制剂研究、开发、生产和使用岗位的桥梁课程。药剂学不但涉及药学专业前期基础课和专业基础课知识的综合应用,而且涉及药学知识与实际的紧密结合。基于此,本教材编写时除了重视教材的科学性、逻辑性、先进性、启发性以外,还注意体现教材的实用性和教学适用性,以适应培养药学创新创业人才的需要。

本教材的篇章划分是在生理解剖知识基础上,采用临床给药途径与药物剂型相结合的方法。在内容的阐述上,以阐明剂型和制剂处方设计与组成、制备工艺、质量控制的基本理论、基本知识和基本技术为重点,同时介绍有关的新进展,对必要的设备以介绍工作原理为重点。

全书分为8篇21章:绪论,药物剂型与制剂的设计,药剂卫生,液体药剂概论,口服液体制剂,注射剂,固体制剂概论,散剂、颗粒剂与胶囊剂,片剂,外用制剂概论,软膏剂与凝胶剂,洗剂、搽剂与涂膜剂,黏膜给药制剂概论,眼黏膜给药制剂,其他黏膜给药制剂,气溶胶剂,生物技术药物制剂,提取技术与中药制剂,经皮给药制剂,缓释、控释给药系统,靶向给药系统。本书将药物制剂的卫生要求和灭菌、无菌技术等单独列出一章——药剂卫生,为的是使学生更加重视药物制剂的卫生学知识。关于药物制剂的稳定性、流变学基础、表面活性剂、药用高分子、粉体学基础等,均未单独设章,分别在有关章节介绍。

本教材的编写集中了一批在药剂学领域中具有丰富教学和科研经验的教师,有张志荣(第一章,四川大学),周建平(第二章,中国药科大学),王建新(第三章,复旦大学),吕万良(第四、二十一章,北京大学),何勤(第五章,四川大学),龙晓英(第六章,广东药学院),李高(第七、八章,华中科技大学),黄园(第九章,四川大学),王玮(第十、十一、十二章,河南大学),邓树海(第十三、十四、十五章,山东大学),吴伟(第十六章,复旦大学),尹宗宁(第十七章,四川大学),刘华钢(第十八章,广西医科大学),胡富强(第十九章,浙江大学),潘卫三(第二十章,沈阳药科大学),张强(第二十一章,北京大学)。在编写本教材的过程中,编委们认真地参阅了国内外最新教材版本及相关论著,力求形式创新,内容新颖,特点突出。但是,由于时间紧迫,个人水平和经验有限,编写中缺点和错误在所难免,祈盼同仁和读者提出宝贵意见和建议,以便再版时进一步修改完善。

本教材的编写和出版得到了全国同行专家的指导和帮助,得到了高等教育出版社的支持和帮助,编写组秘书由编委尹宗宁和何勤兼任,她们在本教材稿件的收集整理中做了大量工作,在此一并表示衷心的感谢!

