

基础精讲班

药 学 专 业 知 识 （ 一 ）

国 家 执 业 药 师 资 格 考 试

主讲老师：姜 雅

2019

» 第六章 生物药剂学

2015 $3A+7B+2X=12$

2016 $4A+5B=9$

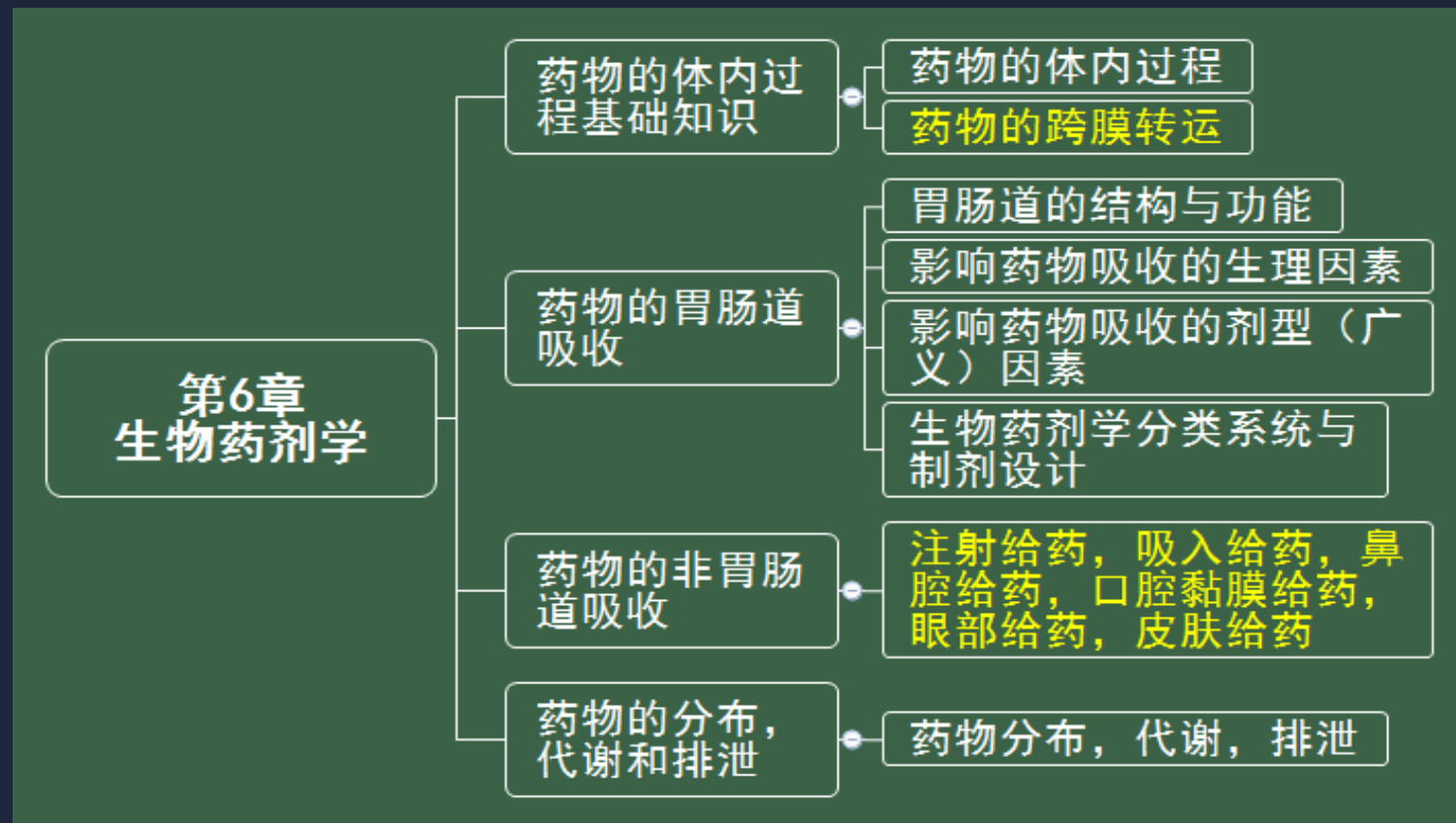
2017 $2A+5B=7$

2018 $1A+8B=9$

2019

5072

第六章 生物药剂学



➤ 第一节 药物体内过程基础知识

1、药物从吸收到消除的过程	药物吸收、分布、代谢、排泄、转运、处置、消除的定义和意义	2016B (2)
2、药物的跨膜转运	生物膜的结构与性质 药物的转运方式（被动转运、载体介导转运和膜动转运）	2015B (3), 2016B (3), 2017B (2)

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

一、药物的体内过程 2016B(2)

吸收	是药物从给药部位进入体循环的过程。决定药物进入体循环的速度与量。
分布	进入体循环后向各组织、器官或者体液转运的过程。关系药物是否能及时到达与疾病相关的组织和器官。
代谢	药物在吸收过程或进入体循环后，受体内酶系统的作用结构发生转变的过程。
排泄	药物及其代谢产物排出体外的过程。
转运：吸收+分布+排泄过程。 处置：分布+代谢+排泄过程。 消除：代谢+排泄，关系到药物在体内存在的时间。	

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

续表

存在吸收过程	非血管内给药（如口服给药、肌肉注射、吸入给药、透皮给药等）都存在吸收过程。
不存在吸收过程	静脉注射等血管内给药
疗效的产生	起局部治疗作用的药物——不进入体循环
	起非局部治疗作用的药物——进入体循环

