



供药学类专业用

生物药剂学与 药物动力学

□ 主编 张淑秋 王建新

在线学习版

教学资源 ⊙ 练习测试
互动教学 ⊙ 智能学习



全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材

生物药剂学与药物动力学

(供药学类专业用)

主 编 张淑秋 王建新

副主编 刘中秋 刘晓娟 丁志英 丁劲松

编 者 (以姓氏笔画为序)

丁志英 (吉林大学药学院)

丁劲松 (中南大学药学院)

王 玮 (河南大学药学院)

王 凌 (四川大学华西药学院)

王建新 (复旦大学药学院)

刘中秋 (广州中医药大学)

刘明妍 (中国医科大学)

刘晓娟 (辽宁医学院)

宋 道 (陕西中医药大学)

张丽锋 (山西医科大学)

张淑秋 (山西医科大学)

赵 领 (四川医科大学)

郭新红 (郑州大学药学院)

储晓琴 (安徽中医药大学)

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本教材是全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材之一。全书共十四章，第一至第六章介绍了生物药剂学的基本概念与理论，主要阐述了药物吸收、分布、代谢、排泄过程的规律及其影响因素；第七至第十四章介绍了药物动力学基本概念、基本理论及其在新药研发及合理用药中的应用。

本教材在介绍理论知识的同时，注重引入与合理用药和药物研发相关的实际案例，以培养学生理论联系实际的应用能力和分析问题、解决问题的能力；每章还有“学习导引”“知识链接”“本章小结”“练习题”等模块，增强了教材内容的指导性、可读性和趣味性；理论知识深入浅出、难度适宜。同时，为丰富教学资源，增强教学互动，更好地满足教学需要，本教材免费配套中国医药科技出版社“爱慕课”在线学习平台（含电子教材、教学课件、习题、图片和视频等）。主要供医学院校药学类相关专业本科生使用，也可作为药学类专业研究生、药师、执业药师、临床医师及医药生产与科研单位专业技术人员的参考书。

图书在版编目（CIP）数据

生物药剂学与药物动力学/张淑秋，王建新主编. —北京：中国医药科技出版社，2016.1
全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材

ISBN 978-7-5067-7882-4

I. ①生… II. ①张… ②王… III. ①生物药剂学—医学院校—教材 ②药物代谢动力学—医学院校—教材 IV. ①R945 ②R969.1

中国版本图书馆 CIP 数据核字（2015）第 315090 号

美术编辑 陈君杞

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号

邮编 100082

电话 发行：010-62227427 邮购：010-62236938

网址 www.cmstp.com

规格 787×1092mm¹/₁₆

印张 21³/₄

字数 495 千字

版次 2016 年 1 月第 1 版

印次 2016 年 1 月第 1 次印刷

印刷 廊坊市广阳区九洲印刷厂

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5067-7882-4

定价 45.00 元

版权所有 盗版必究

举报电话：010-62228771

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材

出版说明

全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材，是在深入贯彻教育部有关教育教学改革和我国医药卫生体制改革新精神，进一步落实《国家中长期教育改革和发展规划纲要》（2010-2020年）的形势下，结合教育部的专业培养目标和全国医学院校培养应用型、创新型药学专门人才的教学实际，在教育部、国家卫生和计划生育委员会、国家食品药品监督管理总局的支持下，由中国医药科技出版社组织全国近100所高等医学院校约400位具有丰富教学经验和较高学术水平的专家教授悉心编撰而成。本套教材的编写，注重理论知识与实践应用相结合、药学与医学知识相结合，强化培养学生的实践能力和创新能力，满足行业发展的需要。

本套教材主要特点如下：

1. 强化理论与实践相结合，满足培养应用型人才需求

针对培养医药卫生行业应用型药学人才的需求，本套教材克服以往教材重理论轻实践、重化工轻医学的不足，在介绍理论知识的同时，注重引入与药品生产、质检、使用、流通等相关的“实例分析/案例解析”内容，以培养学生理论联系实际的应用能力和分析问题、解决问题的能力，并做到理论知识深入浅出、难度适宜。

2. 切合医学院校教学实际，突显教材内容的针对性和适应性

本套教材的编者分别来自全国近100所高等医学院校教学、科研、医疗一线实践经验丰富、学术水平较高的专家教授，在编写教材过程中，编者们始终坚持从全国各医学院校药学教学和人才培养需求以及药学专业就业岗位的实际要求出发，从而保证教材内容具有较强的针对性、适应性和权威性。

