

手边不可缺少的学习帮手，伴你走过漫长的求学之路

药学笔记系列丛书

总主编 谭毓治

最新独家出版
药学笔记

药剂学笔记

主编 龙晓英

板书与教案——重点难点，一目了然

重点词汇——中英对照，强化记忆

自我测试与考研实战——举一反三，注重应用

相关链接——趣味学习，博古通今

助记图表——提纲挈领，掌握规律



科学出版社

www.sciencep.com

医药学记录丛书
总主编 曹祥麟

药理学笔记

主编 曹祥麟

本书共分五章——(1)总论；(2)药代动力学；
(3)药效学；(4)药物与受体；(5)药物与酶。
本书可作为医药院校、医药干部、医药工人、
医药学生、医药爱好者、医药研究人员、医药
研究人员、医药工作者、医药爱好者、医药



药学笔记系列丛书

总主编 谭毓治

药剂学笔记

主 编 龙晓英

副主编 易 军 李晓芳

科学出版社

北京

· 版权所有 侵权必究 ·

举报电话:010-64030229,010-64034315,13501151303(打假办)

内 容 简 介

本书为《药学笔记系列丛书》的一个分册。作为药剂学课程的配套辅导书,本书将教材的内容精炼、浓缩。全书分为十六章,每章均由学习要求、板书与教案、重点词汇以及自我测试与考研实战四部分组成,有的地方添加了相关链接,该部分包括小提示、背景知识、仪器设备、学科发展趋势等,有助于提高学习者的兴趣。

本书主要作为药学类各专业本(专)科学生,包括成人教育、自学考试学生学习的辅导教材,也可作为研究生考试的辅导教材,对从事相关学科教学的教师和参加药学专业职称晋升考试的人员亦有很好的参考价值。

图书在版编目(CIP)数据

药剂学笔记 / 龙晓英主编. — 北京: 科学出版社, 2009

(药学笔记系列丛书/谭毓治总主编)

ISBN 978-7-03-026126-7

I. 药… II. 龙… III. 药剂学—高等学校—教学参考资料 IV. R94

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2009)第 217668 号

策划编辑:王 露 / 责任编辑:王 霞 / 责任校对:陈玉凤

责任印制:刘士平 / 封面设计:黄 超

版权所有,违者必究。未经本社许可,数字图书馆不得使用

科学出版社出版

北京东黄城根北街 16 号

邮政编码: 100717

<http://www.sciencep.com>

骏杰印刷厂印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2010 年 1 月第 一 版 开本:787×1092 1/16

2010 年 1 月第一次印刷 印张:11 3/4

印数:1—5000 字数:285 000

定价:22.80 元

如有印装质量问题,我社负责调换

《药学笔记系列丛书》编委会

总主编 谭毓治

编委 (以姓氏笔画为序)

龙晓英

刘云军

严寒静

吴文娟

宋粉云

张万金

赵红

姬生国

程力惠

温金莲

谭毓治

秘书 陈小夏

《药剂学笔记》编写人员

主 编 龙晓英
副主编 易 军 李晓芳
编 者 (以姓氏笔画为序)
马素英 龙晓英 丘明建
李晓芳 易 军

《药学笔记系列丛书》前言

为帮助药学及相关专业学生学习、复习、掌握主要基础课、专业基础课及专业课的知识及其学习运用方法,今年初,科学出版社编辑和有关领导选定了这个题目,组织出版一套适合于药学及相关专业主要课程的笔记系列丛书,并把写作的任务交给了我们。参加撰写这套丛书的二十余所院校的近八十位作者,均是教学经验丰富的教学一线的老师。在编写过程中,主要参考了普通高等教育“十一五”国家级规划教材(供药学专业使用),以及全国几个主要药学院校有关课程的教学大纲,并结合了编者多年的教学经验。