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

以下不存在吸收过程的给药方式是（ ）。

- A. 肌肉注射
- B. 皮下注射
- C. 椎管给药
- D. 皮内注射
- E. 静脉注射

答案：E

2019
5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

2016B【70-71】

- A. 药物的吸收
- B. 药物的分布
- C. 药物的代谢
- D. 药物的排泄
- E. 药物的消除

70. 药物从给药部位进入体循环的过程是

71. 药物从体循环向组织、器官或体液转运的过程是

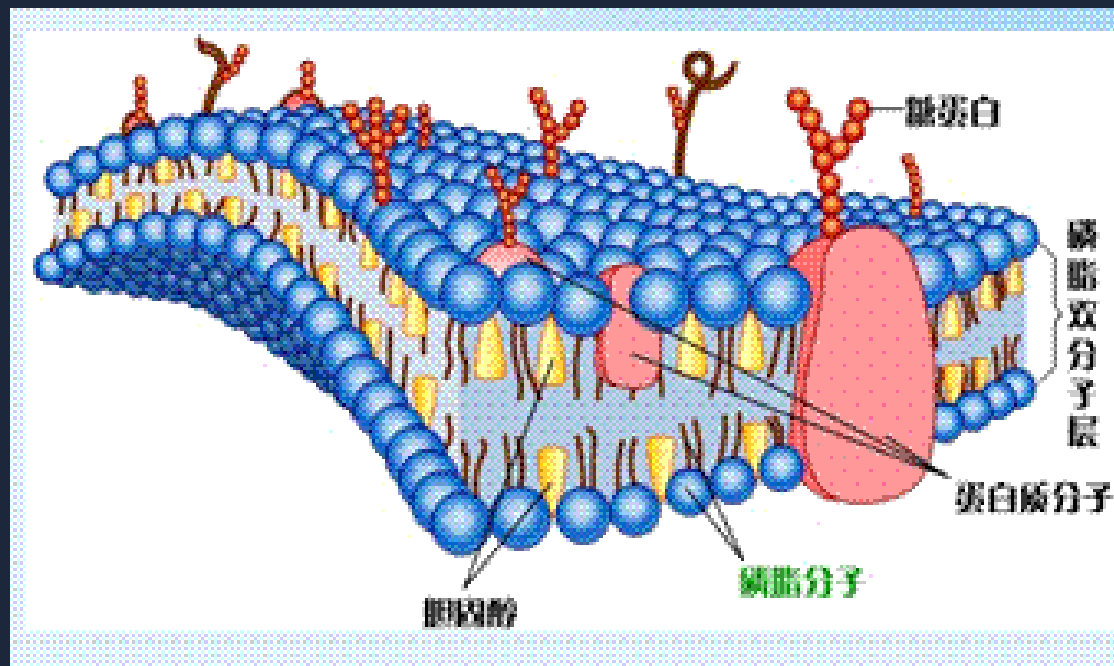
答案：AB

2019
5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

二、药物的跨膜转运

(一) 生物膜的结构



2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

生物膜=细胞膜+各种细胞器的亚细胞膜。

物质通过生物膜的现象称为物质的膜转运(药物吸收、分布和排泄中的重要过程)。

- ① 蛋白质能与药物可逆性结合，起到药物载体转运的作用。
- ② 膜结构具有半透性，脂溶性药物容易透过，脂溶性很小的药物难以通过，小分子水溶性药物可经含水性小孔吸收。

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

二、药物的转运方式 2015B(3), 2016B(3), 2017B(2),
2018B(2)

1、被动转运

①定义

被动转运：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。

2019