3. 紧跟学科发展、适应行业规范要求，具有先进性和行业特色

教材内容既紧跟学科发展，及时吸收新知识，又体现国家药品标准 [《中国药典》(2015年版)]、药品管理相关法律法规及行业规范和2015年版《国家执业药师资格考试》（《大纲》、《指南》）的要求，同时做到专业课程教材内容与就业岗位的知识 and 能力要求相对接，满足药学教育教学适应医药卫生事业发展要求。

4. 创新编写模式，提升学习能力

在遵循“三基、五性、三特定”教材建设规律的基础上，在必设“实例分析/案例解析”

模块的同时，还引入“学习导引”“知识链接”“知识拓展”“练习题”（“思考题”）等编写模块，以增强教材内容的指导性、可读性和趣味性，培养学生学习的自觉性和主动性，提升学生学习能力。

5. 搭建在线学习平台，丰富教学资源、促进信息化教学

本套教材在编写出版纸质教材的同时，均免费为师生搭建与纸质教材相配套的“爱慕课”在线学习平台（含数字教材、教学课件、图片、视频、动画及练习题等），使教学资源更加丰富和多样化、立体化，更好地满足在线教学信息发布、师生答疑互动及学生在线测试等教学需求，提升教学管理水平，促进学生自主学习，为提高教育教学水平和质量提供支撑。

本套教材共计29门理论课程的主干教材和9门配套的实验指导教材，将于2016年1月由中国医药科技出版社出版发行。主要供全国普通高等医学院校药学类专业教学使用，也可供医药行业从业人员学习参考。

编写出版本套高质量的教材，得到了全国知名药学专家的精心指导，以及各有关院校领导和编者的大力支持，在此一并表示衷心感谢。希望本套教材的出版，将会受到广大师生的欢迎，对促进我国普通高等医学院校药学类专业教育教学改革和药学类专业人才培养作出积极贡献。希望广大师生在教学中积极使用本套教材，并提出宝贵意见，以便修订完善，共同打造精品教材。

中国医药科技出版社
2016年1月

全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材 书 目

序号	教材名称	主编	ISBN
1	高等数学	艾国平 李宗学	978-7-5067-7894-7
2	物理学	章新友 白翠珍	978-7-5067-7902-9
3	物理化学	高 静 马丽英	978-7-5067-7903-6
4	无机化学	刘 君 张爱平	978-7-5067-7904-3
5	分析化学	高金波 吴 红	978-7-5067-7905-0
6	仪器分析	吕玉光	978-7-5067-7890-9
7	有机化学	赵正保 项光亚	978-7-5067-7906-7
8	人体解剖生理学	李富德 梅仁彪	978-7-5067-7895-4
9	微生物学与免疫学	张雄鹰	978-7-5067-7897-8
10	临床医学概论	高明奇 尹忠诚	978-7-5067-7898-5
11	生物化学	杨 红 郑晓珂	978-7-5067-7899-2
12	药理学	魏敏杰 周 红	978-7-5067-7900-5
13	临床药物治疗学	曹 霞 陈美娟	978-7-5067-7901-2
14	临床药理学	印晓星 张庆柱	978-7-5067-7889-3
15	药物毒理学	宋丽华	978-7-5067-7891-6
16	天然药物化学	阮汉利 张 宇	978-7-5067-7908-1
17	药物化学	孟繁浩 李柱来	978-7-5067-7907-4
18	药物分析	张振秋 马 宁	978-7-5067-7896-1
19	药用植物学	董诚明 王丽红	978-7-5067-7860-2
20	生药学	张东方 税丕先	978-7-5067-7861-9
21	药剂学	孟胜男 胡容峰	978-7-5067-7881-7
22	生物药剂学与药物动力学	张淑秋 王建新	978-7-5067-7882-4
23	药物制剂设备	王 沛	978-7-5067-7893-0
24	中医药学概要	周 晔 张金莲	978-7-5067-7883-1
25	药事管理学	田 侃 吕雄文	978-7-5067-7884-8
26	药物设计学	姜凤超	978-7-5067-7885-5
27	生物技术制药	冯美卿	978-7-5067-7886-2
28	波谱解析技术的应用	冯卫生	978-7-5067-7887-9
29	药学服务实务	许杜娟	978-7-5067-7888-6

