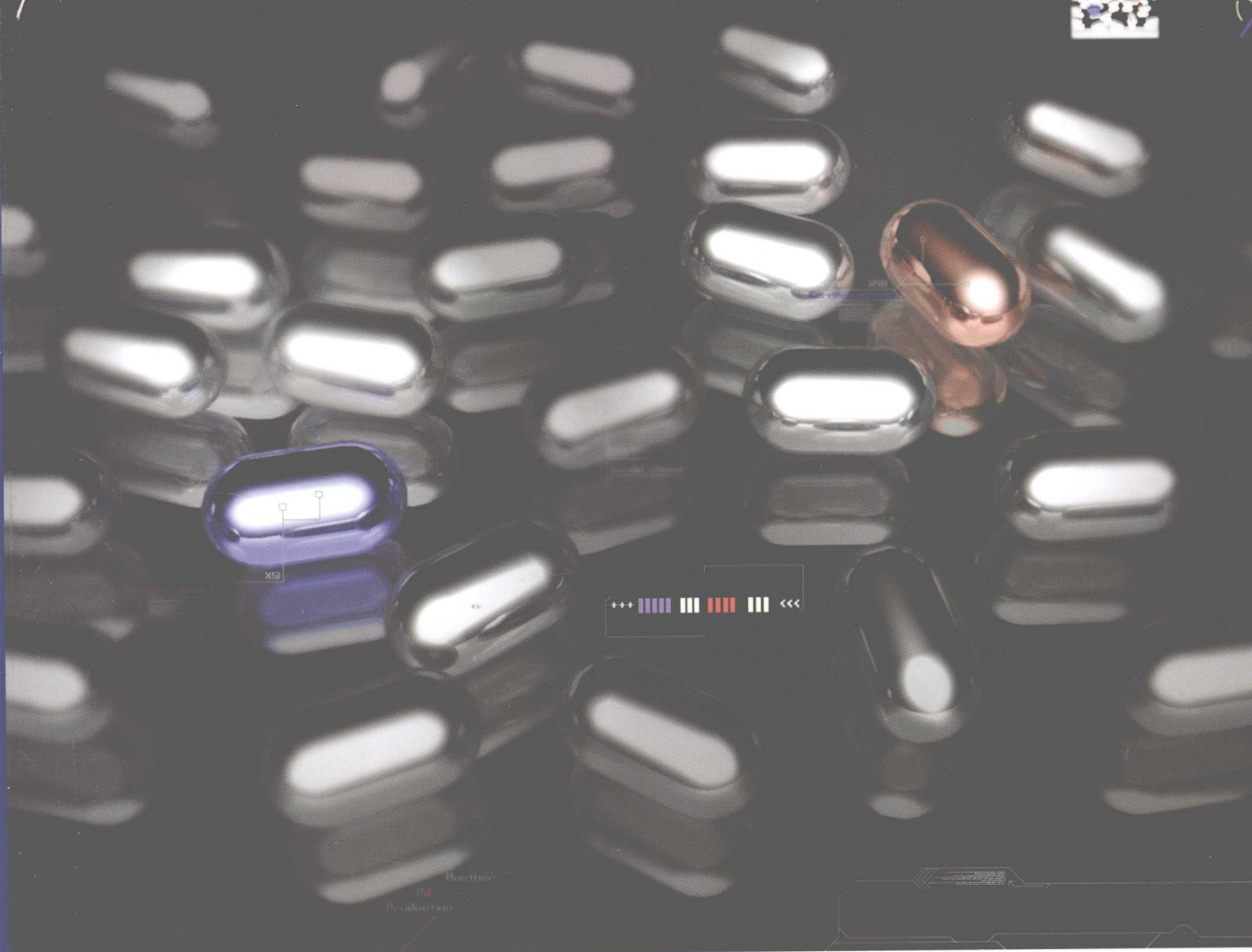




曹德英
王 静

主 编
副主编



华夏英才基金学术文库

药物剂型与制剂设计

YAOWU JIXING YU ZHIJI SHEJI



化学工业出版社
生物·医药出版分社



曹德英
王 静

主 编
副主编



华夏英才基金学术文库

药物剂型与制剂设计

YAOWU JIXING YU ZHIJI SHEJI



化学工业出版社

生物·医药出版分社

·北京·

示 00.00 1份 5

本书共分二十四章,第一章至第八章介绍药物剂型设计基础、处方前工作、优化技术、新药制剂的研究与申报、药物制剂的稳定性、工程验证、生物等效性研究与药物动力学数据处理等内容。第九章至第二十四章按主要剂型介绍注射剂、眼用制剂、散剂和颗粒剂、胶囊剂、片剂、滴丸剂、小丸剂、软胶囊剂、膜剂和涂膜剂、软膏剂、硬膏剂、巴布剂、凝胶剂、栓剂、气雾剂、液体制剂等内容。以实例的形式介绍一些新技术,如脂质体、微球等在注射剂中介绍,胃肠道生物黏附给药系统、口服渗透给药系统、口服定时给药系统、胃漂浮给药系统、口服结肠定位给药系统等则在片剂中介绍。总之本书力求全面介绍药物剂型的新技术、新工艺等,以使读者了解更多的新剂型设计的有关知识。

本书可作为各层次剂型研究与设计工作者进行新药开发与剂型设计的参考用书,也可作为药剂学研究生和其他药学相关专业研究生的辅助教材。

图书在版编目(CIP)数据

药物剂型与制剂设计/曹德英主编.

学工业出版社,2009.5

ISBN 978-7-122-05085-4

I. 药… II. 曹… III. ①药物-剂型②药物-制剂

IV. R944 TQ460.6

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2009)第 042104 号

责任编辑:杨燕玲 余晓捷 孙小芳
责任校对:战河红

文字编辑:李 瑾
装帧设计:周 遥

出版发行:化学工业出版社 生物·医药出版分社(北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011)

