

执业药师《药理学》辅导：生物利用度 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E6_89_A7_E4_B8_9A_E8_8D_AF_E5_c23_18917.htm 生物利用度是指活性成分（药物或代谢物）进入体循环的分量和速度，从而得以使活性成分进入作用部位。虽然某药物可完全被吸收，但吸收的速率仍至关重要。吸收速率太慢就不能在一定时间内到达治疗所需的血药浓度，吸收太快每剂用药后又由于药物浓度高而产生毒性。低生物利用度的原因 如果一个药物能迅速溶解并容易穿透细胞膜，则吸收趋向于完全，但口服给药时吸收常不完全。药物在到达腔静脉之前必先沿着胃肠道向下移动并通过肠壁和肝脏，而这些脏器恰恰是药物代谢的常见部位（参见第43节）；这样，药物在进入体循环可测量部位之前即可能被代谢（首过代谢）。许多药物呈低的生物利用度是由于存在强的首过代谢。这些组织对这些药物（如异丙肾上腺素，去甲肾上腺素，睾酮）的代谢很完全以至它们的生物利用度实际上为零。对于那些生成活性代谢物的药物来讲，经过首过代谢的治疗上的重要性取决于药物和代谢物所引起的期望的和非期望的效应。低生物利用度最常见于难溶于水的，吸收缓慢的药物所制成的口服剂型。吸收缓慢和不完全的与吸收迅速而完全的药物相比前者则有更多的因素影响其生物利用度，因而吸收缓慢或不完全常可导致治疗学效应的差异。药物在胃肠道内停留时间不充分是低生物利用度的常见原因。摄入的药物在整个消化道停留的时间不多于1~2天，而在小肠的时间仅2~4小时，如果药物溶解不迅速或不能穿透上皮细胞膜（如药物高度解离和极性很强），则可

能在吸收部位停留时间不充分，在这种情况下，不仅引起低生物利用度，而且导致高度变异。年龄，性别，活动情况，遗传表型，应激，疾病（如胃酸缺乏，营养不良综合征）或以前曾进行过胃肠手术等均可影响药物的生物利用度。

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