注：29 门主干教材均配套有中国医药科技出版社“爱慕课”在线学习平台。

全国普通高等医学院校药学类专业“十三五”规划教材 配套教材书目

序号	教材名称	主编	ISBN
1	物理化学实验指导	高 静 马丽英	978-7-5067-8006-3
2	分析化学实验指导	高金波 吴 红	978-7-5067-7933-3
3	生物化学实验指导	杨 红	978-7-5067-7929-6
4	药理学实验指导	周 红 魏敏杰	978-7-5067-7931-9
5	药物化学实验指导	李柱来 孟繁浩	978-7-5067-7928-9
6	药物分析实验指导	张振秋 马 宁	978-7-5067-7927-2
7	仪器分析实验指导	余邦良	978-7-5067-7932-6
8	生药学实验指导	张东方 税丕先	978-7-5067-7930-2
9	药剂学实验指导	孟胜男 胡容峰	978-7-5067-7934-0

前言

PREFACE

生物药剂学与药物动力学是近年来发展迅速的药学分支学科,自2000年开始作为药学类专业的主干课程开设。生物药剂学主要研究药物体内过程、影响因素及其与药物效应的关系;药物动力学主要研究药物体内药量与血药浓度的经时变化规律。生物药剂学与药物动力学密切关联,共同揭示药物的体内过程及动态变化规律,其研究内容和方法对新药研发、剂型设计、药物质量评价和临床合理用药等都有重要的作用和意义。

本教材编写的指导思想是满足全国普通高等医学院校药学类专业应用型专门人才培养的需求。在介绍理论知识的同时,还设置了学习导引、实例分析、知识链接、知识拓展、本章小结、练习题等模块,以更好地服务于教学;内容与最新国家药品标准与法规及药学类专业资格考试等相对接,着重于基本概念、基本理论的理解与应用,精简了冗长的数学公式推导,注重理论知识与临床合理用药和新药开发实践的结合,引入合理用药和药物研发案例,强化学生职业能力和创新能力的培养,更好地适应医药事业发展的需要。

本教材系统介绍了生物药剂学与药物动力学的基本概念、基本理论及其应用。全书共十四章,第一至第六章介绍了生物药剂学的基本概念、基本理论及进展,重点讨论了药物吸收、分布、代谢、排泄过程的规律,以及药物因素、生物因素对体内过程及临床效应的影响;第七至第十四章介绍了药物动力学基本概念、基本理论及进展,重点阐述了体内药量与血药浓度的经时变化规律、药动学参数的求算以及药物动力学在新药研发与合理用药中的应用。第一章由张淑秋编写,第二章由丁劲松编写,第三章由储晓琴编写,第四章由刘中秋编写,第五章由张丽锋编写,第六章由赵领编写,第七章由王建新编写,第八章由刘晓娟编写,第九章由王玮编写,第十章由丁志英编写,第十一章由刘明妍编写,第十二章由郭新红编写,第十三章由宋逍编写,第十四章由王凌编写。本教材主要供医学院校药学类相关专业本科生使用,也可作为药学类专业研究生、药师、执业药师、临床医师及医药生产与科研单位专业技术人员的参考书。

本教材配套有中国医药科技出版社“爱慕课”在线学习平台,含数字教材、教学课件、图片、视频、大量练习题等,使教学资源更加丰富和多样化、立体化,可供广

大师生免费使用。作者在本教材编写过程中，得到了出版社及各参编单位的大力支持，参考了已出版的有关教材和著作；山西医科大学张丽锋、王锐利、杨帆、张国顺、任国莲等老师，湖南科技大学谷慧老师等做了大量修订及统稿工作；在此一并表示感谢。限于编写时间和编者水平，书中难免存在疏漏和不足之处，敬请读者提出宝贵意见和建议。

编者
2015年10月

目录

CONTENTS

第一章 生物药剂学概述	1
一、生物药剂学的基本概念	1
二、生物药剂学的研究内容	3
三、生物药剂学的作用及其与相关学科的关系	4
四、生物药剂学的发展	5
第二章 口服药物的吸收	10
第一节 药物的胃肠道吸收与膜转运	10
一、胃肠道的解剖学特征与功能	10
二、生物膜的结构与性质	12
三、药物转运机制	14
四、药物转运体	16
第二节 影响药物吸收的生理因素	19
一、消化系统因素	20
二、循环系统因素	22
三、疾病因素	23
第三节 影响药物吸收的药物因素和剂型因素	24
一、药物的理化性质	24
二、剂型种类	32
三、制剂处方	34
四、药物间及药物与辅料间的相互作用	36
五、制剂工艺	37
第四节 口服药物吸收与制剂设计	39
一、生物药剂学分类系统	39
二、生物药剂学分类系统与口服药物制剂设计	42
三、生物药剂学分类系统的其他应用	46