印 刷:北京市振南印刷有限责任公司

装 订:三河市宇新装订厂

787mm×1092mm 1/16 印张 25¼ 字数 711 千字 2009 年 7 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:69.00 元

版权所有 违者必究

前 言

任何一种药物在临床使用前都必须制成适合患者使用的安全、有效、稳定的给药形式，即剂型。药剂学是以剂型为中心，研究其配制理论、处方设计、制备工艺与设备、质量控制及合理应用等多学科渗透的综合性技术学科，剂型是药剂学的核心内容。

目前，国内关于药物剂型与制剂设计的专著较少，有关内容只是在药剂学的教学中分散于各个章节中讲授，相关内容既不系统，也不全面。对于从事药物剂型研究的人员来说，这些剂型与制剂设计内容远远不够，有必要编写一部关于药物剂型设计的专著。为此我们编写了《药物剂型与制剂设计》一书，以进一步推动药物剂型与制剂设计对新药研究与开发的促进作用，以期使药物通过剂型能够达到“安全、有效、稳定、可控、顺应、定时、定位、精确”。

本书共分二十四章，第一章至第八章介绍药物剂型设计基础、处方前工作、优化技术、新药制剂的研究与申报、药物制剂的稳定性、工程验证、生物等效性研究与药物动力学数据处理等内容。第九章至第二十四章按剂型介绍注射剂、眼用制剂、散剂和颗粒剂、胶囊剂、片剂、滴丸剂、小丸剂、软胶囊剂、膜剂和涂膜剂、软膏剂、硬膏剂、巴布剂、凝胶剂、栓剂、气雾剂、液体制剂等内容。一些新技术以实例形式在相关章节中介绍，如脂质体、微球等在注射剂章节中介绍，胃肠道生物黏附给药系统、口服渗透给药系统、口服定时给药系统、胃漂浮给药系统、口服结肠定位给药系统等则在片剂章节中介绍。本书力求全面介绍药物剂型的新技术、新工艺等，以使读者了解更多的新剂型设计的有关知识。

本书可以作为各层次剂型研究与设计工作者进行新药开发与剂型设计的参考用书，也可以作为药剂学研究生和其他药学相关专业研究生的辅助教材。本书的编写得到华夏英才基金的资助，还得到河北医科大学各级领导的大力支持和积极配合，在此一并深表感谢。由于编者水平有限，编写时间仓促，书中疏漏之处在所难免，请广大读者提出改进意见。