张志荣

2007年6月

# 目 录

## 第一篇 总 论

<b>第一章 绪论</b> .....	3	<b>第三节 药物制剂的设计理念和主要环节</b> .....	25
<b>第一节 概述</b> .....	4	一、研究课题的立项依据 .....	25
一、药剂学的性质 .....	4	二、设计药物制剂的基本理念 .....	25
二、药物剂型与药物疗效 .....	4	三、设计药物制剂的主要环节 .....	25
三、药剂学的任务 .....	5	<b>第四节 药物制剂研究的基本内容、方法和技术</b> .....	26
四、药物剂型的分类 .....	6	一、药物制剂的处方前研究 .....	26
五、剂型和制剂的命名 .....	8	二、处方筛选及制备工艺选择及其优化 .....	32
六、药剂学分支学科 .....	9	三、制剂质量控制及质量标准的制定 .....	40
<b>第二节 药剂学的发展</b> .....	10	四、制剂稳定性研究 .....	41
一、药剂学的历史 .....	10	五、药物制剂产品包装、标签的设计及其他 .....	50
二、现代药剂学的进展 .....	11	<b>思考题</b> .....	58
<b>第三节 药物制剂的质量控制</b> .....	14	<b>参考文献</b> .....	59
一、药典 .....	14	<b>第三章 药剂卫生</b> .....	60
二、国家药品标准 .....	16	<b>第一节 概述</b> .....	61
三、药品生产质量管理规范与药品安全试验规范 .....	16	一、药剂卫生的概念 .....	61
四、处方药与非处方药 .....	17	二、药物制剂中的微生物来源 .....	61
<b>第四节 新药制剂的研究与申报</b> .....	17	三、药物被微生物污染可能产生的结果 .....	64
一、新药制剂的分类 .....	17	四、控制药物制剂微生物污染的方法 .....	64
二、申报新药制剂的主要内容 .....	17	五、不同药物制剂的微生物限度标准 .....	66
<b>思考题</b> .....	19	<b>第二节 药物制剂生产环境的卫生管理</b> .....	66
<b>参考文献</b> .....	19	一、药物制剂对生产环境的卫生要求 .....	66
<b>第二章 药物剂型和制剂的设计</b> .....	20	二、药物制剂生产的空气净化度要求与空气净化技术 .....	67
<b>第一节 概述</b> .....	21	<b>第三节 灭菌与无菌操作技术</b> .....	71
一、药物剂型和制剂的重要性 .....	21	一、概述 .....	71
二、药物剂型和制剂研究开发的指导思想 .....	21	二、 $F$ 与 $F_0$ 值 .....	72
<b>第二节 药物剂型选择和制剂设计的基本原则</b> .....	22		
一、药物剂型选择的基本原则 .....	22		
二、药物制剂设计的基本原则 .....	24		

三、物理灭菌法 .....	74	一、防腐的概念 .....	79
四、化学灭菌法 .....	77	二、防腐措施 .....	79
五、无菌操作法 .....	78	三、防腐剂 .....	80
六、无菌检查法 .....	79	思考题 .....	82
第四节 药物制剂的防腐 .....	79	参考文献 .....	82
<b>第二篇 液体制剂</b>			
<b>第四章 液体制剂概论</b> .....	85	三、糖浆剂 .....	116
<b>第一节 概述</b> .....	86	四、芳香水剂 .....	117
一、液体制剂的含义 .....	86	五、酊剂 .....	117
二、液体制剂的分类 .....	86	六、醑剂 .....	117
三、液体制剂的特点与质量要求 .....	87	<b>第三节 胶体溶液型液体制剂</b> .....	118
<b>第二节 流变学简介</b> .....	88	一、高分子溶液剂 .....	118
一、概述 .....	88	二、溶胶剂 .....	119
二、牛顿流体 .....	88	<b>第四节 混悬剂</b> .....	120
三、非牛顿流体 .....	89	一、概述 .....	120
四、流变性的测定及其在药剂学中的 应用 .....	91	二、混悬剂的物理稳定性 .....	121
<b>第三节 表面活性剂</b> .....	93	三、混悬剂的稳定剂 .....	122
一、表面活性剂的定义与结构特点 .....	93	四、制备工艺及其影响因素 .....	123
二、表面活性剂的分类 .....	95	五、混悬剂的质量评价 .....	124
三、表面活性剂的基本性质 .....	98	<b>第五节 乳剂</b> .....	125
四、表面活性剂在制剂中的应用 .....	102	一、概述 .....	125
<b>第四节 药物的溶解与分散</b> .....	105	二、乳剂形成理论 .....	126
一、液体制剂常用的溶剂种类与性质 .....	105	三、乳化剂 .....	127
二、药物的溶解度及溶解速率 .....	107	四、乳化剂的选择 .....	128
三、增加药物溶解度的方法 .....	109	五、乳剂的制备 .....	129
四、分散度与药物疗效 .....	111	六、乳剂的不稳定性 .....	130
思考题 .....	111	七、乳剂的稳定性评价 .....	131
参考文献 .....	111	<b>第六节 口服液体制剂的着色与矫味</b> .....	132
<b>第五章 口服液体制剂</b> .....	112	一、矫味剂 .....	132
<b>第一节 概述</b> .....	113	二、着色剂 .....	133
一、胃肠道的结构与生理特点 .....	113	思考题 .....	134
二、口服液体制剂的特点 .....	114	参考文献 .....	135
三、口服液体制剂的分类 .....	115	<b>第六章 注射剂</b> .....	136
四、口服液体制剂的质量要求 .....	115	<b>第一节 概述</b> .....	137
<b>第二节 溶液型液体制剂</b> .....	115	一、注射剂的定义及特点 .....	137
一、概述 .....	115	二、注射剂的给药途径 .....	137
二、口服溶液剂 .....	116	三、注射剂的分类 .....	137
		四、注射剂的质量要求 .....	138