这套丛书共选择药学专业的十一门主要课程,包括无机化学、有机化学、物理化学、分析化学、药用植物学、生药学、药理学、药物分析、药物化学、天然药物化学、药剂学。

每章编写内容分为板书与教案、重点词汇、自我测试与考研实战(练习题均附有参考答案)、助记图表、相关链接等。板书与教案部分以各章节主要知识点为脉络,详解重点难点,是教学的重点和复习的重点。重点词汇列出了各章的主要专业术语或主要药名的中英文,强化学生记忆。自我测试与考研实战吸收历年考试及考研试题,并附有参考答案,可供学习者自我检测之用。助记图表将各章重要内容进行提炼、总结和归纳,形成图或表,把理解记忆、形象记忆、比较记忆结合起来,有利于对内容的记忆和掌握。相关链接收集了与各章内容相关的进展、小提示、背景知识、药物发展史或趣闻小品等,有利于活跃版面,扩展知识面。每本书的字数控制在各门课程教科书的40%左右,有利于帮助同学们在厚厚的教材中抓住重点。对于临考考生,本书又可以成为离开教材仍能独立使用的贴身笔记。

本套丛书主要作为药学类专业本(专)科学生,包括成人教育、自学考试学生的辅导教材,也可作为研究生考试的辅导教材使用。对从事药学教学的教师和参加药学专业人员职称晋升考试者,亦有很好的参考价值。

我们希望这套丛书变成一组开启药学知识宝库的钥匙,奉献给正在勤奋学习、不断思考、不断进步的同学们!

在本套丛书即将出版之际,感谢参与本套丛书编写和审校的人员,他们付出了很多心血和时间。尽管我们注入大量心血,但疏忽纰漏之处在所难免,恳请广大读者提出建议和批评。联系信箱:tanyuzhi@163.com。

总主编 谭毓治

2009年10月18日于广东药学院

前 言

药剂学是研究药物制剂基本理论、处方设计、制备工艺与设备、质量控制及合理应用的综合性技术科学。它是药学类专业的主要专业课,也是执业药师、主管药师等各类职称晋升及资格考试的必考科目之一。作为药剂学课程的配套辅导书,《药剂学笔记》将药剂学的内容浓缩,高度概括药剂学各章的重点知识,达到脉络清晰、层次分明、文字精练、重点突出的效果,便于学习者在有限的时间内对药剂学的重点知识进行学习。

全书分为十六章,即绪论,药物制剂的稳定性,液体制剂,注射剂与滴眼剂,散剂,颗粒剂,胶囊剂与滴丸剂,片剂,中药制剂,栓剂,软膏剂、眼膏剂、凝胶剂和膜剂,气雾剂、喷雾剂与粉雾剂,缓释与控释制剂,经皮贴剂,靶向制剂,生物技术药物制剂。

各章均由学习要求、板书与教案、重点词汇以及自我测试与考研实战四部分组成。学习要求说明各章需要重点掌握的知识;板书与教案采用多种形式对重点内容进行归纳;重点词汇反映各章重要概念;自我测试与考研实战以思考题的形式对重点内容提出问题,并附参考答案。

本书特点为:①以剂型为中心。除第一章及第二章外,其他章节按液体、固体、半固体、气体、新剂型等顺序编排,将固体分散体、包合物及微囊等制剂技术插入散剂一章。②加强药剂理论、制剂技术与剂型的联系。如将药物制剂的稳定性放到制剂前面讲述,对各剂型的处方与工艺设计具有指导作用;将表面活性剂、流变学插入到密切相关的液体制剂一章;将粉体学、粉碎、过筛、混合等理论及制剂技术操作插入散剂一章;将所有颗粒制剂技术插入颗粒剂一章;将中药制剂前处理技术插入中药制剂一章等。③大量运用提纲、表格及图的形式,层次分明、对比性强,突出了内容的直观性和概括性,便于学习者记忆、备考。④有的地方添加了相关链接,该部分内容包括小提示、背景知识、仪器设备、学科发展趋势等。本书丰富的编排形式有助于提高学习者的兴趣。

本书主要用于系统复习药剂学的主要知识,希望对各类药剂学考试的备考有所帮助,但由于编者水平有限、时间仓促,不足之处恳请各位读者批评指正。

编 者

2009年10月

目 录

第一章	绪论	(1)
第二章	药物制剂的稳定性	(8)
第三章	液体制剂	(16)
第四章	注射剂与滴眼剂	(34)
第五章	散剂	(60)
第六章	颗粒剂	(84)
第七章	胶囊剂与滴丸剂	(91)
第八章	片剂	(99)
第九章	中药制剂	(111)
第十章	栓剂	(124)
第十一章	软膏剂、眼膏剂、凝胶剂和膜剂	(131)
第十二章	气雾剂、喷雾剂与粉雾剂	(140)
第十三章	缓释与控释制剂	(149)
第十四章	经皮贴剂	(160)
第十五章	靶向制剂	(167)
第十六章	生物技术药物制剂	(174)

