

2007年药理学考点详解第三章 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/243/2021_2022_2007_E5_B9_B4_E8_8D_AF_c23_243132.htm 第三章 药动学 考点进阶详解

一、药物的转运药物的跨膜转运的方式主要有：被动转运、载体转运。

(一) 药物的被动转运指药物依赖于膜两侧的浓度差，从高浓度的一侧向低浓度的一侧进行跨膜转运。特点是不需消耗ATP，只能顺浓差转运，无饱和现象。多数药物属于被动转运。包括：

- 1.简单扩散 又称脂溶性扩散，脂溶性药物可溶于脂质而通过细胞膜。药物解离度对简单扩散影响很大。解离型极性大，脂溶性小，难以扩散；非解离型极性小，脂溶性大，容易扩散。非解离型药物的多少，取决于药物的解离常数 (K_a) 和体液的pH值。弱酸性药物 $pK_a = \text{pH} - \log \frac{[A^-]}{[HA]}$ 弱碱性药物 $pK_a = \text{pH} - \log \frac{[B]}{[BH^+]}$ / [B] pK_a ：弱酸性或弱碱性药物在50%解离时溶液的pH值。弱酸性药物在酸性环境中不易解离，在碱性环境中易解离。弱碱性药物则相反。
- 2.滤过又称水溶扩散，是指直径小于膜孔径的水溶性的极性或非极性药物，借助膜两侧的流体静压和渗透压差被水携带到低压侧的过程。如药物经肾小球的滤过。

(二) 药物的载体转运

- 1.主动转运是药物借助于特殊的载体并需消耗能量的跨膜运动，可逆浓度差转运，有饱和性、竞争抑制性。如药物自肾小管的分泌性排泄。
- 2.易化扩散是借助于膜内特殊的载体的一种转运方式，不需耗能，但不能逆浓度差，有特异性和竞争抑制性。

二、药物的体内过程

(一) 药物的吸收

- 1.药物的吸收 是指药物经血管外给药后，自用药部位进入血液循环的过程。静脉注射无吸收

过程。2.影响因素 (1) 药物因素：药物的理化性质、剂型和给药途径。(2) 机体因素：胃肠道pH值、胃排空和肠蠕动性、吸收面积的大小、吸收部位的血流灌注情况等。3.不同途径吸收快慢顺序依次为：腹腔注射>吸入>舌下>直肠>肌肉注射>皮下注射>口服>皮肤。4.临床常用的给药途径可分为四类：消化道给药；注射给药；吸入给药；经皮给药。5.首关消除 有些药物在进入体循环之前，首先在胃肠道或肝脏被灭活（被肠液或肠菌酶破坏，或肝药酶代谢等），即被代谢，使进入体循环的实际药量减少，称之为首关消除。硝酸甘油、普萘洛尔、利多卡因、丙咪嗪、吗啡、维拉帕米、氯丙嗪、异丙肾上腺素、甲基睾丸素、乙酰水杨酸、喷他佐辛、哌替啶、可乐定、哌醋甲酯等具有明显的首关消除。(二) 药物的分布1.药物的分布进入血液循环的药向不同部位转移的过程。2.决定药物在体内分布的因素(1) 体液pH：生理情况下细胞内液pH约7.0，细胞外液pH约7.4.弱酸性药物在较碱的细胞外液中解离增多，易自细胞内向细胞外转运；弱碱性药物则相反。(2) 药物与血浆蛋白的结合率：为可逆性疏松结合，结合型药物分子量增大，不能跨膜转运、代谢和排泄，并暂时失去药理活性，某些药物可在血浆蛋白结合部位上发生竞争排挤现象。药物分子与血浆蛋白结合的特点（和药物与受体蛋白结合情况相似）：具有饱和性与可逆性、结合型药物无活性、有竞争置换现象。(3) 生理屏障 血脑屏障：是血脑之间一种选择性阻止各种物质由血入脑的屏障，由血—脑、血脑脊液及脑脊液—脑三种屏障的总称，这些隔膜的细胞间紧密连接，比一般的隔膜多一层胶质细胞，因此外源性药物不易通过。分子量

大，极性较高的药物不能通过血脑屏障。 胎盘屏障：是胎盘绒毛与子宫血窦间的屏障，其通透性与一般生物膜无明显的差别。 妊娠期间禁用可通过此屏障引起胎儿不良反应的药物。 转贴于：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