第二节 注射剂的溶剂与附加剂 .....	139	一、定义、种类与应用特点 .....	161
一、注射用水 .....	139	二、不同种类输液的质量要求 .....	162
二、注射用油 .....	145	三、渗透压调节 .....	162
三、非水溶剂 .....	146	四、输液的制备 .....	165
四、注射剂的附加剂 .....	146	五、输液的质量控制与稳定性评价 .....	168
第三节 小体积注射剂 .....	147	六、应用实例 .....	168
一、定义、类型及应用特点 .....	147	第五节 注射用无菌粉末 .....	172
二、溶液型、混悬型、乳剂型注射剂处方设计的依据 .....	147	一、定义、种类与应用 .....	172
三、小体积注射剂的制备流程、工艺及影响因素 .....	148	二、注射用冷冻干燥产品 .....	172
四、注射剂的质量控制与稳定性评价 .....	157	三、注射用无菌分装产品 .....	174
五、包装与储存 .....	158	四、质量控制与稳定性评价 .....	175
六、应用实例 .....	158	第六节 注射剂的研究进展 .....	175
七、溶液型、混悬型、乳剂型注射剂试制程序与实例 .....	159	一、溶液型缓释、控释注射剂 .....	175
第四节 大体积注射剂 .....	161	二、聚合物胶体缓释、控释注射剂 .....	176
		三、微粒(混悬)型缓释、控释注射剂 .....	176
		思考题 .....	177
		参考文献 .....	177

### 第三篇 固体制剂

第七章 固体制剂概论 .....	181	五、包合物的验证 .....	203
第一节 概述 .....	182	第四节 固体分散体 .....	205
一、固体制剂的分类、特点及制备工艺 .....	182	一、概述 .....	205
二、固体制剂的崩解、分散与药物溶出 .....	182	二、载体材料 .....	205
三、药物的胃肠道吸收及影响因素 .....	185	三、固体分散体的类型 .....	207
四、药物的跨膜转运机制 .....	185	四、固体分散体的速释和缓释原理 .....	208
第二节 粉体学 .....	186	五、固体分散体的制备方法 .....	209
一、概述 .....	186	六、固体分散体的物相鉴定 .....	210
二、粒子大小 .....	187	第五节 滴丸 .....	212
三、比表面积 .....	191	一、概述 .....	212
四、粉体的流动性 .....	192	二、滴丸剂的基质和冷凝液 .....	213
五、吸湿性与润湿性 .....	193	三、滴丸剂的制备 .....	214
六、压缩性、黏附性与凝聚性 .....	196	四、应用实例 .....	216
七、粉体学在固体制剂中的应用 .....	197	思考题 .....	217
第三节 包合物 .....	198	参考文献 .....	217
一、概述 .....	198	第八章 散剂、颗粒剂与胶囊剂 .....	218
二、包合物形成的影响因素 .....	199	第一节 概述 .....	219
三、包合材料 .....	199	一、粉碎 .....	219
四、包合技术 .....	202	二、筛分 .....	220