编者

2008 年 12 月

目 录

第一章 绪论	1
一、剂型发展历程	1
二、现代药物剂型的发展方向	3
参考文献	9
第二章 药物剂型设计	10
第一节 制剂新产品开发立题与可行性分析	10
一、制剂新产品开发选题原则	10
二、制剂新产品开发选题途径	11
三、市场调查	13
第二节 剂型设计的基础	14
一、给药途径与剂型的确定	14
二、药物制剂设计的基本原则	14
三、制剂的剂型与药物的吸收	15
四、制剂的评价与生物利用度	17
第三节 剂型与处方设计	17
一、剂型设计	18
二、处方筛选	19
三、制剂工艺筛选	20
四、影响制剂的因素与包装材料考察	20
参考文献	21
第三章 处方前的研究工作	22
一、文献检索	22
二、药物的物理化学性质测定	24
参考文献	39
第四章 药物制剂的优化设计	41
一、概述	41
二、优化参数	41
三、正交设计法	42
四、均匀设计	43
五、析因设计法	45
参考文献	47
第五章 新药制剂的研究与申报	48
第一节 药品质量标准	48
一、药品质量标准的定义、类别	48
二、药品质量标准的主要内容	49
三、药典	54
第二节 药品研究实验记录	56

一、实验记录的内容	56
二、实验记录的书写与保存	57
第三节 中试放样评价	57
一、中试放样研究的主要任务	57
二、中试放样的步骤和方法	59
三、中试工艺参数和条件的优化选择	59
第四节 药品的包装与标签	61
一、药品的包装	61
二、标签	62
第五节 新药制剂的申报	62
一、新药的分类	62
二、申报资料项目及说明	63
三、新药审批程序	67
参考文献	69
第六章 药物制剂的稳定性	70
第一节 概述	70
一、研究药物制剂稳定性的意义	70
二、研究药物制剂稳定性的任务	70
第二节 药物稳定性的化学动力学基础	70
一、反应级数	70
二、温度对反应速率的影响与药物稳定性预测	71
第三节 制剂中药物的化学降解途径	72
一、水解	72
二、氧化	73
三、其他反应	74
第四节 影响药物制剂降解的因素及稳定化方法	74
一、处方因素对药物制剂稳定性的影响及解决方法	74
二、外界因素对药物制剂稳定性的影响及解决方法	77
三、药物制剂稳定化的其他方法	80
第五节 固体药物制剂稳定性的特点及降解动力学	81
一、固体药物制剂稳定性的特点	81
二、固体剂型的化学降解动力学	82
第六节 药物稳定性试验方法	83
一、影响因素试验	83
二、加速试验	84
三、长期试验	84
四、稳定性重点考察项目	84
五、有效期统计分析	85
六、经典恒温法	86
七、固体制剂稳定性实验的特殊要求和特殊方法	87
参考文献	88
第七章 工程验证	89
一、名词术语	89

二、验证的意义	90
三、验证的基本步骤	91
第一节 工程设计审查	91
一、项目范围	92
二、厂址选择	92
三、厂区布局总图	92
四、工艺流程	92
五、车间布局	93
第二节 检验方法的验证	94
一、仪器和试剂确认	94
二、检验方法的适应性验证	94
三、采样	94
第三节 空气净化系统验证	95
一、设计的审查	95
二、安装及其确认	95
三、高效过滤器的检漏	96
四、风量、风压的测量	98
五、烟雾试验	99
六、温度、湿度控制测试	100
七、悬浮粒子的测定	100
八、生物性粒子的测定	102
第四节 工艺用水系统验证	104
一、设计的审查	104
二、安装及其确认	105
三、运行测试	106
第五节 灭菌的验证	107
一、灭菌器的审查	108
二、建造安装及其确认	108
三、电偶校正	108
四、热分布测试	109
五、热穿透性试验	109
六、灭菌周期研究	109
第六节 生产工艺验证	110
一、审阅处方和操作规程	110
二、设备确认	111
三、物料确认	113
四、工艺条件验证	114
五、生产工艺复验证	114
六、生产工艺变更验证	115
七、生产工艺控制系统验证	115
参考文献	116
第八章 生物等效性研究与药物动力学数据处理	117
第一节 生物等效性与生物利用度	117