5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

②被动扩散的特点

- 顺浓度梯度转运，即从高浓度向低浓度转运，具有一级速度过程特征；
- 不需要载体，膜对通过物无特殊选择性；
- 无饱和现象和竞争抑制现象，无部位特异性；
- 扩散过程不需要能量
- ③被动扩散的途径

滤过+简单扩散

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

(1) 滤过:

细胞膜大多数膜孔约0.4nm, 肾小球与毛细血管内皮的细胞膜孔径较大。水溶性的小分子物质依靠膜两侧的流体静压或渗透压通过孔道, 如药物通过肾小球膜的滤过过程。

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

(2) 简单扩散：在体液pH下药物分子可解离成离子型+非解离型。未解离的分子型药物脂溶性较大，易通过脂质双分子层；离子型药物脂溶性小，不易透过生物膜。所以解离度小、脂溶性大的药物易吸收。但脂溶性太强时，转运亦会减少。药物的扩散速度取决于膜两侧药物的浓度梯度、药物的脂水分配系数及药物在膜内的扩散速度。药物大多数以这种方式通过生物膜。

2019

5073

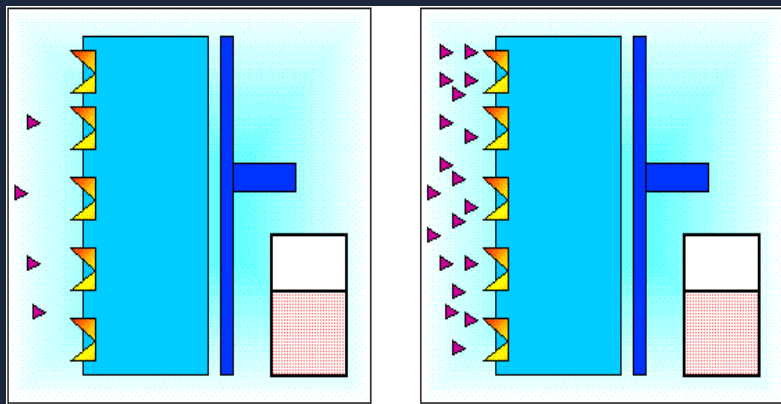
➤ 第一节 药物体内过程基础知识

2、载体转运(有主动转运和易化扩散两种方式)

主动转运

①定义

药物通过生物膜转运时，借助载体或酶促系统，可以从膜的低浓度一侧向高浓度一侧转运。



2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

②主动转运的特点：

- 逆浓度梯度转运
- 需要能量，能量来源主要是细胞代谢产生的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
- 可与结构类似物质发生竞争现象