三、混合 .....	221	六、其他辅料 .....	250
四、制粒 .....	222	<b>第三节 片剂的制备工艺</b> .....	251
<b>第二节 散剂</b> .....	227	一、湿法制粒压片 .....	251
一、定义、特点与应用 .....	227	二、干法制粒压片 .....	256
二、散剂的制备工艺及影响因素 .....	227	三、粉末直接压片 .....	257
三、质量控制 .....	229	<b>第四节 片剂成型理论和片剂制备中可能</b>	
四、应用实例 .....	230	<b>发生的问题</b> .....	258
<b>第三节 颗粒剂</b> .....	230	一、片剂成型理论 .....	258
一、定义、特点与应用 .....	230	二、压片中经常出现的问题及其	
二、颗粒剂的制备工艺及影响因素 .....	230	原因 .....	259
三、质量控制与稳定性评价 .....	231	<b>第五节 片剂的包衣</b> .....	260
四、应用实例 .....	232	一、概述 .....	260
<b>第四节 胶囊剂</b> .....	232	二、包衣材料 .....	261
一、概述 .....	232	三、包衣方法及设备 .....	263
二、空心胶囊与胶皮 .....	233	四、包衣过程中易出现的问题及其	
三、内容物的性质与质量 .....	234	原因 .....	265
四、胶囊剂的制备工艺及影响因素 .....	236	<b>第六节 片剂的质量控制与评价</b> .....	266
五、质量控制与稳定性评价 .....	239	一、外观、硬度与脆碎度 .....	266
六、应用实例 .....	240	二、片重差异与含量均匀度 .....	267
<b>思考题</b> .....	240	三、崩解时限与溶出度 .....	268
<b>参考文献</b> .....	240	四、微生物限度检查 .....	270
<b>第九章 片剂</b> .....	241	五、包衣片的质量评价 .....	270
<b>第一节 概述</b> .....	242	<b>第七节 片剂的包装与储存</b> .....	271
一、片剂的特点 .....	242	一、片剂的包装 .....	271
二、片剂的分类 .....	242	二、片剂的储存 .....	272
三、片剂的质量要求 .....	243	<b>第八节 片剂新产品的试制</b> .....	272
<b>第二节 片剂的辅料</b> .....	244	一、片剂新产品研制一般程序 .....	272
一、辅料的选用原则 .....	244	二、处方和工艺设计前工作 .....	272
二、稀释剂和吸收剂 .....	244	三、处方和工艺设计的原则 .....	273
三、润湿剂和黏合剂 .....	246	四、典型片剂的处方设计 .....	276
四、崩解剂 .....	247	<b>思考题</b> .....	278
五、润滑剂 .....	249	<b>参考文献</b> .....	279

## 第四篇 外用制剂

<b>第十章 外用制剂概论</b> .....	283	<b>第二节 外用制剂作用特点</b> .....	285
<b>第一节 外用制剂的分类及特点</b> .....	284	一、皮肤的结构与各部位的皮肤 .....	285
一、外用制剂的分类 .....	284	二、病变皮肤与渗出液对选择剂型的	
二、外用制剂的特点 .....	284	影响 .....	287
		三、皮肤用药对制剂质量的要求 .....	287

思考题 .....	288	参考文献 .....	308
参考文献 .....	288	<b>第十二章 洗剂、搽剂与涂膜剂</b> .....	309
<b>第十一章 软膏剂与凝胶剂</b> .....	289	<b>第一节 洗剂</b> .....	310
<b>第一节 软膏剂</b> .....	290	一、概述 .....	310
一、概述 .....	290	二、洗剂的制备 .....	310
二、基质与附加剂 .....	290	三、洗剂的质量控制与稳定性评价 .....	311
三、基质与附加剂对药物吸收的影响 .....	298	<b>第二节 搽剂</b> .....	311
四、处方设计的依据 .....	299	一、概述 .....	311
五、制备工艺及其影响因素 .....	301	二、搽剂的制备 .....	311
六、质量控制与稳定性评价 .....	304	三、搽剂的质量控制与稳定性评价 .....	311
<b>第二节 凝胶剂</b> .....	305	<b>第三节 涂膜剂</b> .....	312
一、概述 .....	305	一、概述 .....	312
二、基质 .....	305	二、涂膜剂的制备 .....	312
三、基质对药物吸收的影响 .....	307	三、涂膜剂的质量控制与稳定性评价 .....	312
四、制备工艺及其影响因素 .....	307	<b>思考题</b> .....	313
五、质量控制与稳定性评价 .....	308	<b>参考文献</b> .....	313
<b>思考题</b> .....	308		