一、定义·····	117
二、吸收速率·····	117
三、吸收程度·····	118
四、生物利用度和生物等效性试验设计与原则·····	119
第二节 药物动力学数据处理及模型识别·····	121
一、线性和非线性过程的识别·····	121
二、房室模型识别·····	121
参考文献·····	123
第九章 注射剂 ·····	124
第一节 概述·····	124
一、注射剂的定义与分类·····	124
二、注射剂的质量标准·····	124
第二节 水溶液注射剂·····	124
一、处方设计·····	124
二、实例分析·····	127
第三节 易氧化药物注射剂·····	128
一、处方设计·····	128
二、实例分析·····	129
第四节 易水解药物注射剂·····	131
一、处方设计·····	131
二、实例分析·····	133
第五节 难溶性药物注射剂·····	134
一、处方设计·····	134
二、实例分析·····	135
第六节 光不稳定药物注射剂·····	137
一、处方设计·····	137
二、实例分析·····	137
第七节 油溶液注射剂·····	138
一、处方设计·····	138
二、实例分析·····	139
第八节 混悬型注射剂·····	140
一、处方设计·····	140
二、实例分析·····	141
第九节 注射用乳剂·····	142
一、处方设计·····	142
二、实例分析·····	143
第十节 大输液·····	145
一、处方设计·····	145
二、实例分析·····	146
第十一节 注射用无菌粉末·····	148
一、处方设计·····	148
二、实例分析·····	148
第十二节 中药注射剂·····	150

一、处方设计·····	150
二、实例分析·····	153
第十三节 注射用脂质体·····	156
一、处方设计·····	156
二、实例分析·····	157
第十四节 注射用微球·····	159
一、处方设计·····	159
二、实例分析·····	160
参考文献·····	161
第十章 眼用制剂 ·····	162
第一节 滴眼剂与洗眼剂·····	162
一、处方设计·····	162
二、实例分析·····	163
第二节 眼用膜剂·····	167
一、处方设计·····	167
二、实例分析·····	168
第三节 眼用凝胶·····	170
一、处方设计·····	170
二、实例分析·····	171
参考文献·····	172
第十一章 散剂和颗粒剂 ·····	173
第一节 概述·····	173
一、散剂特点和质量要求·····	173
二、颗粒剂特点和质量要求·····	174
第二节 散剂处方和制备工艺·····	174
一、普通散剂·····	175
二、含液体组分散剂·····	176
三、含共熔及引湿性、浸膏组分散剂·····	177
四、含毒剧药物和小剂量药物散剂·····	178
第三节 颗粒剂处方和制备工艺·····	180
一、可溶性颗粒剂·····	180
二、混悬型颗粒剂·····	182
三、泡腾性颗粒剂·····	183
四、中药颗粒剂·····	185
五、无糖型中药颗粒剂·····	189
参考文献·····	191
第十二章 胶囊剂 ·····	192
第一节 概述·····	192
第二节 普通胶囊剂·····	192
一、处方设计·····	192
二、实例分析·····	193
第三节 中药胶囊剂·····	194
一、处方设计·····	194

