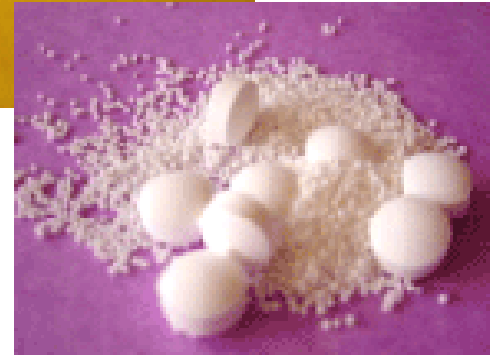
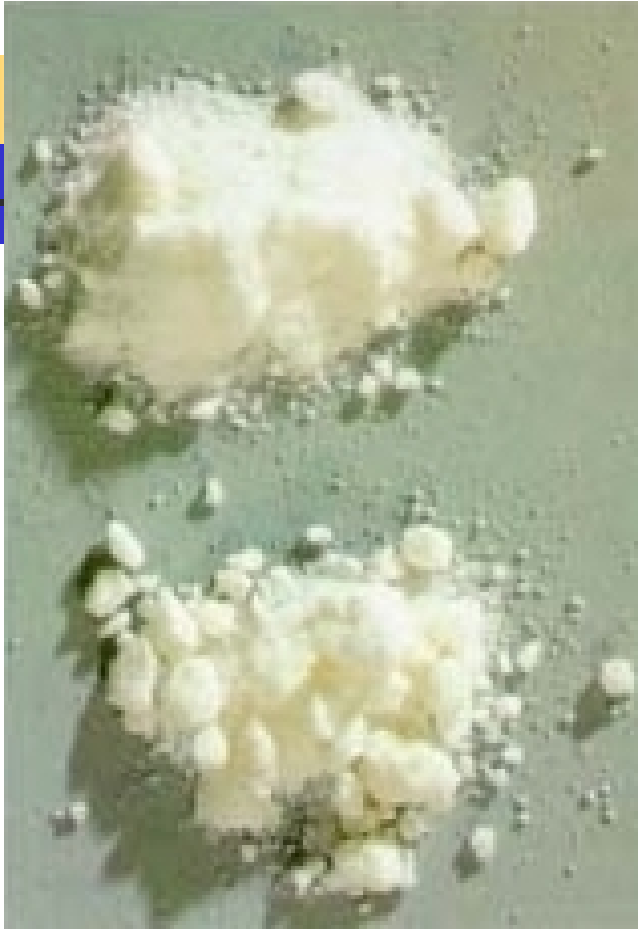
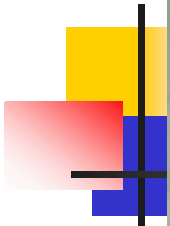


第六章 药剂学

(Pharmaceutics)







内容:

- 第一节 概述
- 第二节 药剂学分支学科
- 第三节 药品剂型与DDS
- 第四节 辅料在药品制剂中应用
- 第五节 药典与药品标准
- 第六节 药剂学沿革与发展