## 第五篇 黏膜给药制剂

<b>第十三章 黏膜给药制剂概论</b> .....	317	二、滴眼剂的处方设计 .....	327
<b>第一节 黏膜给药制剂的分类及特点</b> .....	318	三、滴眼剂的附加剂 .....	327
一、黏膜给药制剂及其分类 .....	318	四、滴眼剂制备工艺及其影响因素 .....	332
二、黏膜给药的特点 .....	319	五、滴眼剂的质量控制及稳定性评价 .....	333
<b>第二节 黏膜给药的吸收及质量要求</b> .....	319	<b>第三节 眼膏剂</b> .....	334
一、黏膜的结构与生化特点 .....	319	一、眼膏剂的概念及特点 .....	334
二、影响药物黏膜吸收的因素 .....	320	二、眼膏基质 .....	334
三、黏膜给药吸收促进剂 .....	320	三、眼膏剂的配制及实例 .....	334
四、黏膜给药制剂的质量要求 .....	321	四、眼膏剂的质量控制与稳定性评价 .....	335
<b>思考题</b> .....	321	<b>第四节 眼用注射液</b> .....	335
<b>参考文献</b> .....	321	一、眼用注射液的概念及特点 .....	335
<b>第十四章 眼黏膜给药制剂</b> .....	323	二、眼用注射剂原料药、溶剂及附加剂 .....	335
<b>第一节 概述</b> .....	324	三、眼用注射剂的制备工艺设计及应用实例 .....	336
一、眼黏膜给药制剂及其研究进展 .....	324	<b>第五节 眼用新剂型</b> .....	336
二、眼黏膜给药的特点 .....	324	一、眼用膜剂 .....	336
三、眼黏膜给药的吸收 .....	324	二、眼用脂质体 .....	338
四、眼黏膜给药及眼用注射给药的 质量要求 .....	326	三、眼用凝胶剂 .....	339
<b>第二节 滴眼剂</b> .....	327	四、眼用微粒制剂 .....	341
一、滴眼剂的概念及特点 .....	327	<b>思考题</b> .....	342

参考文献 .....	342	三、阴道及子宫黏膜给药的特点及 要求 .....	368
<b>第十五章 其他黏膜给药制剂</b> .....	343	四、阴道栓剂 .....	368
<b>第一节 口腔黏膜给药制剂</b> .....	344	五、阴道膜剂 .....	368
一、口腔黏膜给药制剂的概念及分类 .....	344	六、阴道泡腾片 .....	369
二、口腔黏膜的结构与生理特点 .....	344	七、阴道凝胶剂 .....	369
三、口腔黏膜给药的特点与质量要求 .....	345	八、子宫内药物释放系统 .....	369
四、舌下片及口腔贴片(膜) .....	346	<b>思考题</b> .....	370
五、漱口剂 .....	350	<b>参考文献</b> .....	371
<b>第二节 鼻黏膜给药制剂</b> .....	350	<b>第十六章 气溶胶剂</b> .....	372
一、鼻黏膜给药制剂的概念及其研究 进展 .....	350	<b>第一节 概述</b> .....	373
二、鼻腔黏膜的结构与生理特点 .....	351	一、气溶胶剂的特点 .....	373
三、鼻黏膜给药的特点 .....	352	二、气溶胶剂的分类 .....	374
四、鼻黏膜吸收促进剂 .....	353	<b>第二节 药物在肺部的沉积与吸收</b> .....	374
五、鼻腔给药新剂型 .....	353	一、呼吸生理 .....	374
<b>第三节 栓剂及其他直肠黏膜给药     制剂</b> .....	355	二、药物粒子在气道中的沉积 .....	375
一、栓剂的概念及其研究进展 .....	355	三、药物经肺吸收与代谢 .....	376
二、直肠黏膜的结构与生理特点 .....	355	<b>第三节 雾化原理与装置</b> .....	377
三、直肠黏膜给药的特点 .....	356	一、雾化器 .....	377
四、栓剂的基质与附加剂 .....	356	二、压力型定量吸入器 .....	379
五、栓剂处方设计 .....	360	三、干粉吸入器 .....	382
六、栓剂的制备 .....	361	<b>第四节 气溶胶剂的制备</b> .....	384
七、肛门栓与灌肠剂 .....	363	一、气雾剂的制备 .....	384
八、栓剂的质量评价 .....	365	二、干粉吸入剂的制备 .....	386
九、制法与应用实例 .....	366	<b>第五节 气溶胶剂的质量评价</b> .....	387
<b>第四节 阴道及子宫黏膜给药制剂</b> .....	367	一、气雾剂 .....	387
一、阴道及子宫黏膜给药制剂的概念 及研究进展 .....	367	二、粉雾剂 .....	387
二、阴道及子宫黏膜的结构与生理 特点 .....	367	三、喷雾剂 .....	387