二、实例分析·····	194
第四节 肠溶胶囊剂·····	195
一、处方设计·····	196
二、实例分析·····	196
第五节 综合依赖型结肠定位释药柱塞胶囊·····	197
参考文献·····	200
第十三章 片剂 ·····	201
第一节 概述·····	201
一、片剂特点和质量要求·····	201
二、片剂分类·····	201
三、片剂常用辅料·····	203
第二节 普通口服片剂·····	210
一、处方设计·····	210
二、实例分析·····	211
第三节 中药片剂·····	214
一、处方设计·····	214
二、实例分析·····	216
第四节 溶液片·····	220
一、概述·····	220
二、实例分析·····	220
第五节 舌下片·····	221
一、处方设计·····	221
二、实例分析·····	221
第六节 阴道片·····	223
一、处方设计·····	223
二、实例分析·····	223
第七节 植入片·····	223
一、处方设计·····	223
二、实例分析·····	223
第八节 泡腾片·····	224
一、处方设计·····	224
二、实例分析·····	225
第九节 口含片·····	229
一、处方设计·····	229
二、实例分析·····	229
第十节 咀嚼片·····	231
一、处方设计·····	231
二、实例分析·····	231
第十一节 包衣片·····	234
一、处方设计和工艺·····	234
二、实例分析·····	239
第十二节 口腔速释片·····	247
一、处方设计·····	247

二、实例分析·····	248
第十三节 分散片·····	250
一、处方设计·····	250
二、实例分析·····	251
第十四节 亲水性凝胶骨架片·····	253
一、处方设计·····	254
二、实例分析·····	255
第十五节 溶蚀性骨架片·····	257
一、处方设计·····	258
二、实例分析·····	258
第十六节 胃肠道生物黏附片·····	260
一、处方设计·····	260
二、实例分析·····	261
第十七节 口服渗透泵片·····	262
一、处方设计·····	262
二、实例分析·····	264
第十八节 口服定时给药系统·····	266
一、处方设计·····	266
二、实例分析·····	268
第十九节 胃漂浮片剂·····	268
一、处方设计·····	269
二、实例分析·····	270
第二十节 口服结肠定位片剂·····	270
一、处方设计·····	271
二、实例分析·····	274
第二十一节 微囊片·····	275
一、处方设计·····	275
二、实例分析·····	277
参考文献·····	280
第十四章 滴丸剂·····	281
第一节 概述·····	281
一、定义与分类·····	281
二、特点·····	281
三、常用基质和冷凝剂·····	281
四、制备方法·····	281
五、质量要求·····	282
第二节 滴丸剂处方设计与实例分析·····	283
一、普通滴丸剂·····	283
二、缓控释滴丸剂·····	284
三、肠溶滴丸剂·····	285
四、中药滴丸剂·····	286
参考文献·····	288
第十五章 小丸剂·····	289

第一节 概述	289
一、定义与分类	289
二、特点	289
三、常用辅料	289
四、制备方法	289
五、质量评价方法及要求	290
第二节 小丸剂处方设计与实例分析	291
一、速释小丸剂	291
二、缓控释小丸剂	292
参考文献	293
第十六章 软胶囊剂	294
一、定义	294
二、特点	294
三、原辅料基本要求	294
四、制备方法	295
五、质量要求	295
六、实例	296
参考文献	296
第十七章 膜剂和涂膜剂	297
第一节 膜剂	297
一、定义与分类	297
二、特点	297
三、常用辅料	297
四、制备方法	298
五、质量要求	298
六、实例	298
第二节 涂膜剂	299
一、定义	299
二、特点	299
三、常用辅料	299
四、制备方法	299
五、质量要求	300
六、实例	300
参考文献	300
第十八章 软膏剂	301
第一节 概述	301
一、软膏剂的作用及分类	301
二、软膏剂的质量要求	301
第二节 软膏剂的处方设计、制备与举例	301
一、适合制备软膏剂的药物	301
二、软膏基质	302
三、软膏剂的附加剂	305
四、软膏剂的制备方法	309