第一章 绪 论

学习要求

- 掌握 药剂学相关概念;药剂学任务;药物剂型的重要性。
- 熟悉 药物剂型的分类;药物制剂质量标准。
- 了解 药剂学分支学科;药剂学沿革。

板书与教案

1. 药剂学相关概念

(1) 药剂学(pharmaceutics):是研究药物制剂的基本理论、处方设计、制备工艺、质量控制和合理使用等内容的综合性应用技术科学。

简而言之,它是以药用剂型和药物制剂为研究对象,以用药者获得理想的药品为研究目的,而去研究一切与药物原料加工成制剂成品有关内容的科学。

(2) 药物、剂型、制剂与方剂

1) 药物:是一类具有一定的药效、投用于机体后能产生一定的生理药理活性、具有防病治病作用的特殊物质。

2) 剂型(dosage form):将经过化学合成、植物提取或生物技术制得的各种原料药加工成为具有一定形状和性质的、可供临床使用的形式。我们将这种适合于疾病的诊断、治疗或预防的需要而制备的不同给药形式称为剂型,如溶液剂、乳剂、片剂、胶囊剂、注射剂、软膏剂、气雾剂等。

3) 制剂(pharmaceutical preparations):按照一定的剂型要求制成的最终供用药对象使用的药品统称为制剂,如阿司匹林片、维生素 C 注射液、红霉素眼膏剂等。

4) 方剂:按照医师处方专为某一患者调制的并指明具体用法、用量的药剂。

(3) 药物传递系统(drug delivery system, DDS):是新剂型、新制剂、新技术的总称。

(4) 制剂学与调剂学

1) 制剂学(pharmaceutical engineering):研究制剂的理论和制备工艺的科学。

2) 调剂学:方剂一般是在医院药剂科调制的,研究方剂的调制理论、技术和应用的科学被称为调剂学。

2. 药剂学的分支学科

(1) 物理药剂学(physical pharmaceutics, 亦称物理药学):是以物理化学原理、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、质量控制等内容的学科。它主要揭示药物与制剂的共性,用各种化学的以及物理的变化规律与机制来指导药剂学实践。

(2) 生物药剂学(biopharmaceutics):是研究剂型和制剂中的药物投用于机体后在体内的转运代谢规律与影响这些规律的因素,阐明药物的剂型因素和用药对象的生理因素与药效之间关系的学科。它着重于药物的体内过程,强调药物剂型与药物制剂的生物学意义以及以人为本的原则。借助测定生物利用度等手段来判断药物制剂的生物等效性,指导科学地改进制剂质量和创造新剂型。

(3) 药物动力学(pharmacokinetics):是采用数学的方法,研究药物在体内的动态行为及其量变规律的学科。具体研究药物在体内的存在位置、数量(或浓度)随时间推移的变化过程,以及药物在体内的经时过程与药效之间关系。对指导制剂设计、剂型改革、安全合理用药、改造药物结构以及新药设计提供量化控制指标,是研究药物及其制剂在体内变化的重要工具学科。

(4) 工业药剂学(industrial pharmaceutics):是研究药物制剂工业生产的基本理论、工艺技术、生产设备和质量管理的学科。其基本任务是研究和设计如何将药物制成适宜的剂型,并能批量生产出品质优良、安全有效、服用方便的药物制剂,以满足医疗与预防需要。

(5) 临床药剂学(clinical pharmaceutics):是以患者为对象,研究合理、有效、安全用药等与临床治疗学紧密联系的新学科。主要以“药品为目标”的传统观点转移到主要以“病人为目标”的新观点,使药学工作者直接参与对患者的治疗活动,有利于提高临床治疗水平。其主要研究内容包括:提供特定患者所需药品的情报(药效、毒性等);临床用制剂和处方的研究;药物制剂的临床研究和评价;药物制剂生物利用度研究;药物剂量或血药浓度的临床监控;药物配伍变化及相互作用的研究等。