第一章 绪论

第一节 药剂学概念与任务

一、药剂学概念

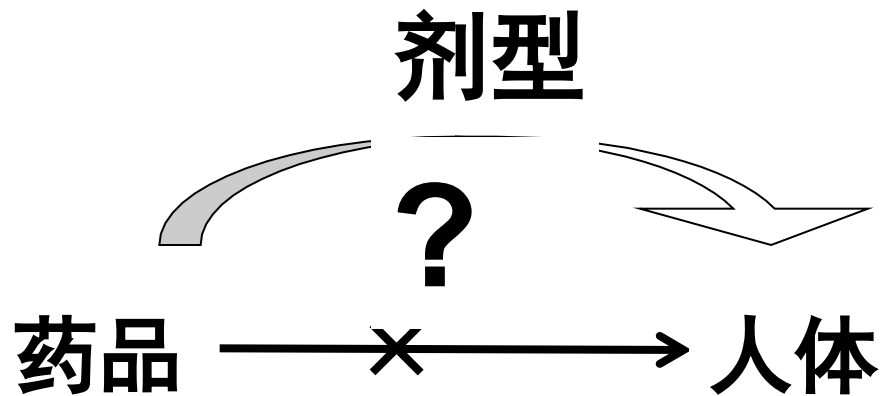
二、药剂学任务


一、药剂学概念

1. 药剂学 (pharmaceutics) 是研究药品制剂基本理论、处方设计、制备工艺和合理应用综合性技术科学。

- 研究对象：药品制剂
- 研究内容：药品制剂基本理论、处方设计、制备工艺和合理应用等
- 药剂学是一门综合性技术科学

2. 药品 (drugs) : 含有生物活性, 可能用于防治人类或动物疾病物质。





**3.药品剂型(drug dosage form): 指
适合临床需要、与给药路径相适应最正
确给药形式, 简称剂型。**

■剂型适合临床需要

■剂型与给药路径相适应

同一药品可制成各种剂型，各种路径给药。

头孢拉定 { 口服给药—片剂、胶囊剂、口服液
皮肤给药—软膏剂
注射给药—粉针剂



- 胰岛素受胃肠酶分解；链霉素胃肠不吸收→注射剂
- 睾丸素肝脏首过作用严重→口腔粘膜片
- 红霉素胃酸分解并刺激性较大→肠溶制剂

药品剂型：

任何一个药品，在供临床应用之前，都必须制成适合于治疗或预防应用、于一定给药路径相适应给药方式。

- ❏ 片剂
- ❏ 注射剂
- ❏ 胶囊剂
- ❏ 软膏剂
- ❏ 栓剂
- ❏ 气雾剂



4.药品制剂 (drug preparations):

指依据药典或国家标准将药品制成适合临床要求剂型并符合一定质量标准，要求有适应症、使用方法和用量物质。



二、药剂学任务

- 研究药剂学基本理论与生产技术
- 新剂型和新制剂研究与开发
- 药用新辅料研究与开发
- 中药当代制剂研究与开发
- 医药新技术研究与开发
- 新型制药机械和设备研究与开发

二、药剂学任务

1. 药剂学基本理论研究

- 新剂型和新制剂研究与开发
- 药用新辅料研究与开发
- 中药当代制剂研究与开发
- 医药新技术研究与开发
- 新型制药机械和设备研究与开发

◆

- 药品稳定性

- 难溶性药品溶解度

- 药品粉体性质



- 片剂压缩成形理论

- 流体流变学



- 生物药剂学和药品动力学评价制剂质量

二、药剂学任务

1. 药剂学基本理论研究

+2. 新剂型和新制剂研究与开发

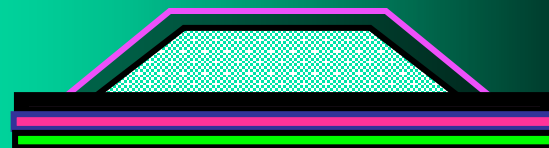
- 药用新辅料研究与开发
- 中药当代制剂研究与开发
- 医药新技术研究与开发
- 新型制药机械和设备研究与开发

● 缓释、控释制剂

● 靶向制剂

● 口腔速溶片剂

● 透皮给药制剂



● 长时间缓释注射剂

二、药剂学任务

1. 药剂学基本理论研究

2. 新剂型和新制剂研究与开发

3. 药用新辅料研究与开发

➤ 中药当代制剂研究与开发

➤ 医药新技术研究与开发

➤ 新型制药机械和设备研究与开发

● 乙基纤维素、丙烯酸树脂、醋酸纤维素

● 可降解聚乳酸、聚乳酸聚乙醇酸共聚物

● 微晶纤维素、可压性淀粉、

低取代羟丙基纤维素

二、药剂学任务

1. 药剂学基本理论研究

2. 新剂型和新制剂研究与开发

3. 药用新辅料研究与开发

4. 中药当代制剂研究与开发

➤ 医药新技术研究与开发

➤ 新型制药机械和设备研究与开发

● 中药注射剂、颗粒剂
片剂、胶囊、滴丸剂



● 中药缓、控释制剂

● 中药靶向微球制剂

● 中药鼻腔给药制剂

二、药剂学任务

1. 药剂学基本理论研究

2. 新剂型和新制剂研究与开发

3. 药用新辅料研究与开发

4. 中药当代制剂研究与开发

5. 医药新技术研究与开发

▶ 新型制药机械和设备研究与开发

● 微囊化技术、固体分散技术、包合技术

● 脂质体技术、球晶制粒技术、纳米技术等

● 激光技术、离子交换技术、电导技术、超声波技术

二、药剂学任务

1. 药剂学基本理论研究
2. 新剂型和新制剂研究与开发
3. 药用新辅料研究与开发
4. 中药当代制剂研究与开发
5. 医药新技术研究与开发
6. 新型制药机械和设备研究与开发

- 生产实现封闭、高效、多功效、连续化和自动化
- 流化床制粒机可完成混合、制粒、干燥
- 搅拌流化制粒机、挤出滚圆制粒机、离心制粒机
- 高效全自动压片机
- 入墙层流注射灌装生产线、高效喷淋加热灭菌器