<b>思考题</b> .....	388
<b>参考文献</b> .....	388

## 第六篇 生物技术药物制剂

<b>第十七章 生物技术药物制剂</b> .....	391	二、生物技术药物的理化性质 .....	394
<b>第一节 生物技术药物的特点</b> .....	392	三、生物技术药物的分析检测方法 .....	395
一、生物技术药物的含义及来源 .....	392	<b>第三节 改善生物技术药物生物药剂学     性质的方法</b> .....	396
二、生物技术药物的特点 .....	393	一、蛋白质多肽及核酸类药物的结构 修饰 .....	396
<b>第二节 生物技术药物的性质与分类</b> .....	394		
一、生物技术药物的分类 .....	394		

二、提高生物技术药物生物利用度的方法 .....	397	一、蛋白质、多肽药物的黏膜吸收制剂 .....	402
第四节 生物技术药物注射给药系统 .....	398	二、蛋白质、多肽药物的经皮吸收制剂 .....	405
一、生物技术药物注射剂的处方设计 .....	398	第六节 治疗基因传递系统 .....	406
二、质量控制与稳定性评价 .....	400	一、治疗基因传递系统 .....	407
三、应用实例 .....	400	二、质量控制与稳定性评价 .....	410
第五节 生物技术药物非注射给药系统 .....	401	思考题 .....	411
		参考文献 .....	411

## 第七篇 中 药 制 剂

第十八章 提取技术与中药制剂 .....	415	二、中药浸出物的分离原理与方法 .....	424
第一节 概述 .....	416	三、中药浸出物的纯化原理与方法 .....	425
一、中药制剂及其进展 .....	416	第四节 提取液的浓缩与干燥 .....	429
二、中药制剂的特点与分类 .....	416	一、浓缩 .....	429
三、中药新制剂研制程序及制备工艺的研究内容 .....	417	二、干燥 .....	429
第二节 中药有效成分与有效部位的提取 .....	419	第五节 中药制剂的制备 .....	431
一、中药的组成成分 .....	419	一、中药固体制剂的制备 .....	431
二、中药有效成分和有效部位的提取 .....	420	二、中药半固体制剂的制备 .....	432
第三节 中药浸出物的分离与纯化 .....	424	三、中药液体制剂的制备 .....	433
一、概述 .....	424	四、中药气体制剂的制备 .....	434
		思考题 .....	435
		参考文献 .....	435

## 第八篇 新型给药系统

第十九章 经皮给药制剂 .....	439	四、制备工艺及其影响因素 .....	457
第一节 概述 .....	440	五、质量控制与稳定性评价 .....	458
一、定义、分类、特点与发展 .....	440	思考题 .....	459
二、药物经皮吸收途径 .....	441	参考文献 .....	459
三、影响药物经皮吸收的因素 .....	442	第二十章 缓释、控释给药系统 .....	460
第二节 促进药物经皮吸收的方法 .....	444	第一节 概述 .....	462
一、渗透促进剂 .....	444	一、缓释、控释制剂的概念与分类 .....	462
二、促进药物经皮吸收的新方法 .....	446	二、缓释、控释制剂的特点 .....	462
三、经皮渗透促进的方法与设计 .....	448	三、缓释、控释制剂的临床意义 .....	462
四、体外、体内的研究方法 .....	449	四、缓释、控释制剂的处方设计 .....	463
第三节 经皮给药制剂的制备 .....	451	第二节 缓释、控释制剂的设计原理及释药机制 .....	463
一、常用材料 .....	451	一、骨架型缓释、控释制剂 .....	463
二、膜材的加工与成型 .....	453	二、膜控型缓释、控释制剂 .....	466
三、各类经皮给药制剂处方的设计依据 .....	454	三、渗透泵型控释制剂 .....	471