3. 药剂学的宗旨与任务

(1) 药剂学的宗旨:制备安全、有效、稳定、使用方便的药物制剂。随着药学科学的不断发展,人们对于药物在体内的吸收、分布、代谢、排泄等生物药剂学特征及药物的作用机制有了进一步的认识,从而为制备安全、有效的制剂和选择合理的给药途径提供了理论依据。

(2) 药剂学的任务(见表 1-1):

表 1-1 药剂学的任务

药剂学基本理论研究	指药物制剂的配制理论,如药物稳定性的理论;提高难溶性药物的溶解度及生物利用度的方法;粉体性质对固体物料处理过程和制剂质量的影响;片剂压缩成形理论的研究等对开发新剂型、新技术、新产品,提高产品质量有着重要的指导意义
新剂型的研究与开发	不同剂型可达到速释、缓释、靶向等作用,直接影响着药物的临床效果,同时增加患者的顺应性
新技术的研究与开发	微囊化技术、固体分散技术、包合技术、脂质体技术、包衣技术等,为新剂型的开发奠定了技术基础
新辅料的研究与开发	新辅料的研制对新剂型与新技术的发展起着关键作用,对制剂整体水平的提高具有重要意义
中药新剂型研究与开发	运用现代科学技术和方法对传统中药制剂进行二次开发,提高中药的药效、质量及应用顺应性
生物技术药物制剂的研究与开发	生物技术药物普遍具有活性强、剂量小、分子质量大、稳定性差、体内吸收差、半衰期短等问题。研究开发适合于这类药物的长效、安全、稳定、使用方便的新剂型是摆在我们药剂工作者面前的艰巨任务
制剂新机械和新设备的研究与开发	为了保障药品的质量和用药安全,制剂生产向封闭、高效、多功能、连续化和自动化的方向发展

4. 剂型的重要性

(1) 不同剂型改变药物的作用性质:有些药物改变剂型能改变作用性质,如硫酸镁口服剂型用做泻下药,但5%注射液静脉滴注,能抑制大脑中枢神经,有镇静、解痉作用;又如依沙吖啶(ethacridine,即利凡诺)1%注射液用于中期引产,但0.1%~0.2%溶液局部涂抹有杀菌作用。

(2) 不同剂型改变药物的作用速度:注射剂、吸入气雾剂等起效快,常用于急救;丸剂、缓控释制剂、植入剂等作用缓慢,属长效制剂。

(3) 不同剂型改变药物的毒副作用:氨茶碱治疗哮喘病效果很好,但有引起心跳加快的毒副作用,若制成栓剂则可消除这种毒副作用;缓、控释制剂能保持血药浓度平稳,避免血药浓度的峰谷现象,从而降低药物的毒副作用。

(4) 有些剂型可产生靶向作用:含微粒结构的静脉注射剂,如脂质体、微球、微囊等进入血液循环系统后,被单核-吞噬细胞系统的巨噬细胞所吞噬,从而使药物浓集于肝、脾等器官,起到肝、脾的被动靶向作用。

(5) 有些剂型影响疗效:固体剂型,如片剂、颗粒剂、丸剂的制备工艺不同会对药效产生显著影响。

5. 剂型的分类

- | | | | |
|-------------|---|-----------|-----------------------|
| (1) 按给药途径分类 | 经胃肠道给药剂型: 药物制剂经口服进入胃肠道,如散剂、片剂、颗粒剂、胶囊剂、溶液剂、乳剂、混悬剂等 | 非经胃肠道给药剂型 | 注射给药剂型 |
| | | | 呼吸道给药剂型(喷雾剂、气雾剂、粉雾剂等) |
| (2) 按分散系统分类 | | | 皮肤给药剂型(洗剂、搽剂、软膏剂等) |
| | | | 黏膜给药剂型(滴眼剂、滴鼻剂、舌下片剂等) |
| | | | 腔道给药剂型(栓剂、气雾剂、泡腾片等) |
| | | | 溶液型(溶液剂、糖浆剂等) |
| | | | 胶体溶液型(胶浆剂、火棉胶剂、涂膜剂等) |
| | | | 乳剂型(口服乳剂、静脉注射乳剂等) |
| (3) 按形态分类 | | | 混悬型(合剂、洗剂、混悬剂等) |
| | | | 气体分散型(气雾剂) |
| | | | 微粒分散型(微球制剂、微囊制剂等) |
| | | | 固体分散型(片剂、散剂、颗粒剂、胶囊剂等) |
| (4) 按制法分类 | | | 石蜡剂型 |
| | | | 气体剂型 |
| | | | 固体剂型 |
| | | | 半固体剂型 |
| (4) 按制法分类 | | | 浸出制剂 |
| | | | 无菌制剂 |