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

- 受代谢抑制剂的影响
- 主动转运有结构特异性
- 有部位特异性（VB12 只在回肠末端吸收）
- 胆酸和维生素B2的只在小肠上段进行，维生素B12在回肠末端部位吸收。
- 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。

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

易化扩散

①定义：中介转运，是指一些物质在细胞膜载体的帮助下，由膜的高浓度一侧向低浓度一侧转运的过程。

2019

5072

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

②特点

- 兼具**被动**转运与**主动**转运的特点
- **顺**浓度梯度转运
- **不需**消耗生物体能量
- 转运速度与**载体**的量有关，存在**饱和**现象
- 具有**结构**特异性，存在**竞争**抑制现象
- 具有部位特异性具有载体转运的各种特征
如：**核苷类药物、单糖类、氨基酸**等**高极性**物质。

2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

3、膜动转运

通过细胞膜的主动变形将药物摄入细胞内或从细胞内释放到细胞外的过程。

2019
5073

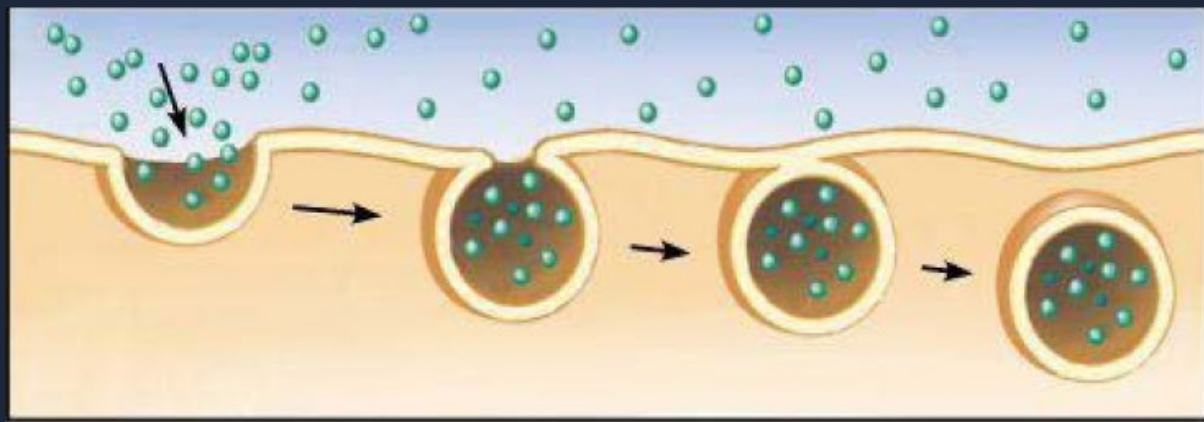
➤ 第一节 药物体内过程基础知识

胞饮：细胞通过膜动转运摄取液体

吞噬：细胞通过膜动转运摄取微粒或大分子物质。

胞吐：大分子物质从细胞内转运到细胞外

如：微粒给药系统, 膜动转运是蛋白质和多肽t通过膜动转运吸收, 且有一定的部位特异性（小肠下段）



2019

5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

总结

转运方式	顺浓度	载体	转运物质
被动转运	是	不需要	一般物质
主动转运	否	需要	生命必须物质（离子+葡萄糖、氨基酸）
易化扩散	是	需要	单糖类（如葡萄糖）和氨基酸等

①顺浓度梯度转运：转运过程不需要能量

②需要载体：饱和现象和竞争抑制现象，有结构特异性，有部位特异性；受代谢抑制剂的影响

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

历年考点

药物转运的特点（重中之重）

2019

5072

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

最佳选择题

主动转运的特点错误的是

- A. 逆浓度
- B. 不消耗能量
- C. 有饱和性
- D. 与结构类似物可发生竞争
- E. 有部位特异性

【答案】 B

2019
5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

2017B [64-65]

