

执业助理医师《药理学》辅导：首关消除 PDF转换可能丢失  
图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/16/2021\\_2022\\_\\_E6\\_89\\_A7\\_E4\\_B8\\_9A\\_E5\\_8A\\_A9\\_E7\\_c22\\_16557.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/16/2021_2022__E6_89_A7_E4_B8_9A_E5_8A_A9_E7_c22_16557.htm)

口服药物吸收后经门静脉进入肝脏，有些药物首次进入肝脏就被肝药酶代谢，进入体循环的药量减少，称为首关消除（first pass elimination）。经过肝脏首关消除过程后，进入体循环的药量与实际给药量的相对量和速度，称生物利用度。有的药物在被吸收进入肠壁细胞内而被代谢一部分也属首关消除。首关消除也称首关代谢（first pass metabolism）或首关效应（first pass effect）。以普萘洛尔为例，口服普萘洛尔后胃肠道吸收较完全（90%），1~1.5小时血药浓度达峰值，但进入全身循环前即有大量被肝代谢而失活，生物利用度为30%。血浆蛋白结合率约93%。硝酸甘油口服后首关消除高达92%，其生物利用度仅为8%。而卡马西平口服吸收缓慢，主要在肝脏代谢，其代谢产物10、11-环氧化卡马西平的药理活性与原形药相似，其在血浆和脑内的浓度可达原形药的50%。生物利用度在58~85%之间。迅速分布至全身组织，血浆蛋白结合率约76%。单次给药时 $T_{1/2}$ 为25~65小时，长期服用诱发自身代谢， $T_{1/2}$ 降为10~20小时。因其在肝脏的代谢产物与原形药的药理活性相似，故其首关消除不明显。故采用静脉给药、吸入给药、舌下给药、直肠给药、皮下注射可避免药物的首关消除。转贴于：[100Test](http://www.100test.com) 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)