五、举例·····	310
参考文献·····	312
第十九章 硬膏剂 ·····	313
第一节 概述·····	313
一、膏药治病的机理·····	313
二、硬膏剂的特点·····	313
三、硬膏剂的分类·····	313
第二节 硬膏剂的处方设计、制备与举例·····	313
一、硬膏剂的处方设计·····	313
二、硬膏剂的制备方法·····	315
三、举例·····	319
参考文献·····	322
第二十章 巴布剂 ·····	323
第一节 概述·····	323
一、巴布剂的特点·····	323
二、巴布剂与中国传统硬膏剂的剂型区别·····	323
第二节 处方设计与举例·····	324
一、巴布剂的设计基础·····	324
二、巴布剂的基本结构·····	324
三、巴布剂的基质·····	324
四、巴布剂的制备工艺研究·····	325
五、巴布剂的质量评价标准研究·····	326
六、举例·····	326
参考文献·····	327
第二十一章 凝胶剂 ·····	328
第一节 概述·····	328
一、凝胶剂和原位凝胶的定义·····	328
二、凝胶剂与原位凝胶的特点·····	328
第二节 凝胶剂的处方设计与举例·····	329
一、处方设计原则·····	329
二、凝胶剂的常用基质与附加剂·····	329
三、凝胶剂的制备方法·····	331
四、举例·····	331
五、凝胶剂的质量要求·····	333
第三节 原位凝胶的处方设计与举例·····	334
一、原位凝胶常用基质与附加剂·····	334
二、给药途径·····	336
三、制备方法及举例·····	336
参考文献·····	338
第二十二章 栓剂 ·····	339
第一节 概述·····	339
一、栓剂的分类·····	339
二、新型栓剂·····	339

三、栓剂的一般质量要求·····	339
第二节 栓剂的作用途径和影响栓剂中药物吸收的因素·····	340
一、栓剂中药物吸收途径·····	340
二、影响栓剂中药物吸收的因素·····	341
第三节 栓剂的处方设计与举例·····	341
一、药物·····	342
二、基质·····	342
三、添加剂·····	343
四、处方设计原则·····	344
五、制备方法·····	345
六、包装材料和贮藏·····	346
七、举例·····	346
八、栓剂的质量评价·····	348
参考文献·····	349
第二十三章 气雾剂 ·····	350
第一节 概述·····	350
一、气雾剂的特点·····	350
二、气雾剂的分类·····	350
第二节 气雾剂处方设计与举例·····	351
一、肺部的吸收·····	351
二、影响药物在呼吸系统分布的因素·····	351
三、气雾剂的组成·····	351
四、气雾剂的处方类型及举例·····	354
五、气雾剂的制备工艺·····	355
六、气雾剂在生产与贮藏期间应符合的规定·····	355
七、气雾剂的质量评定·····	356
第三节 喷雾剂·····	357
一、概述·····	357
二、喷雾装置·····	357
第四节 吸入粉雾剂·····	357
一、概述·····	357
二、粉末雾化器·····	358
第五节 举例·····	358
一、溶液型气雾剂·····	358
二、混悬型气雾剂·····	358
三、乳剂型气雾剂·····	359
四、喷雾剂·····	359
参考文献·····	360
第二十四章 液体制剂 ·····	361
第一节 概述·····	361
一、液体制剂的特点和质量要求·····	361
二、液体制剂的分类·····	361
三、液体制剂的溶剂和附加剂·····	362

第二节 液体制剂的处方设计和举例..... 365

一、糖浆剂的处方设计和举例..... 365

二、合剂的处方设计和举例..... 368

三、溶液型液体制剂的处方设计和举例..... 370

四、芳香水剂的处方设计和举例..... 372

五、酊剂的处方设计和举例..... 373

六、醑剂的处方设计和举例..... 374

七、甘油剂的处方设计和举例..... 374

八、混悬剂的处方设计和举例..... 375

九、乳剂的处方设计和举例..... 382

参考文献..... 385

第一章 绪论

一、剂型发展历程

药物剂型 (dosage form) 是为适应诊断、治疗或预防疾病的需要而制备的不同给药形式,是临床使用的最终形式。剂型是药物的传递体,将药物输送到体内发挥疗效。各种剂型中的具体药品称为药物制剂 (pharmaceutical preparations),简称制剂。药物剂型的发展及应用最终形成了药剂学及各分支学科。

现代制剂约有 150 余年的历史,1843 年 Brockedon 制备了模印片,1847 年 Murdock 发明了硬胶囊剂,1931 年实现机械化生产。1876 年 Remington 等发明了压片机,使压制片得到发展。1886 年 Limousin 发明了安瓿,使注射剂得到迅速发展。在经历了 18 世纪和 19 世纪的初级发展阶段后,在迅速发展的基础学科的渗入和推动下,药物剂型在 20 世纪也相应地加快了发展步伐,根据在此期间发展的几个比较明显的特征,大致可以将其近代发展归纳为以下几个历史时期。

