

药剂学重点总结(十六) 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_17506.htm 第16章 药物动力学 第一节 概述 一、药物动力学的概念 药物动力学

(Pharmacokinetics) 是研究药物体内药量随时间变化规律的科学。药物动力学对指导新药设计，优化给药方案，改进剂型，提供高效、速效（或缓释）、低毒（或低副作用）的药物制剂，已经发挥了重大作用。二、血药浓度与药理作用的关系 因为大多数药物的血药浓度与药理效应间呈平行关系，所以研究血药浓度的变化规律对了解药理作用强度的变化极为重要，这是药物动力学研究的中心问题。三、几个重要的基本概念（一）隔室模型 药物的体内过程一般包括吸收、分布、代谢（生物转化）和排泄过程。为了定量地研究药物在上述过程中的变化情况，用数学方法模拟药物体内过程而建立起来的数学模型，称为药物动力学模型。药物在体内的转运可看成是药物在隔室间的转运，这种理论称为隔室模型理论。隔室的概念比较抽象，无生理学和解剖学的意义。但隔室的划分也不是随意的，而是根据组织、器官、血液供应多数和药物分布转运速度的快慢而确定的。1.单隔室模型 即药物进入体循环后，迅速地分布于各个组织、器官和体液中，并立即达到分布上的动态平衡，成为动力学上的所谓“均一”状态，因而称为单隔室模型或单室模型。2.二隔室模型 二隔室模型是把机体看成药物分布速度不同的两个单元组成的体系，一个单元称为中央室，另一个单元称为周边室。中央室是由血液和血流非常丰富的组织、器官等所组成，药物在血

液与这些组织间的分布速度达到分布上的平衡；周边室（外室）是由血液供应不丰富的组织、器官等组成，体内药物向这些组织的分布较慢，需要较长时间才能达到分布上的平衡。

3. 多隔室模型 二隔室以上的模型叫多隔室模型，它把机体看成药物流布速度不同的多个单元组成的体系。

（二）消除速度常数 消除是指体内药物不可逆失去的过程，它主要包括代谢和排泄。其速度与药量之间的比例常数 K 称为表观一级消除速度常数，简称消除速度常数，其单位为时间的倒数， K 值大小可衡量药物从体内消除的快与慢。药物从体内消除途径有：肝脏代谢、肾脏排泄、胆汁排泄及肺部呼吸排泄等，所以药物消除速度常数 K 等于各代谢和排泄过程的速度常数之和，即： $K=K_b+K_e+K_{bi}+K_{lu}+\dots$ 消除速度常数具有加和性，所以可根据各个途径的速度常数与 K 的比值，求得各个途径消除药物的分数。

（三）生物半衰期 生物半衰期（Half-life time）简称半衰期，即体内药量或血药浓度下降一半所需要的时间，以 $t_{1/2}$ 表示，单位为时间。药物的生物半衰期与消除速度常数之间的关系为：因此， $t_{1/2}$ 也是衡量药物消除速度快慢的重要参数之一。药物的生物半衰期长，表示它在体内消除慢、滞留时间长。一般地说，正常人的药物半衰期基本上相似，如果药物的生物半衰期有改变，表明该个体的消除器官功能有变化。例如肾功能、肝功能低下的患者，其药物的生物半衰期会明显延长。测定药物的生物半衰期，特别是确定多剂量给药间隔以及肝肾器官病变时给药方案调整都有较高的应用价值。根据半衰期的长短，一般可将药物分为： $t_{1/2}>24$ 小时，称为极长半衰期药物。

（四）清除率 整个机体（或机体内某些消除器官、组织）的药物消除率，是

指机体（或机体内某些消除器官、组织）在单位时间内消除掉相当于多少体积的流经血液中的药物。 $Cl = (-dX-dt)/C = KV$ 从这个公式可知，机体（或消除器官）药物的清除率是消除速度常数与分布容积的乘积，所以清除率Cl这个参数综合包括了速度与容积两种要素。同时它又具有明确的生理学意义。

2. 单室模型静脉注射给药 一、血药浓度法进行药物动力学分析（一）药物动力学模型的建立 静脉注射给药后，由于药物的体内过程只有消除，而消除过程是按一级速度过程进行的，所以药物消除速度与体内药量的一次方成正比。

$dX/dt = -KX$ 将式16-4积分 $X = X_0 e^{-Kt}$ $\log X = (-K/2.303)t + \log X_0$ 单室单剂量静脉注射给药后体内药量随时间变化的关系式， $\log C = (-K/2.303)t + \log C_0$ 由此可求得K值，再由式（16-2）求得生物半衰期（亦称为消除半衰期） $t_{1/2} = 0.693/K$ ； 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