<b>第三节 缓释、控释制剂的体内外评价</b>	
方法	474
一、体外评价	474
二、体内评价	476
三、体内外相关性评价	477
<b>第四节 微丸</b>	479
一、概述	479
二、微丸的类型	479
三、微丸的释药机制	480
四、微丸的制备技术及影响因素	481
五、应用实例	482
六、微丸剂质量的评价指标	485
<b>第五节 微囊</b>	486
一、概述	486
二、囊心物和囊材	487
三、微囊的制备方法	489
四、微囊中药物的释放特性	493
五、微囊的质量评价	495
<b>第六节 口服定时和定位给药系统</b>	495
一、口服定时给药系统	495
二、口服定位给药系统	497
<b>第七节 植入缓释、控释给药系统</b>	499
一、概述	499
二、植入缓释、控释给药系统的类型	500
三、植入剂的制备工艺	502
四、植入剂体外释放实验方法	502
<b>思考题</b>	503
<b>参考文献</b>	504
<b>第二十一章 靶向给药系统</b>	505
<b>第一节 概述</b>	506
一、靶向制剂的定义与分类	506
二、靶向制剂的体内外质量评价	506
三、靶向制剂的发展趋势	507
<b>第二节 分子药剂学和细胞生物学技术</b>	
简介	508
一、分子药剂学简介	508
二、药物靶向性研究常用的细胞生物学技术	508
<b>第三节 靶向制剂的药动力学基础</b>	510
<b>第四节 脂质体</b>	515
一、概述	515
二、制备脂质体的材料	517
三、脂质体的制备方法	518
四、脂质体的质量评价	520
<b>第五节 纳米粒</b>	520
一、纳米粒的载体材料	521
二、纳米粒的制备	521
三、纳米粒在体内的分布与消除	522
四、载药纳米粒在药学领域的应用	522
<b>第六节 微乳</b>	523
一、概述	523
二、微乳的制备	523
三、微乳的形成理论	525
四、微乳作为药物载体的用途	526
<b>第七节 主动靶向制剂</b>	528
一、修饰的药物微粒载体	528
二、前体药物	529
<b>第八节 物理靶向制剂</b>	530
一、磁性药物制剂	530
二、动脉栓塞靶向制剂	534
三、热敏性脂质体	535
四、pH敏感脂质体	535
<b>思考题</b>	536
<b>参考文献</b>	536



第一篇

总 论



# 第一章

药学概论

## 绪论

### 绪论

- 概述
- 药剂学的发展
- 药物制剂的质量控制
- 新药制剂的研究与申报
- 思考题
- 参考文献

## Chapter 1 Introduction

### Key concepts:

- Pharmaceutics is the science of drug delivery, which is truly multidisciplinary, involving preparation and stability of suitable dosage forms, design and evaluation of dosing regimens and dosage forms, manufacture and quality control of pharmaceutical dosage forms.
- Drug dosage forms have significant influence on the pharmacological intensity, onset and duration of drug activity.
- Drug dosage forms and preparations appear as a major focus of pharmaceutics. With the development and advancement of drug delivery systems since 1990s, pharmaceutics has entered a new era. Some of these novel drug delivery systems have already been applied in clinic.
- Pharmacopoeia is an official compilation of quality specifications and standards for pharmaceutical drugs. The production, analysis and usage of the drugs must be carried out according to the pharmacopoeia.
- Pharmacopoeia provides guidelines and informations for preparation, quality control, application, dosage, adverse effect as well as the notice of drugs and related preparations.