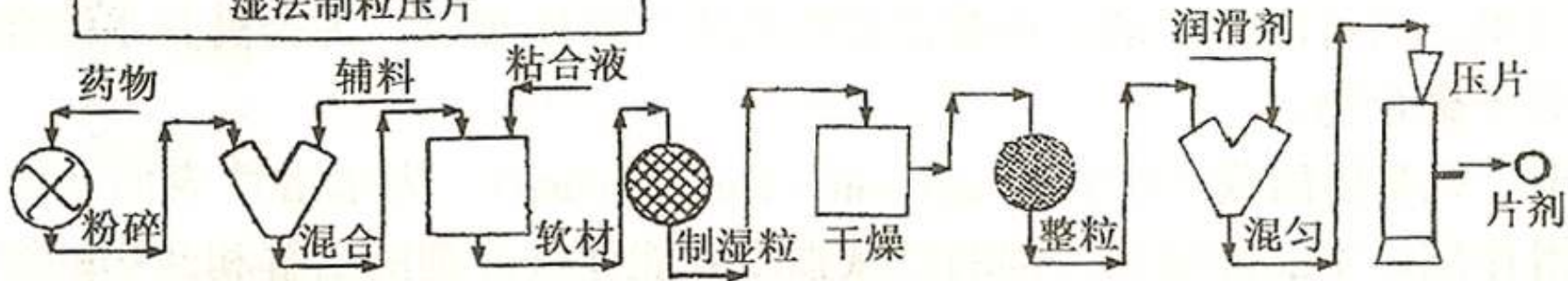
第二节 药剂学分支学科

- 工业药剂学
- 物理药剂学
- 药用高分子材料学
- 生物药剂学
- 药品动力学
- 临床药理学

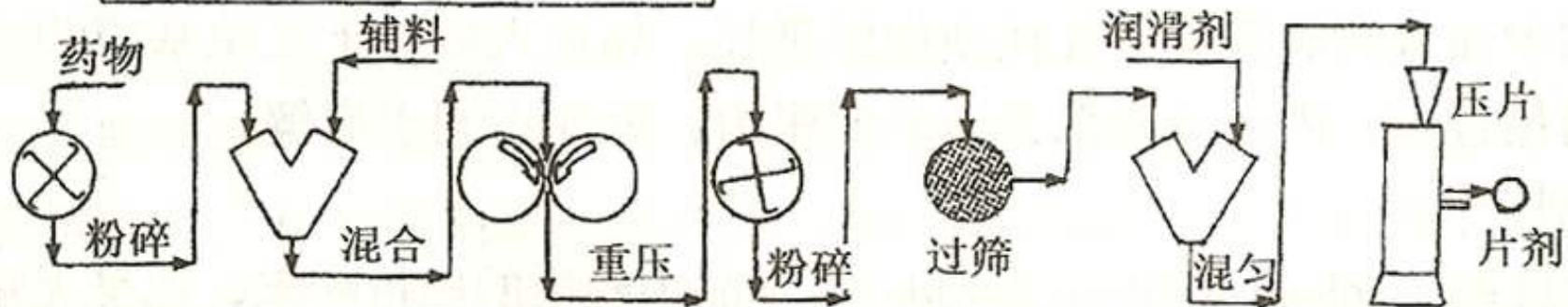
➤ **工业药剂学 (industrial pharmaceuticals)**：研究制剂工业化生产基本理论、工艺技术、生产设备和质量管理一门分支学科。