- A. 滤过
- B. 简单扩散
- C. 主动转运
- D. 易化扩散
- E. 膜动转运

64. 维生素B12在回肠末端部位的吸收方式属于

65. 微粒给药系统通过吞噬作用进入细胞的过程属于

[答案] CE

2019
5073

➤ 第一节 药物体内过程基础知识

2018B[58-59]

A. 简单扩散

B. 滤过

C. 膜动转运

D. 主动转运

E. 易化扩散

58. 蛋白质和多肽的吸收具有定的。部位特异性，其主要吸收方式是

59. 细胞外的及细胞内的 Na^+ 可通过 Na^+ -ATP酶逆浓度差跨膜转运, 这种过程称为

答案：CD

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

内容		历年分值
1. 胃肠道的结构与功能	(1) 胃肠道的结构与功能	2016A
	(2) 循环系统的生理因素	2017B(1), 2018A, 2018B(1)
	(3) 食物对药物吸收的影响	
	(4) 特殊人群的药物吸收特点	
2. 影响吸收的药物因素	药物理化性质对药物吸收的影响	2015X
3. 影响吸收的剂型因素	药物剂型与制剂因素对药物吸收的影响	2015A

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

一、药物在胃肠道的吸收（胃，小肠，大肠）

1. 胃的结构与药物吸收	(1) 胃的吸收面积小，不是吸收的主要部位；
	(2) 利于弱酸性药物吸收，以被动扩散为主。
2. 小肠的结构与药物吸收	有效吸收面积极大，是药物等吸收的主要部位；被动扩散为主，也是药物主动转运的特异吸收部。
	小肠的pH有利于弱碱性药物的吸收。

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

绪表

3. 大肠 的结构 与吸收	有效吸收面积小，不是药物吸收的主要部位；
	运行到结肠部位的大部分是缓释制剂、肠溶制剂或溶解度很小的药物残留部分；
	直肠下端近肛门处，血管丰富，是直肠给药的良好吸收部位；
	大肠中药物吸收机制，以被动扩散为主，兼有胞饮和吞噬作用。

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

二、影响药物吸收的生理因素

(一) 胃肠液成分与性质

1、胃肠道pH对吸收的影响：胃液的pH约为1.0左右，弱酸性药物在胃液pH下吸收较好。小肠的pH较胃液高得多，通常为5~7，有利于弱碱性药物的吸收。大肠的pH更高，约为8.3~8.4。

2、胃肠液中含有胆盐，能增加难溶性药物的溶解

3、胃肠道粘膜糖蛋白等对药物的吸附及促吸收作用。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

（二）胃排空与胃肠道蠕动

1、胃肠道运动

使食物和药物充分混合，同时有分散和搅拌作用，使与胃黏膜充分接触，有利于胃中药物的吸收

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

2、胃排空速率

(1) 以胃部吸收为主的药物，胃排空速率大，不利于吸收

(2) 以肠道吸收为主的药物，胃排空速率大，有利于吸收

(3) 影响胃排空速率的因素：与胃内容物的物理性状和化学组成有关。例如空腹饱腹、内容物的粘度和渗透压、食物成分（糖类化合物<蛋白质<脂肪）、卧位和胃肠道疾病、服用某些药物。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

（三）循环系统的影响

消化道上皮细胞吸收的药物经循环系统转运至身体各部位，循环系统的循环途径和其流量的大小都对药物吸收及血药浓度产生影响。胃肠吸收→门静脉→肝脏→体循环

2019

5073

》 第二节药物的胃肠道吸收

定义：2017B(1)， 2018B(1)

首过效应	指某些药物经胃肠道给药，在尚未吸收进入血循环之前，在肠粘膜和肝脏被代谢，而使进入血循环的原形药量减少的现象
	胃肠道中有酶，可被代谢。肝脏里有丰富的酶系统，可被代谢。
淋巴循环	一些油脂或结构与脂肪类似的药物及大分子药物，难以透过毛细血管的基膜进入毛细血管，较易进入没有基膜的毛细淋巴管，通过淋巴液进入全身循环。
	经淋巴系统吸收的药物不经肝脏，不受肝脏首过效应的影响。
	食物中的脂肪能加速淋巴液流动，使药物经淋巴系统的转运量增加。
血流量	血流量可影响胃的吸收速度，服药同时饮酒，药物吸收量可能增加