6. 药物传递系统 随着科学的进步,剂型的理论研究、剂型设计、辅料应用及制备方法

都得到迅速发展,具有了更丰富的科学内涵,剂型作为药物应用形式的作用正在被剂型的功能化所替代,剂型对药物药效的影响日益重要。这些具有新技术内涵、功能多样化的新剂型与新制剂被称为药物传递系统(drug delivery system, DDS)。同时,随着新分子实体(new molecule entities, NME)药物巨额研发费用的不断上涨、投资风险的进一步加剧及漫长的研发时间,投资少、时间短、风险低的 DDS 正在掀起新药研发的热潮。主要的 DDS 包括以下几类:

(1) 缓释和控释给药系统(sustained-release and controlled-release drug delivery system):是指能控制药物释放速度、释放部位及释放时间的制剂。

(2) 靶向给药系统(targeted drug delivery system):是指用不同微粒作为药物载体或这些微粒载体经过修饰,经由血管注射给药,有目的地将药物传输至某特定组织或部位的系统。也可以通过其他手段,如物理化学、前体药物等实现靶向给药。

(3) 药物的经皮传递系统(transdermal drug delivery system, TDDS):是指通过皮肤敷贴给药,通过透皮吸收达到维持稳定和长时间有效血药浓度和治疗作用的缓释或控释给药系统。

(4) 黏膜给药系统(mucosal drug delivery system):是指通过人体各腔道的黏膜作为用药部位。近年来黏膜作为全身吸收的给药途径越来越受到重视,特别是口腔、鼻腔和肺部三种途径的给药,对避免胃肠道对药物的破坏,避免药物对胃肠道的刺激性,避免药物的首过效应具有重要意义。

7. 药典与药品标准

(1) 药品标准(drug standard):国家对药品质量、规格和检验方法所作的技术规定。是保证质量,进行药品生产、经营、使用、管理及监督检验的法定依据。包括《中华人民共和国药典》及 SFDA 颁布的药品标准。

(2) 药典(pharmacopoeia):是国家记载药品规格和标准的法典。由国家组织的药典委员会编纂、出版,并由政府颁布执行,具有法律的约束力。药典中收载疗效确切、副作用小、质量较稳定的常用药物及其制剂,规定其质量标准、制备要求、鉴别、杂质检查与含量测定。

《中华人民共和国药典》:我国迄今已出版《中华人民共和国药典》共 8 版,以下简称《中国药典》。

外国药典:美国药典(USP/NF),现行版为《美国药典 30/国家处方集 25》,简称《USP 30-NF 25》;英国药典(BP),现行版为 2007 版(BP 2007);日本药典(JP),现行版为《第十五版改正日本药局方》(JP 15)。

8. GMP、GLP 与 GCP(见表 1-2)

表 1-2 GMP、GLP 与 GCP

GMP	<p>含义:是 good manufacturing practice 的缩写,即药品生产质量管理规范,是药品生产过程中,用科学、合理、规范化的条件和方法来保证生产优良药品的一整套系统的、科学的管理规范,是药品生产和管理的基本准则</p> <p>检查对象:①人;②生产环境;③制剂生产的全过程</p> <p>三大要素:①人为产生的错误减小到最低;②防止对医药品的污染和低质量医药品的产生;③保证产品高质量的系统设计</p>
-----	---

