

2007年执业药师考试考点汇总与解析-药理学-药物动力学 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/263/2021_2022__EF_BC_92_EF_BC_90_EF_BC_90_EF_c23_263767.htm 第3章 药物动力学

考点1：药物的被动转运被动转运是指药物从高浓度的一侧向低浓度的一侧转运的一种方式，其主要的动力就是膜两侧的浓度差，因此当膜两侧的浓度相等时，转运即达到动态平衡。其特点就是不需耗能，且无饱和现象。大多数药物在体内的转运是按这种方式进行的。被动转运又可分为简单扩散和滤过两种。

1. 简单扩散简单扩散的扩散速度既与药物的理化性质（如分子量、极性、脂溶性和解离度等）有关，也与膜的性质、面积及膜两侧的浓度梯度有关。由于多数药物是弱电解质，在体液中可部分解离，一部分药物为解离型的，另一部分药物为非解离型的。解离型药物的极性比非解离型药物大，而非解离型药物的脂溶性比解离型药物高，因此非解离型药物易于跨膜扩散，这是由生物膜的类型所决定的。一种药物在体液中的解离程度取决于其自身的解离常数 pK_a 及其所在环境的 pH 。这三者之间的关系，可按Handerson-Hasselbalch公式说明。式中 K_a 为解离常数， pK_a 是其负对数值。由上式可见，无论弱酸性还是弱碱性药物，其 pK_a 值为该药在溶液中50%解离的 pH 值， pK_a 值是各药物所固有的特性。药物 pK_a 值与药物属于弱酸性或弱碱性无关，弱酸性药物 pK_a 值可大于7，弱碱性药物 pK_a 值可小于7。改变环境的 pH 值可以影响弱酸性药物或弱碱性药物的跨膜转运，弱酸性药物在 pH 低的环境中解离度小，容易跨膜转运，因此，在酸性胃液中可被吸收，在酸化尿液中也易被吸收；弱碱性

药物在碱性肠液中不易解离，主要在小肠吸收，碱化尿液可以增加其在肾小管的再吸收，使其肾排泄减慢，而酸化尿液则可以使其肾排泄加速。2. 滤过滤过是指粒径小于膜孔的药物借助于膜两侧的流体静压或渗透压差，由高压侧向低压侧的转运过程。如药物经肾小球的滤过。 考点2：药物的载体转运

1. 主动转运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，其特点就是不依赖于膜两侧浓度差，药物可以从低浓度的一侧向高浓度一侧转运，这一过程需要特殊的载体，且需消耗能量，转运的过程有饱和现象和竞争性抑制。如药物自肾小管的分泌性排泄就属于主动转运。2. 易化扩散易化扩散是借助膜内特殊载体的一种转运方式，其特点是不需要能量，但不能逆浓度差转运，且有较高的特异性，并有竞争抑制现象。如葡萄糖和氨基酸就是通过这种方式转运的。 考点3：药物的吸收

1. 药物的吸收药物的吸收是指药物经血管外给药后，自给药部位向血液循环的转运过程。2. 影响因素药物的吸收速度和程度会影响药物作用的起效快慢和作用强弱。在药物的吸收过程中会受到许多因素的影响，可以把这些因素归结为以下两大类：

(1) 药物因素：包括药物的理化性质、剂型（药物的溶解度和溶出速度）和给药的途径等，其中给药途径是影响吸收速度的重要因素之一。临床不同给药途径，对药物的吸收有很大影响，可以对药物的作用和毒性产生明显的影响。(2) 机体的因素：包括胃肠道的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，这些因素均可对药物的吸收产生直接或间接的影响。3. 药物吸收快慢一般来说，其吸收速度按快慢排序依次为：腹腔注射 > 吸入 > 舌下 >

直肠 > 肌肉注射 > 皮下注射 > 口服 > 皮肤。就吸收程度而言，舌下、肌肉注射、吸入、皮下注射和直肠吸收较为完全，口服给药次之。

4. 临床常用的给药途径

(1) 胃肠道给药。

口服给药是最常用的胃肠道给药途径，其特点是用药较安全、方便和经济，但吸收缓慢且影响因素较多，常会改变药物吸收速率和程度。口服给药后，药物通过胃肠黏膜中的毛细血管进入血液循环。其中肠道是药物的主要吸收部位，这是由于肠道黏膜吸收面大，肠蠕动快且肠液丰富，药物在其中的溶解性好，而且肠道血流丰富等因素所致。药物经胃肠道吸收后，首先随血流经门静脉进入肝脏，然后进入全身血液循环。有些药物在进入体循环之前，首先在胃肠道或肝脏被灭活，即被代谢，使进入体循环的实际药量减少，称之为首关消除。采用舌下和直肠给药不经过门静脉，可避免肝脏的首关消除。遇到下列情形时不宜采用口服给药：

- 对胃肠道刺激大或首关消除较强的药物；
- 病人昏迷不醒或不能吞咽；
- 有些药物不易在胃肠道吸收或在胃肠道的酸、碱环境中易被破坏；
- 某些药物必须注射给药方能达到预期的疗效，如口服硫酸镁只能引起腹泻，如需解痉和镇静必须注射给药。

(2) 注射给药。

注射给药也是临床常用的给药方式之一，其中静注给药后，药物直接进入体循环，没有吸收过程。肌肉和皮下注射给药后，药物经毛细血管进入血液循环，吸收一般较口服快，但有些药物的局部刺激性较大，不宜注射给药。药物吸收速率与药物的水溶性和注射部位的局部血流有关。注射给药的特点是吸收迅速而完全，但用药不方便且费用较高，适用于危急、昏迷而不能口服的病人。

(3) 吸入给药。

药物直接由肺部吸收进入体循环，肺部具有肺泡表面积

大且血流非常丰富的特点，一些挥发性的药物如乙醚和氟烷等可以通过吸入的方式由肺部迅速吸收。其特点是吸收迅速，但剂量难以掌握。有些固体和液体药物的气雾颗粒较小（直径 $< 5 \mu\text{m}$ ），可以通过吸入的方式由肺部吸收而产生全身作用。较大气雾颗粒只能用于局部治疗，如鼻咽部抗菌消炎、鼻塞等。适用于挥发性或气体药物，如吸入性全身麻醉药。

（4）经皮给药。通过皮肤吸收药物到达局部或全身而产生药效。完整的皮肤除少数脂溶性较大药物可以吸收外，多数药物无法经皮吸收。经皮给药的特点是吸收缓慢且不规则，因而不易控制剂量。

5．首关消除有些药物在进入人体循环之前，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、乙酰水杨酯、喷他佐辛、派替啶、可乐定、哌醋甲酯等具有明显的首关消除。

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