20 世纪 50 年代后期,由于合成化学、微生物学、药理学、生物化学、物理化学和化学动力学等的发展和渗入,促使药剂学进入了以化学和物理化学理论为基础来设计、生产和评价药物制剂的物理药剂学时代。从化学和物理性状方面提高药品的内在和外在质量是该时期药剂学的主要特点,在这一时期药剂学初步建立了药物剂型和制剂处方设计及工艺设计的理化基础理论。

20 世纪 60~70 年代,药物的数量有较快的增长,制剂生产水平也有较大提高,但仅从体外的化学标准和一般性状来评价药物制剂质量逐渐暴露出其局限性。来自不同厂家但具有相同化学质量的药品在临床治疗中出现不同的疗效,有些效果不佳,有些毒副作用强,甚至在临床治疗中出现了严重的事故。同时,临床药理学、生物药剂学、药物动力学、药效学、临床化学、生物统计学的发展和渗入,促使药剂学进一步从药物在体内的吸收、分布、代谢、排泄 (ADME) 过程及其与机体和疾病的关系来设计剂型和制剂、评价药品质量,把药剂学推进到生物药剂学时代,药物剂型和制剂研究向以人为本的思想迈进了一大步。

20 世纪 80 年代,在合理评价药品体内外质量的基础上,因伦理学、药物经济学、毒理学、药物相互作用及高分子科学、计算机技术等的发展和渗入,社会对生命和生存质量的关心提升到一个新的高度,促使药剂学者在设计剂型和制剂时更加周密地考虑药物在体内 ADME 的量变过程与生理状态和病理变化的关系,与疾病进程的关系,使制剂符合患者用量最小、疗效最高、毒副作用最小、使用方便舒适的要求,药剂学进入了临床药剂学时代,至此药物剂型和制剂研究完整地树立了以人为本的牢固基础。

20 世纪 90 年代以来,药物剂型和制剂研究进入了药物传输系统时代。由于分子药理学、细胞信息与调控学、药物分子设计学、系统工程学等科学的发展和渗入及新技术的不断涌现,人们不仅用客观数据来科学地说明药物制剂的体外溶出、释放与体内药物在 ADME 过程中的变化的相关性,还结合器官、组织和细胞的生理特点与药物分子的关系来探索剂型的结构与其功能的关系,有目的地解决制剂对病灶、细胞的有效传递和主动传递问题。所以,从发展的趋势而言,21 世纪的药剂学是药物制剂向细胞水平和分子水平发展的药物传递系统 (DDS) 时代。

药剂学的发展,离不开传统制剂的发展。我国药剂学是祖国医药遗产中的重要组成部分。祖国医药遗产极为丰富,在学习、继承和发扬祖国医药遗产的同时,也学习了西方药剂学的理论、技术和方法,结合我国药学的实际,创造了我国药剂学的辉煌成就。