续表

GLP	是 good laboratory practice 的简称,即药品非临床研究质量管理规范。药品的非临床研究亦称为临床前研究,用于评价药物的安全性,在实验室条件下,通过动物实验进行非临床(非人体)的各种毒性实验。1999年11月1日起施行。自2007年1月1日起未在国内上市销售的原料药及其制剂必须在经过GLP认证的研究机构进行GLP研究
GCP	是 good clinical practice 的简称,即药品临床试验管理规范。药品临床试验是指任何在人体(病人或健康志愿者)进行的药品系统性研究,以证实或揭示试验用药品的作用及不良反应等。临床试验前必须经过“伦理道德委员会”的批准方可以进行临床试验

9. 处方药与非处方药

(1) 处方:处方是指医疗和生产部门用于药剂调制的一种重要书面文件。处方分为法定处方与医师处方。法定处方是国家药品标准收载的处方,它具有法律的约束力,在制备或医师开写法定制剂时均需遵照其规定。医师处方是医师对患者进行诊断后针对特定患者的特定疾病而开写给药剂科的有关药品、给药量、给药方式、给药天数以及制备等的书面凭证,具有法律、技术和经济的意义。

(2) 处方药与非处方药:处方药(prescription drug 或 ethical drug):必须凭执业医师或执业助理医师处方才可调配、购买,并在医生指导下使用的药品。处方药可以在国务院卫生行政部门和药品监督管理部门共同指定的医学、药学专业刊物上介绍,但不得在大众传播媒介发布广告宣传。

非处方药(nonprescription drug 或 over the counter,简称 OTC):不需要凭执业医师或执业助理医师的处方,消费者可以自行判断购买和使用的药品。主要是用于治疗各种消费者容易自我诊断、治疗的常见轻微疾病。

重点词汇

◎ 药剂学与制剂学 pharmaceutics and pharmaceutical engineering	◎ 处方药与非处方药 ethical drug,OTC
◎ 剂型与制剂 dosage form and pharmaceutical preparations	◎ 药品生产质量管理规范 good manufacturing practice,GMP
◎ 药物传递系统 drug delivery system,DDS	◎ 药品非临床研究质量管理规范 good laboratory practice,GLP
◎ 药典与药品标准 pharmacopoeia and drug standard	◎ 药品临床试验管理规范 good clinical practice,GCP

自我测试与考研实战

1. 剂型对药物的疗效有何影响?
2. 如何理解制剂技术、制剂辅料与制剂设备对制剂发展的影响?

3. 药剂学的宗旨与任务是什么?

4. 剂型按给药途径分类有哪几种,请举例说明。

附 参考答案

1. 答:剂型对药物的疗效的影响有以下几点:

(1) 不同剂型改变药物的作用性质:有些药物改变剂型能改变作用性质,如硫酸镁口服剂型用做泻下药,但5%注射液静脉滴注,能抑制大脑中枢神经,有镇静、解痉作用。

(2) 不同剂型改变药物的作用速度:注射剂、吸入气雾剂等起效快,常用于急救;丸剂、缓控释制剂、植入剂等作用缓慢,属长效制剂。

(3) 不同剂型改变药物的毒副作用:氨茶碱治疗哮喘病效果很好,但有引起心跳加快的毒副作用,若制成栓剂则可消除这种毒副作用;缓、控释制剂能保持血药浓度平稳,避免血药浓度的峰谷现象,从而降低药物的毒副作用。

(4) 有些剂型可产生靶向作用:含微粒结构的静脉注射剂,如脂质体、微球、微囊等进入血液循环系统后,被网状内皮系统的巨噬细胞所吞噬,从而使药物浓集于肝、脾等器官,起到肝、脾的被动靶向作用。

(5) 有些剂型影响疗效:固体剂型,如片剂、颗粒剂、丸剂的制备工艺不同会对药效产生显著影响。

2. 答:随着科学的进步,剂型的理论研究、剂型设计、辅料应用及制备方法都得到迅速发展,具有了更丰富的科学内涵。传统剂型如普通的片剂、注射剂、液体制剂及外用制剂等,已不能完全满足临床高效、长效、低毒、速释、缓释、控释、定位和靶向释放等要求,剂型作为药物应用形式的作用正在被剂型的功能化所替代。但设计这些特殊功能的新剂型对辅料及设备的要求也相应增加,如缓控释制剂需要具有缓释作用辅料及技术来调控药物的释放。而产生靶向作用的脂质体、微乳等需要高压乳匀机及技术来实现等,所以制剂技术、制剂辅料及制剂设备三足鼎立,是制剂发展不可缺少的重要支撑。