第五节 口服药物吸收的评价方法	48
一、制剂学评价方法	48
二、生物学评价方法	50
第三章 非口服药物的吸收	54
第一节 注射给药	54
一、给药部位与吸收途径	54
二、影响注射给药吸收的因素	55
第二节 皮肤给药	57
一、皮肤的结构与药物的吸收途径	57
二、影响药物经皮渗透的因素	59
第三节 口腔黏膜给药	61
一、口腔黏膜的结构与药物的吸收途径	61
二、影响口腔黏膜吸收的因素	62
第四节 鼻黏膜给药	64
一、鼻腔的结构与药物的吸收途径	65
二、影响鼻黏膜吸收的因素	65
第五节 肺部给药	67
一、呼吸系统的结构与药物的吸收途径	67
二、影响肺部药物吸收的因素	68
第六节 直肠与阴道给药	70
一、直肠部位的药物吸收途径与影响吸收的因素	70
二、阴道部位的药物吸收途径与影响吸收的因素	71
第七节 眼部给药	72
一、眼的结构与药物的吸收途径	72
二、影响眼部吸收的因素	73
第四章 药物分布	74
第一节 药物的组织分布	74
一、药物与血浆蛋白结合	74
二、药物分布的临床意义	80
三、表观分布容积	81
四、影响分布的因素	82
第二节 药物的淋巴系统转运	85

一、淋巴循环与淋巴管的构造	86
二、药物向淋巴系统的转运	87
第三节 药物的脑内转运与血脑屏障	88
一、血脑屏障	88
二、药物的脑内转运机制及影响因素	89
三、提高药物脑内分布的意义与方法	90
第四节 药物的胎儿内分布与血胎屏障	91
一、血胎屏障	91
二、药物的血胎转运机制及影响因素	92
三、胎儿内的药物分布	92
第五节 药物的体内分布与新型给药系统设计	93
一、微粒型靶向给药系统的体内分布	93
二、影响微粒型靶向给药系统体内分布的因素	94
三、靶向给药系统的设计	95
第五章 药物代谢	98
第一节 概 述	98
一、药物代谢的概念	98
二、药物代谢与药理作用	98
三、药物代谢的部位与首过效应	100
第二节 药物代谢酶与代谢反应	101
一、氧化酶与氧化代谢反应	101
二、还原酶与还原代谢反应	105
三、水解酶与水解代谢反应	105
四、转移酶与结合代谢反应	106
第三节 影响药物代谢的因素	108
一、生物因素	109
二、药物因素	113
第四节 药物代谢在临床用药与药物研究中的应用	117
一、药物代谢与合理用药	117
二、药物代谢与剂型设计	120
三、药物代谢与前体药物设计	121
四、药物代谢与药物筛选	122
五、药物代谢研究方法与技术	122

第六章 药物排泄	127
第一节 药物的肾排泄及影响因素	128
一、肾小球的滤过	128
二、肾小管主动分泌	129
三、肾小管重吸收	129
四、肾清除率	130
五、影响肾排泄的因素	131
第二节 药物的胆汁排泄及影响因素	135
一、药物胆汁清除率	136
二、药物胆汁排泄机制	136
三、影响药物胆汁排泄的因素	136
四、肠肝循环	137
五、研究药物胆汁排泄的方法	139
第三节 药物的其他排泄途径	139
一、乳汁排泄	139
二、唾液排泄	140
三、肠道排泄	141
四、肺排泄	141
五、汗腺和毛发排泄	141
第七章 药物动力学概述	144
第一节 药物动力学的概念及其发展	144
一、药物动力学的概念	144
二、药物动力学的发展	145
第二节 药物动力学的研究内容及与相关学科的关系	147
一、药物动力学的研究内容	147
二、药物动力学与相关学科的关系	147
第三节 隔室模型和体内转运的速率过程	149
一、隔室模型	149
二、药物体内转运的速率过程	151
第四节 药物动力学基本参数	152
一、速率常数	152
二、半衰期	152
三、血药浓度与药-时曲线	152
四、药-时曲线下面积	153
五、血药峰浓度和达峰时间	153