表 1-1 不同剂型的给药途径与起效时间

给药途径	起效时间/min	作用高峰时间/min	常用剂量/mg	剂型
口服	30~60	15~30	10~30	片剂、胶囊剂
皮下注射	15~30	15~30	1~3	注射液
肌肉注射	15~30	15~30	1~3	注射液
静脉注射	1~2	1~2	0.3~0.8	注射液
吸入	1~2	1~2	0.3~0.8	吸入剂
直肠给药	15~30	15~30	10~30	栓剂
透皮给药	1~2	1~2	1~3	贴剂



## 第一节 概 述

### 一、药剂学的性质

药物(drugs)是可以用于防治人类和动物疾病以及对机体生理功能有影响的物质。药物可分为中药与天然药物、化学药物(包括抗生素)、生物技术药物三大类。中药(traditional Chinese drug)系指我国经典著作记载的、为中医师传统使用的成药、药材和饮片。生物技术药物(biotechnical drug)系指通过生物技术获得的药物,主要包括重组激素类药物、重组细胞因子药物、基因工程疫苗、重组溶栓药物、治疗基因和治疗性抗体等。

任何一种药物,在供临床应用前,都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,这种给药形式称为药物剂型(pharmaceutical dosage form,简称剂型)。例如片剂、注射剂、胶囊剂、软膏剂、栓剂、气雾剂等为剂型,剂型是制剂的基本形式。中药剂型也往往包括著名传统中药剂型,如丸、丹、膏、散等。药物制剂(pharmaceutical preparation,简称制剂)是指具体药物按某一种剂型,根据药典或国家标准制成的供临床应用的药品。制剂是剂型中的品种,包括中药制剂、化学合成药制剂、生物技术药物制剂、放射性药物制剂和诊断用药制剂等,例如罗红霉素片、注射用抑肽酶、细胞色素C注射液、头孢克洛胶囊、醋酸氟轻松软膏、甲硝唑栓、盐酸异丙肾上腺素气雾剂等。给药系统(drug delivery system, DDS)是新剂型、新制剂的总称,但同时包含有新技术的概念。

药剂学(pharmaceutics)是研究剂型和制剂的处方设计、配制理论、生产技术和质量控制等的综合性应用技术的科学。研究药物制剂生产工艺理论的科学称为制剂学(science of preparation)。研究方剂的配制技术和理论的科学称为调剂学(science of prescription)。制剂学和调剂学总称为药剂学。目前,由于医药工业的发展和药品管理的规范化,制剂生产已经成为主导,因此,药剂学与药物制剂学的含义基本一致。

### 二、药物剂型与药物疗效

药物剂型是根据医疗上的需要设计的。如急症患者,为使药物迅速发挥作用,宜采用汤剂、注射剂、栓剂、气雾剂与舌下片等;对于药物作用需要持久的则可用混悬剂、丸剂、缓释片或控释制剂等;对于药理作用强烈的药物、毒副作用大的药物,则制成能靶向传递到病变部位的剂型或给药系统是最理想的。

药物和剂型之间存在着辩证关系,药物本身对疗效虽然起主要作用,但在一定条件下,剂型对药物疗效的发挥也起着重要的,甚至是支配的作用;有的药物的剂型不同,则作用完全不同。

药物剂型可以影响药物在体内药理作用的强弱、作用快慢和作用时间。例如,治疗心绞痛药物硝酸甘油的各种剂型具有不同的强度和持续时间,以适应不同的治疗或预防要求(表1-1)。

表1-1 硝酸甘油的不同剂型的作用时间

剂型	常用剂量/mg	作用开始时间/min	作用高峰时间/min	持续时间
舌下片剂	0.3~0.8	2~5	4~8	10~30 min
口颊片剂	1~3	2~5	4~10	30~300 min
口服片剂	6.5~19.5	20~45	45~120	2~6 h
软膏剂	10~20	15~60	30~120	3~8 h
透皮贴剂	5~10	30~60	60~180	24 h