工业药剂学是药剂学关键，加强了制剂加工技术，并吸收材料、机械、粉体学、化学工程学，为制剂研究和生产创造了更加好条件。

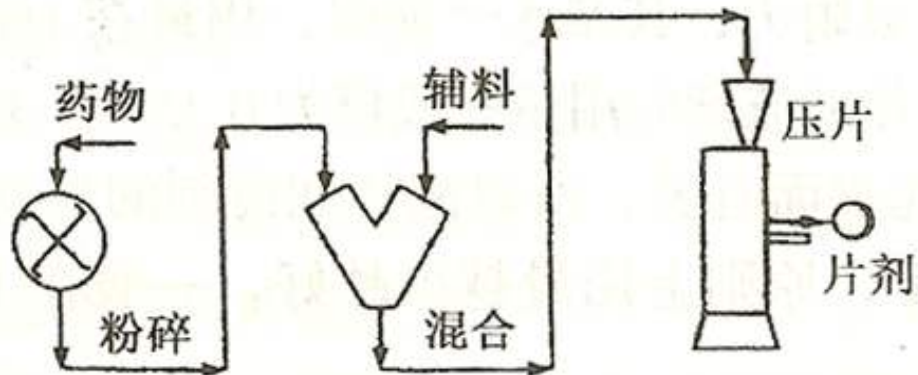
湿法制粒压片



干法制粒压片




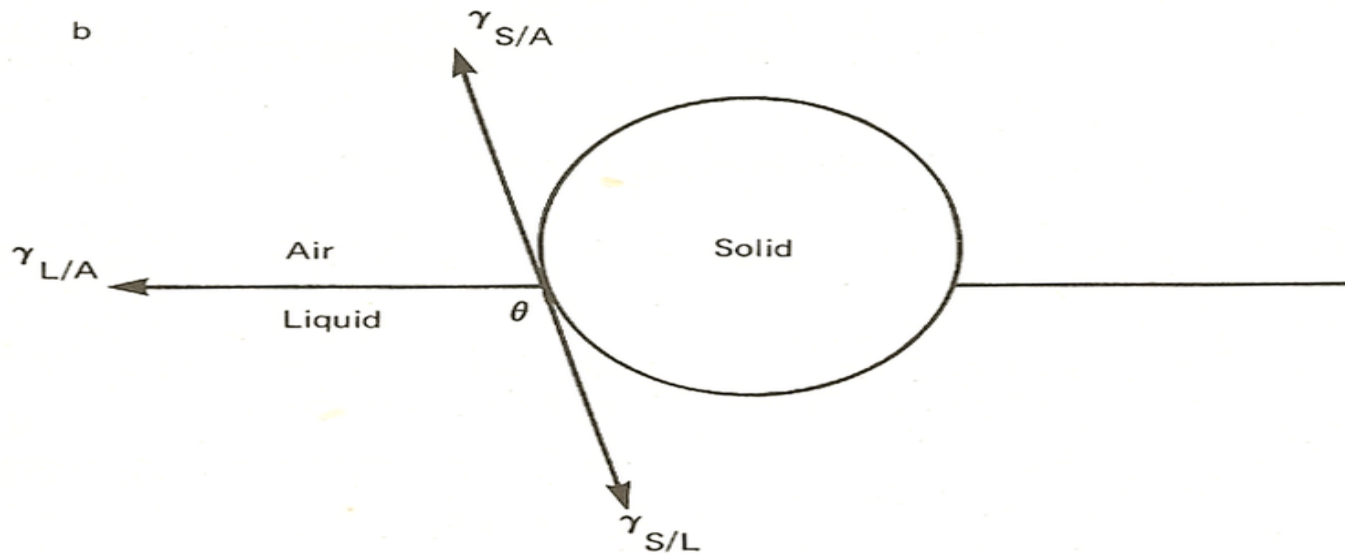
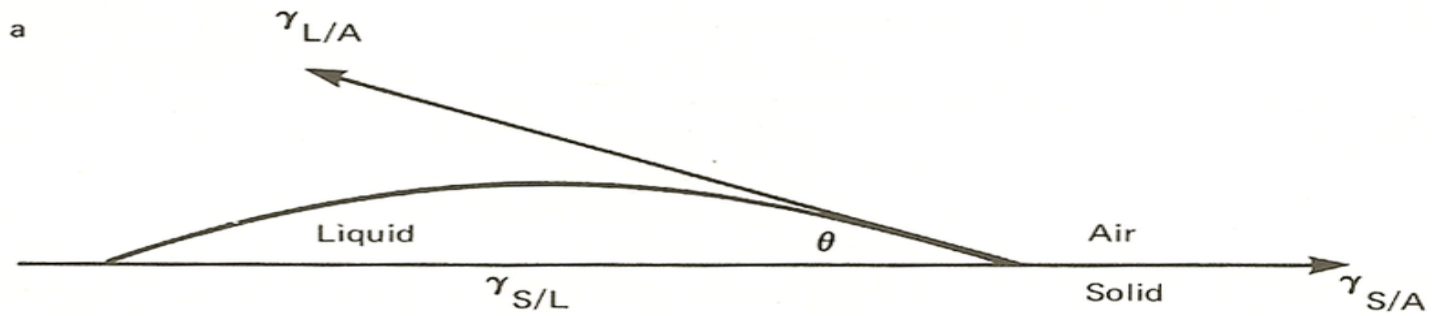
粉末直接压片



➤ **物理药剂学**（physical pharmacy）：
应用物理化学原理和伎俩，研究药品制剂剂型设计、制备工艺、质量控制、稳定性等过程学科。

物理药剂学是药品剂型设计理论基础，50年代以来，化学动力学、表面化学、胶体化学、流变学等学科应用，促进药剂学科科学化 and 理论化。

- 
- 应用物理化学基本原理和伎俩，吸收流体力学、结构化学等理论和方法，
 - 研究新剂型、新制剂在制造和贮存过程中现象及内在规律，
 - 并为指导新剂型、新制剂设计和开发提供理论基础。



Equilibrium between forces acting on (a) a drop of liquid on a solid surface
 (b) A partially immersed solid