六、表观分布容积	154
七、清除率	154
第八章 单室模型	156
第一节 静脉注射给药	157
一、血药浓度法	157
二、尿药排泄数据法	163
第二节 静脉滴注给药	171
一、血药浓度 - 时间方程	171
二、药物动力学参数计算	174
三、负荷剂量	176
第三节 血管外给药	180
一、血药浓度法	180
二、尿药排泄数据	193
三、体内外相关性评价	201
第九章 多室模型	206
第一节 二室模型静脉注射给药	207
一、模型的建立	207
二、血药浓度 - 时间关系	208
三、参数的估算	208
第二节 二室模型静脉滴注给药	212
一、模型的建立	212
二、血药浓度 - 时间关系	213
三、参数的估算	214
第三节 二室模型血管外给药	214
一、模型的建立	214
二、血药浓度 - 时间关系	215
三、二室模型血管外给药的参数估算	216
四、Loo - Riegelman 法测定吸收百分数	220
第四节 三室模型静脉注射给药	220
一、模型的建立	220
二、血药浓度 - 时间关系	221
第五节 隔室模型的判别	222
一、作图判断	222

二、用残差平方和与加权残差平方和判断	222
三、用拟合度 (r^2) 进行判断	223
四、AIC 法	223
五、 F 检验	223
第十章 多剂量给药	228
第一节 多剂量静脉注射给药	229
一、单室模型多剂量静脉注射给药血药浓度 - 时间关系	229
二、双室模型多剂量静脉注射给药血药浓度 - 时间关系	234
第二节 单室模型多剂量间歇静脉滴注	234
一、间歇静脉滴注给药的特点及血药浓度	234
二、稳态血药浓度 - 时间关系	236
三、稳态最大血药浓度与最小血药浓度	237
第三节 多剂量血管外给药	238
一、单室模型多剂量血管外给药血药浓度 - 时间关系式	238
二、双室模型多剂量血管外给药血药浓度 - 时间关系式	240
第四节 平均稳态血药浓度	240
一、单室模型多剂量给药平均稳态血药浓度	240
二、双室模型多剂量给药平均稳态血药浓度	242
第五节 多剂量给药的负荷剂量	243
一、单室模型负荷剂量	243
二、双室模型负荷剂量	245
第六节 多剂量给药蓄积和血药浓度波动	245
一、单室模型多剂量给药蓄积	245
二、单室模型多剂量给药血药浓度波动程度	247
第十一章 统计矩原理在药物动力学中的应用	252
第一节 基本概念	253
一、零阶矩	253
二、一阶矩	254
三、平均滞留时间	254
第二节 矩量法估算药物动力学参数	256
一、生物半衰期	256
二、清除率	256
三、稳态表观分布容积	257

四、生物利用度	257
五、平均稳态血药浓度的预测	257
第三节 矩量法研究药物体内过程	259
一、释放动力学	259
二、吸收动力学	260
第十二章 非线性药物动力学	263
第一节 非线性药物动力学的机制	264
一、吸收过程载体饱和	264
二、分布过程蛋白结合饱和	265
三、代谢过程代谢酶的饱和及酶抑制与酶诱导作用	265
四、排泄过程载体饱和	266
第二节 非线性消除药物动力学	267
一、特点	267
二、静脉注射给药的药物动力学方程	268
三、非线性药物动力学参数的估算	273
第三节 非线性药物动力学的识别	275
一、药物消除过程的非线性识别	276
二、药物吸收过程的非线性识别	276
三、药物分布过程的非线性识别	277
第十三章 药物动力学在新药研究中的应用	279
第一节 新药药物动力学研究	279
一、新药非临床的药物动力学研究	279
二、新药临床的药物动力学研究 (I 期)	282
第二节 生物利用度研究与生物等效性评价	285
一、基本概念	285
二、研究的目的和意义	286
三、基本要求和研究方法	286
四、生物等效性统计分析	290
第三节 缓释、控释及迟释制剂的药物动力学	293
一、研究特点和设计要求	293
二、体内动力学过程	294
三、体内外质量评价	294

第十四章 药物动力学的临床应用	303
第一节 临床给药方案的设计	303
一、血药浓度与药物效应的关系	303
二、影响血药浓度的因素	304
三、给药方案设计的基本要求	305
四、临床给药方案设计的基本方法	306
第二节 特殊人群的药物动力学与临床用药	311
一、老年人的药物动力学与临床用药	311
二、儿童的药物动力学与临床用药	312
三、孕期与哺乳期妇女的药物动力学与临床用药	313
第三节 疾病状态下的药物动力学与临床用药	315
一、肝脏疾病状态下的药物动力学与临床用药	315
二、肾脏疾病状态下的药物动力学与临床用药	315
三、其他疾病状态下的药物动力学与临床用药	319
第四节 治疗药物监测与个体化用药	321
一、治疗药物监测及其意义	321
二、治疗药物监测的指征	322
三、治疗药物监测的流程	323
四、常见监测药物举例	323
附录一 药物动力学符号注释	328
附录二 拉普拉斯变换	330
参考文献	332