中医药已有数千年的历史。“神农尝百草,始有医药”包含了鉴别药效和简单“咬咀”的用药方法,以后发展为新鲜药材捣碎使用,后又经修治、加工制成一定剂型应用。

汤剂是我国应用最早的中药剂型之一。在晋皇甫谧的《针灸甲乙经》序中即有“伊尹选用神农本草以为汤”，说明汤剂于商代（公元前 1766 年）即已创造使用。在战国时期《素问·汤液醪醴》有“当今之世，必齐毒药”的记载。毒，指药，齐指药剂，说明当时就推崇药剂来治疗疾病。夏商周时期医书《五十二病方》、《甲乙经》、《山海经》就记载将药材加工制成酒剂、汤剂、洗浴剂、饼剂、曲剂、丸剂、膏剂等剂型使用。先秦医方中就有“合药”、“冶合”等词汇记载，这是制剂和炮炙的含义。《隋书·经籍志》记载“本草病源合药节度”就是比较原始的制药著作。东汉张仲景（公元 142—219 年）的《伤寒论》和《金匮要略》著作中就收载有栓剂、洗剂、软膏剂、糖浆剂等剂型十余种。两晋、南北朝时期，各史籍记载药学专著已达 110 余种，这时中药学才逐步形成独立的学科。晋代葛洪（公元 281—341 年）著《肘后备急方》，书内记载了铅硬膏、干浸膏、蜡丸、浓缩丸、锭剂、条剂、尿道栓剂，并将成药、防疫药剂及兽用药剂列为专章论述。唐代孙思邈（公元 581—682 年）著《备急千金要方》、《千金翼方》，对中药学的理论和药材的产地、加工、炮炙、标准等都有专章论述。当时颁布了我国第一部也是世界上最早的国家药典——唐《新修本草》。宋代中药饮片、成方制剂生产规模日益扩大，出现了官办手工药厂，几经演变药厂最后称为“惠民和剂局”，有配方、监制、检验等责任制。后将“和剂局”的配方编辑成《太平惠民和剂局方》，是我国最早的一部国家制剂规范。比英国最早的局方早 500 余年。明代李时珍（公元 1518—1593 年）的名著《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，收载的药物有 1892 种、剂型 61 种、附方 11096 则，充分展示了祖国医药学中药物剂型的绚丽多彩，不仅提供了丰富的药剂学研究资料，对世界药学的发展也有重大贡献。《本草纲目》已被许多国家翻译并深入研究。

国外剂型发展最早的是古埃及与古巴比伦王国，《伊伯氏纸草本》是约公元前 1552 年的遗著，记载有散、膏、硬膏、丸、模印片、软膏等许多剂型，并有药物处方、制法、用途。被西方各国奉为药剂学鼻祖的格林（Galen，公元 131—201 年）是罗马籍希腊人，与我国汉代张仲景同期，在他的著作中记述了散剂、丸剂、浸膏剂、溶液剂、酒剂、酏剂等多种剂型，人们称之为“格林制剂”，至今还在一些国家应用。

19 世纪西方科学和工业技术蓬勃发展。由于制药机械的发明，药物制剂生产的机械化、自动化也在此时期得到迅速发展。到 20 世纪以后，由于各基础学科的迅速发展，学科分工越来越细，从而使药剂学也逐渐形成了一门独立的学科。

新中国成立后，在“中医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高”的方针指引下，在全国倡导学习中医、研究中药新剂型，研制出颗粒剂、片剂、涂膜剂、膜剂、气雾剂、注射剂、中西药组方制剂等中药新剂型，在临床上取得了显著药效。近 20 年来，国家投入大量人力、物力和财力进行中药新剂型研究和攻关，取得了显著成就。《中华人民共和国药典》（以下简称《中国药典》）1995 年版一部收载中药制剂 398 种，其中中药新剂型就有 105 种。在中药及其制剂的质量控制和质量研究方面也取得显著成就，至 1995 年止我国单味药及其制剂已有 200 种以上可进行含量测定，其中高效液相色谱法 57 种、气相色谱法 26 种、薄层扫描法 58 种、分光光度法和比色法 45 种、其他 14 种。

随着与医药科学相关的各种基础理论科学突飞猛进的发展，药剂学的发展也非常迅速，首先对基础理论方面的研究，有了较大的提高。自 20 世纪 50 年代以来，物理化学的基本原理与药剂学的剂型相结合，产生了药剂学基本理论，如药物稳定性、溶解理论、流变学、粉体学等，促进了药剂学的发展，提高了药物制剂质量控制的水平。

20 世纪 60~80 年代药物剂型和制剂研究发展到一个新的阶段。由于生物药剂学的发展，人们对药物制剂在体内的生物效应有了新的认识，从而改变了过去认为化学结构是决定药效的唯一因素的片面看法，认识到剂型因素在一定条件下对药物的药效有决定性影响，这已经成为剂型设计时应考虑的重要条件。近年来对生物利用度及其实验方法的研究也有很大发展，生物利用度测定已经成为新药研究的重要内容，对药物在体内的吸收、分布、代谢、排泄过程及影响因素的研