➤ 药用高分子材料学（polymer science in pharmaceuticals）：研究药剂学中高分子材料结构、性能、制备及其功效与应用，为新剂型设计提供新型高分子材料和新方法。

药用高分子对创造新剂型和提升制剂质量起着主要支撑和推进作用。

没有高分子材料就没有当代药品剂型及制剂。

▶ **生物药剂学 (biopharmaceutics) :**
研究药品及其剂型在体内吸收、分布、代谢与排泄过程，说明药品剂型原因、生理原因与药效三者之间关系。

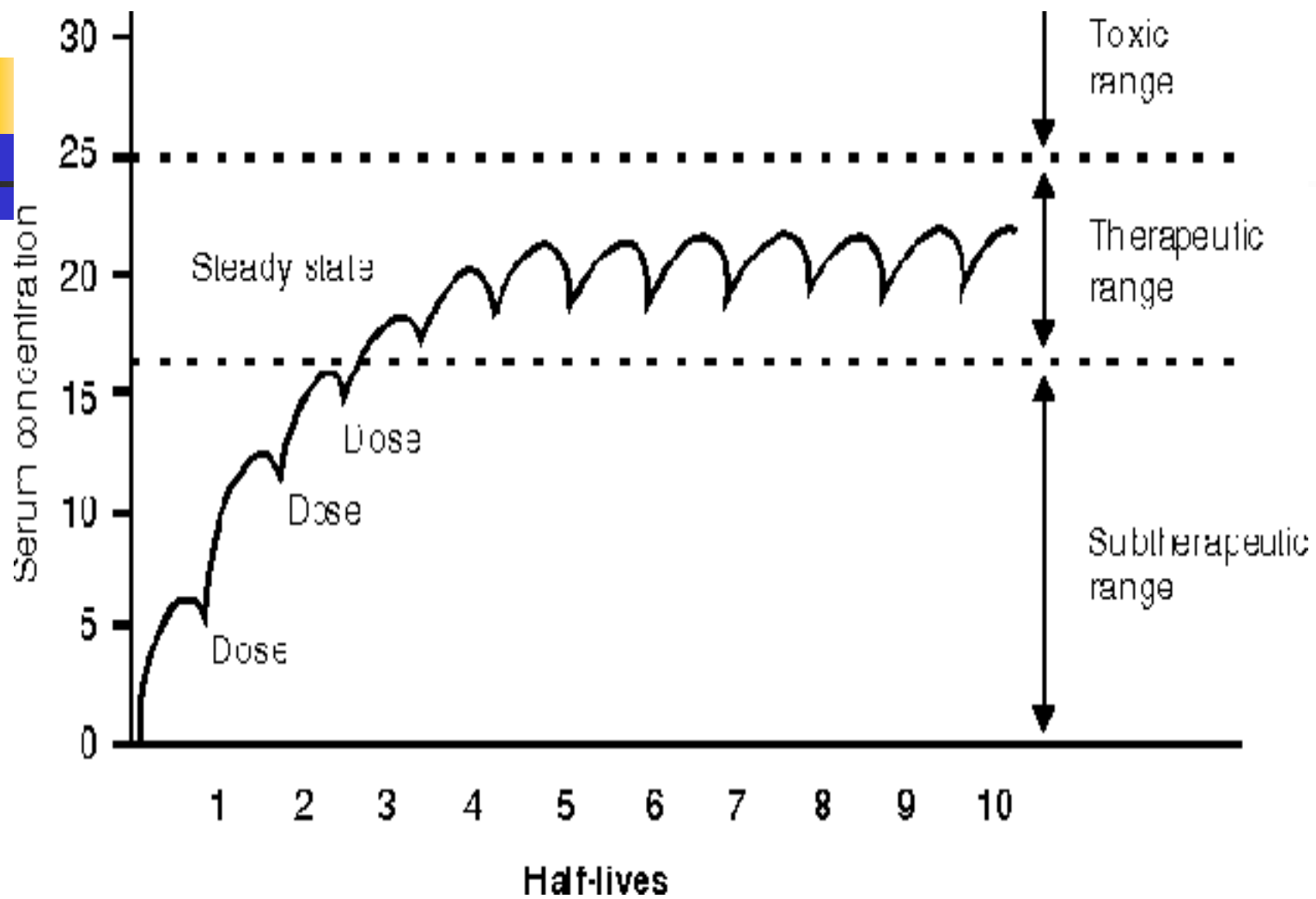
生物药剂学着重于药品体内过程，结合药理学、药效学及生理学等知识，并利用药品体内外相关性，对药品新剂型合理设计、用药安全性和有效性含有指导意义。

- 
- **bioequivalence(BE)/Bioavailability(BA)**
 - **food effects on BE/BA**
 - **in vitro dissolution/In vivo BA correlation**
 - **other formulation issues**