3. 答:(1) 药剂学的宗旨:制备安全、有效、稳定、使用方便的药物制剂。

(2) 药剂学的任务:药剂学基本理论研究;制剂新剂型与新技术(给药系统)的研究与开发;新辅料的研究与开发;制剂新机械和新设备的研究与开发。

4. 答:剂型按给药途径分类有以下几种:

(1) 经胃肠道给药剂型:是指药物制剂经口服后进入胃肠道,起局部作用或经吸收后发挥全身作用的剂型。常用的有散剂、颗粒剂、片剂、胶囊剂、溶液剂、乳剂、混悬剂等。容易受胃肠道中的酸或酶破坏的药物一般不能采用这类简单剂型。通过口腔黏膜吸收发挥作用的剂型不属于胃肠道给药剂型。

(2) 非经胃肠道给药剂型:是指除口服给药途径以外的所有其他剂型,这些剂型可以在给药部位起局部作用或被吸收后发挥全身作用。

1) 注射剂:又分为静脉注射、肌内注射、皮下注射、皮内注射及腔内(如关节腔、脊髓腔)注射等多种注射途径。

2) 皮肤给药剂型:施用于皮肤的剂型分为两大类。一类是局部用药,如外用溶液剂、洗剂、搽剂、软膏剂、硬膏剂、糊剂、贴剂等;还有一类属于经皮给药系统,贴于皮肤表面可使药物透皮吸收入血液,持久缓和地发挥全身作用。

3) 呼吸道给药剂型:经上呼吸道给药的有滴鼻剂、喉头喷雾剂等;经下呼吸道至肺泡吸收的剂型有气雾剂、粉雾剂等,可迅速发挥全身作用。

4) 腔道及身体其他黏膜给药剂型:如滴眼剂、眼膏剂、滴鼻剂、含漱剂、口含片、舌下片剂、颊内使用的薄型片剂、贴剂,可用于眼、鼻腔和口腔黏膜等,起局部作用或经黏膜吸收发挥全身作用。腔道给药的栓剂、阴道片、气雾剂、泡腾片、滴耳剂、滴剂及滴丸剂等,可用于直肠、阴道、尿道、鼻腔、耳道等。

(龙晓英)

第二章 药物制剂的稳定性

学习要求

掌握 研究药物制剂稳定性的意义与任务;处方因素及外界因素对药物制剂稳定性的影响及解决办法;药物稳定性试验方法(影响因素试验、加速试验、长期试验条件、要求、目的等)。

熟悉 药物稳定性的化学动力学基础;制剂中药物的化学降解途径;药物制剂稳定化的其他方法。

了解 固体药物制剂稳定性的特点及降解动力学;固体制剂稳定性实验的特殊要求和特殊方法。

板书与教案

1. 药物制剂的稳定性概述

(1) 药物制剂的基本要求:安全、有效、稳定。

(2) 稳定性研究的目的

- 提高产品的内在质量
- 进行处方及工艺筛选的必要手段
- 预测及确定产品的有效期
- 我国新药申报必备内容

(3) 稳定性包括

- 化学稳定性
- 物理稳定性
- 微生物学稳定性

2. 药物制剂的物理稳定性 物理稳定性主要指制剂的物理性能发生变化,包括药物和制剂两个方面。

(1) 药物的物理稳定性:许多药物具有多晶型,如甾体、磺胺类和巴比妥类药物较易形成多晶型,晶型改变可导致溶解度、疗效的改变;某些药物和辅料在室温下具有较高的蒸气压,容易导致药物蒸发损失,如硝酸甘油,可通过将挥发性药物分散在大分子中的方法降低其蒸气压。

(2) 制剂的物理稳定性:溶液剂在贮存过程中主药或辅料产生沉淀,影响溶液的澄明度、pH等;混悬剂、乳剂也会产生沉降、破乳等;片剂在贮存期间由于各种原因导致崩解及溶出迟缓等。

3. 药物制剂的化学稳定性 化学稳定性是指药物由于水解、氧化等化学降解反应,使药物含量(或效价)、色泽产生变化。