

药剂学重点总结(十五) PDF转换可能丢失图片或格式，建议
阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E5_89_82_E5_AD_A6_E9_c23_17505.htm 第15章 生物药剂学 一

、概述 (一) 生物药剂学的概念 生物药剂学

(Biopharmaceutics)是研究药物及其剂型在体内的吸收、分布、代谢与排泄过程，阐明药物的剂型因素、机体的生物因素与药效（包括疗效、副作用和毒性）之间关系的一门药剂学分支学科，从20世纪60年代开始已经得到了深入的发展，为客观评价制剂的处方设计、质控方法和生产工艺以及临床合理用药提供了科学的依据。生物药剂学中研究的剂型因素，不仅是指片剂、注射剂、软膏剂等狭义的剂型，而是广义地包括与剂型有关的各种因素，主要有： 药物的某些化学性质 药物的某些物理性质 药物制剂的处方组成 药物的剂型及用药方法 药物的剂型及用药方法 制剂的工艺过程 生物药剂学中的生物因素包括： 种族差异； 性别差异； 年龄差异； 遗传差异； 生理与病理条件的差异 (二) 生物膜的结构 体内具有吸收功能的主要组织为上皮组织，它是由上皮细胞组成的，上皮细胞膜是一种生物膜，其构造和性质决定药物吸收的难易程度。在生物膜内，蛋白质与类脂质（主要是磷脂）呈聚集状态，类脂质构成双分子层。(三) 药物通过生物膜的转运机理 1.被动扩散 (passive diffusion) 被动扩散的特点是：从高浓度区（吸收部位）向低浓度区域（血液）顺浓度梯度转运，转运速度与膜两侧的浓度差成正比。扩散过程不需要载体，也不消耗能量，故也称为单纯扩散。膜对通过的物质无特殊选择性，即无饱和现象和竞争抑制现

象，一般也无部位特异性。药物大多数以这种方式吸收。被动扩散有二条途径：溶解扩散；限制扩散。

2.主动转运 (active transport)

一些生命必需物质（如K⁺，Na⁺，I⁻，单糖，氨基酸，水溶性维生素）和有机酸、碱等弱电解质的离子型等。主动转运有如下特点：逆浓度梯度转运；需要消耗机体能量，能量的来源主要由细胞代谢产生的ATP提供；主动转运药物的吸收速度与载体数量有关，可出现饱和现象；可与结构类似的物质发生竞争现象；受代谢抑制剂的影响，主动转运有结构特异性，如单糖、氨基酸、嘧啶及某些维生素都有本身独立的主动转运特性；主动转运还有部位特异性。

3.促进扩散 (facilitated diffusion)

促进扩散又称中介转运 (mediated transport)或易化扩散，由膜的高浓度一侧向低浓度一侧扩散或转运的过程。促进扩散具有载体转运的各种特征：有饱和现象，与被动扩散不同之处在于：促进扩散不消耗能量，而且是顺浓度梯度转运，转运的速率大大超过被动扩散。

4.胞饮作用

胞饮作用是细胞摄取药物的另一种形式，主动变形而将某些物质摄入细胞内或从细胞内释放到细胞外，称为胞饮。某些高分子物质，如蛋白质、多肽类、脂溶性维生素和重金属等，可按胞饮方式吸收。

二、药物的胃肠道吸收及其影响因素

(一) 药物在胃肠道的吸收

吸收 (absorption)是指药物从给药部位进入体循环的过程。（例如静脉注射给药）不涉及吸收过程以外，非血管内给药等都存在吸收过程。药物在胃中的吸收机制主要是被动扩散。小肠中药物的吸收以被动扩散为主。是直肠给药（如栓剂）的良好吸收部位。大肠中药物的吸收也以被动扩散为主。

(二) 影响药物在胃肠道吸收的生理因素

1.胃肠液成分与性质对吸

收的影响 胃液pH变化，可使弱酸性药物在胃中吸收发生变化。药物吸收部位的pH值对很多药物，特别是有机弱酸或弱碱类药物的吸收至关重要。大多数有机药物都是弱酸性或弱碱性物质，消化道中的不同pH或其变化，都会影响药物的解离状态，从而影响药物制剂的吸收和生物利用度。主动转运吸收的药物是在特定部位由载体或酶促系统进行的，一般不受消化道pH变化的影响。胆汁中的胆酸盐对难溶性药物有增溶作用，可促进吸收，但与新霉素和卡那霉素等生成不溶性物质而影响吸收。

2.胃排空对吸收的影响

(1)胃排空速率

胃排空速率表观为一级速度过程：影响胃排空速率的因素很多，与内容物的物理性状和化学组成有关。黏度低，渗透压低时，一般胃排空速率较大；稀的软体食物比稠的或固体食物的胃排空快；服用某些抗胆碱药物、抗组织胺药物、麻醉药物时，胃排空速率都可下降。胃排空的快慢，对药物消化道中的吸收有一定影响。由于大多数药物在小肠中吸收好，胃排空加快，药物到达小肠部位时间缩短，吸收快，生物利用度提高，出现药效时间也快。少数主动吸收药物如核黄素等在十二指肠由载体转运吸收，胃排空速率快，大量的核黄素同时到达吸收部位，吸收达到饱和，因而只有一小部分药物被吸收；若饭后服用，胃排空速率小，使吸收量增加。

3.胃肠道蠕动对吸收的

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com