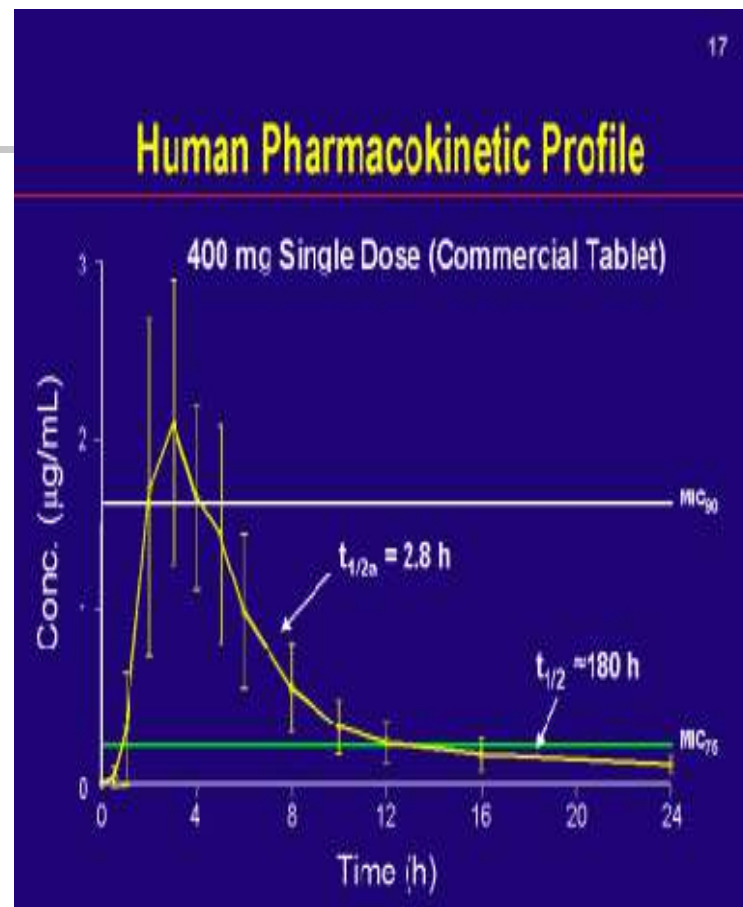
▶ **药品动力学（pharmacokinetics）：用数学方法，研究药品及其代谢物在机体内含量—时间改变过程，为指导剂型设计、安全合理用药提供量化指标。**

药品动力学与数学、药理学、药效学和临床治疗学等含有亲密关系。

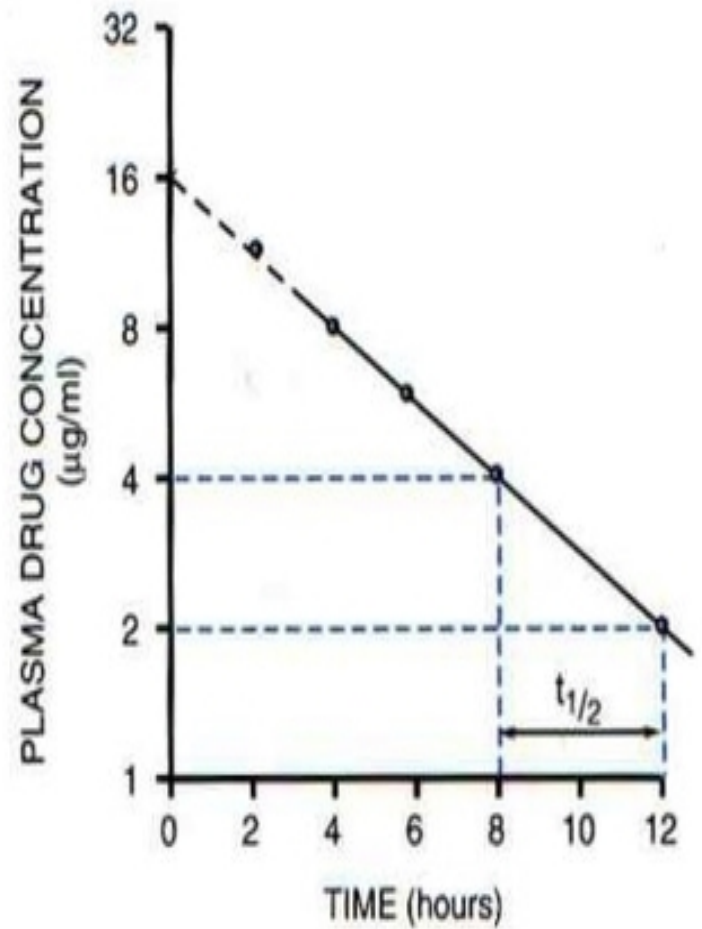
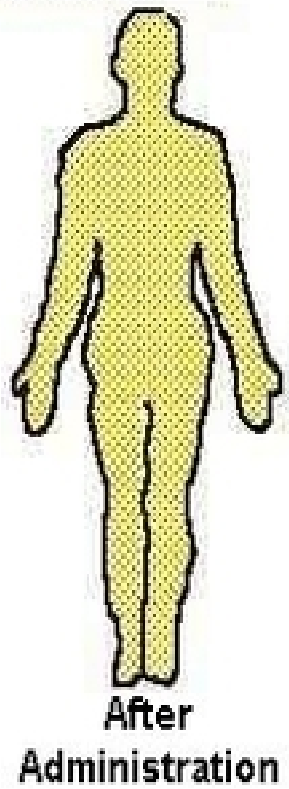
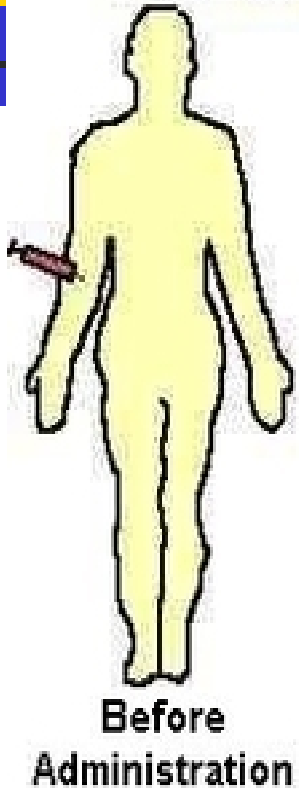
70年代成为一门独立学科，现已出现时辰药品动力学、手性药品动力学、群体药品动力学等，发展十分快速。



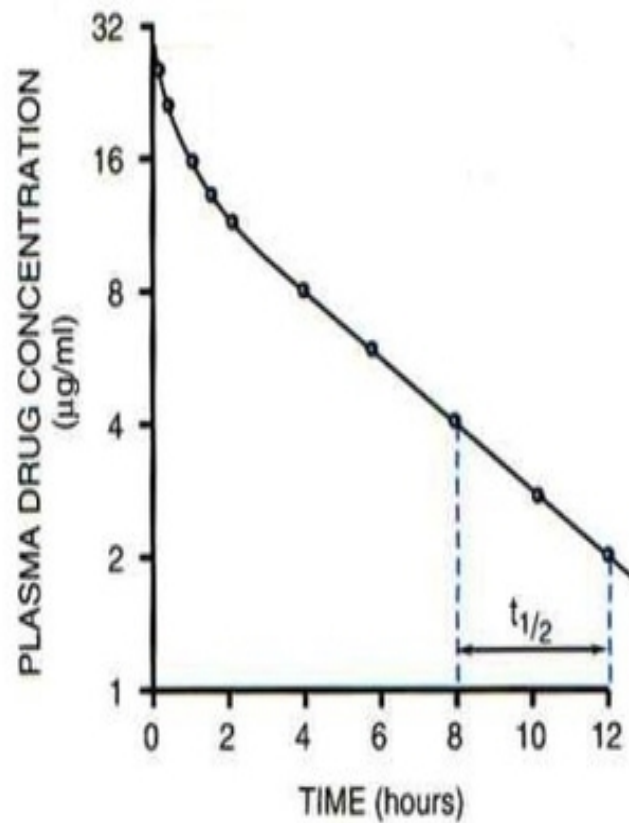
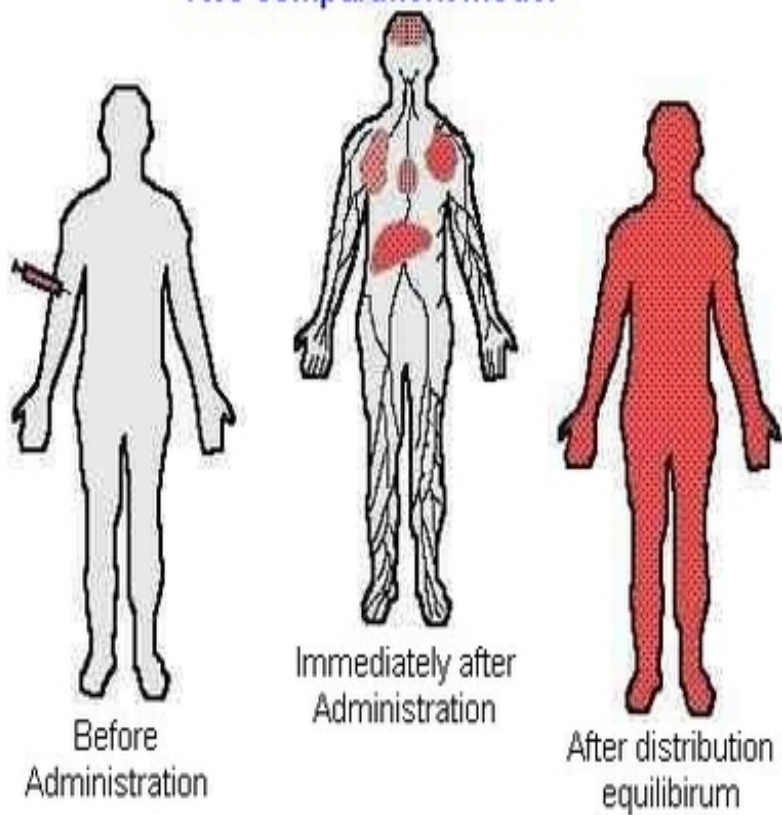
是研究药品及其代谢物在人体或动物体内含量随时间改变过程，并提出用于解释这一过程数学模型，为指导合理安全用药、剂型和剂量设计等提供量化指标。




One compartment model



Two compartment model



- 
- ▶ **临床药剂学（clinical pharmaceuticals）**
：与临床治疗学紧密联络，以患者为对象，研究合理、有效、安全用药等。
 - ▶ **主要内容包含：制剂临床评价；药品制剂生物利用度；药品剂量临床监控；药品配伍改变及相互作用及指导临床合理用药。**



第三节 药品剂型与DDS

一、药品剂型主要性

剂型是药品传递体，是临床使用最终形式。

药品剂型选择与给药路径亲密相关，应依据药品性质、不一样治疗目标选择合理剂型与给药方式。药品剂型必须与给药路径相适应。

药品剂型主要性

- 1. 不一样剂型改变药品作用性质**
- 2. 不一样剂型改变药品作用速度**
- 3. 不一样剂型改变药品毒副作用**
- 4. 有些剂型可产生靶向作用**
- 5. 有些剂型影响疗效**

二、药品剂型分类

(一) 按给药路径分类

1、经胃肠道给药剂型

散剂、片剂、胶囊剂、溶液剂、乳剂、
混悬剂等

2、经非胃肠道给药剂型

注射给药：注射剂

呼吸道给药：喷雾剂、气雾剂

皮肤给药：软膏剂

粘膜给药：滴眼剂、贴膜剂

腔道给药：栓剂、泡腾片



（二）按分散系统分类

- 溶液型：芳香水剂、溶液剂、注射剂
- 胶体溶液型：胶浆剂、火棉胶剂、涂膜剂
- 乳剂型：乳剂（口服、静脉、搽剂）
- 混悬型：混悬剂、合剂、洗剂
- 气体分散型：气雾剂
- 微粒分散型：微球/微囊制剂、纳米囊制剂
- 固体分散型：散剂、颗粒剂、片剂、胶囊剂

- 👉 溶液型（均匀分散体系，药品一分子或离子状态存在，直径小于**1nm**）
- 👉 胶体溶液型（不均匀或均匀分散系统，**1~100nm**）
- 👉 乳状液型（不均匀分散系统, **0.1~50 μm** ）
- 👉 混悬液型（不均匀分散系统, **0.1~50 μm** ）
- 👉 气体分散型（不均匀分散系统）
- 👉 固体分散型
- 👉 微粒型



(三) 按形态分类

- 液体制剂：溶液剂、水针剂
- 气体制剂：气雾剂、喷雾剂
- 固体制剂：片剂、胶囊剂、颗粒剂、散剂、丸剂
- 半固体制剂：软膏剂、凝胶剂

按形态分类

- 液体剂型
- 固体剂型
- 半固体剂型
- 气体剂型



三、药品传递系统

(drug delivery system, DDS)

- 缓释、控释制剂
- 靶向制剂（包含靶向修饰）
- 脉冲给药系统
- 择时给药系统
- 自调式释药系统
- 经皮给药系统
- 生物技术制剂
- 粘膜给药系统

第四节 辅料在药品制剂中应用

辅料作用：

1. 有利于制剂形态形成
2. 使制备过程顺利进行
3. 提升药品稳定性
4. 调整有效成份作用或改进生理要求

第五节 药典与药品标准

- 一、药典** (pharmacopoeio)是一个国家记载药品标准、规格法典，普通由国家药典委员会组织编纂，并由政府颁布、执行，含有法律约束力。
- **收载品种**：疗效确切、副作用小、质量稳定惯用药品及其制剂，以及其质量标准。在制剂通则中还要求各种剂型相关标准、检验方法等。
 - **药典作用**：作为药品生产、检验、供给和使用依据。

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：<https://d.book118.com/706101125231010201>