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

（四）食物的影响	<ul style="list-style-type: none">◆食物消耗胃肠内水分、◆食物妨碍药物向胃肠道壁的扩散◆脂肪促进胆汁分泌，◆增加一些难溶性药物的吸收◆延长胃排空时间；◆食物改变胃肠道pH
（五）胃肠道代谢作用	胃蛋白酶，一线分泌的各种酶，可以降解多肽和蛋白质
（六）疾病因素	可造成生理功能紊乱而影响药物的吸收

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

胃排空速度加快，有利于吸收和发挥作用的情形有（ ）。

- A. 在胃内易破坏的药物
- B. 主要在胃吸收的药物
- C. 主要在肠道吸收的药物
- D. 在肠道特定部位吸收的药物
- E. 作用于胃的药物

答案：AC——特定部位吸收的药物在特定部位的停留时间缩短，导致吸收减少。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

三、影响药物吸收的剂型（广义）因素

（一）影响药物吸收的物理化学因素

1、药物的解离度和脂溶性的影响

通常脂溶性大的药物易于透过细胞膜，且未解离的分子型药物比离子型药物易于透过细胞膜。脂溶性与药物的脂水分配系数有关，而非解离型药物的比例由吸收部位pH支配。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

通常弱酸性药物在胃液中几乎完全不解离，吸收好；弱碱类药物在胃液中解离程度高，吸收差。药物在小肠中的吸收情况与胃相反；亲脂性药物容易吸收，但并不是亲脂性越强吸收越好，脂水分分配系数过大的非极性物质则不易被胃肠吸收。抛物线关系

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

2、药物的溶出速度

固体药物制剂必须经崩解→溶解释放→吸收。对一些难溶性药物或溶出速度很慢的药物，吸收过程往往受**药物溶出速度**所限制，为影响药物吸收的主要原因。

- ① 粒径越小，溶出速率越大，越有利于吸收，因此可采用**微粉化**。
- ② 湿润性：疏水性药物接触角大，难以被水润湿，有效溶出表面积小，影响药物的溶出加入表面活性剂促进粉末表面的润湿，提高药物的溶出。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

- ③ 多晶型：有稳定型、亚稳定型和不稳定型。稳定型溶解度最小。
不稳定型则相反，但易转化为稳定型。亚稳定型介于二者之间，
为有效晶型。
- ④ 无定形：无定形药物溶解不需要克服晶格能，所以溶解速度比
结晶形快。
- ⑤ 溶剂化物：（药物与溶剂缔合形成的结晶）有机溶剂化物 > 无
水物 > 水合物。
- ⑥ 提高溶出速度的方法：成盐、制成固体分散体等

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

3、药物在胃肠道中的稳定性

酶的作用——药物降解或失活——采用注射或其他途径。

包衣：防止胃酸中不稳定药物的降解和失效。

制成药物的衍生物或前体药物能提高药物在胃肠道的稳定性。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

(二) 剂型与制剂因素对药物吸收的影响

1. 剂型对药物吸收的影响

口服剂型吸收一般顺序：溶液剂>混悬剂>散剂>胶囊剂>片剂>包衣片剂

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

(1) 溶液型制剂：影响溶液中药物吸收的因素有：溶液的黏度、渗透压、络合物的形成、胶团的增溶作用及化学稳定性等

(2) 乳剂：使油相高度分散，有利于药物的溶解和吸收；乳化剂改善胃肠黏膜的性能，从而促进药物吸收。油脂性物质可通过淋巴系统转运吸收，有利于提高抗肿瘤药物的治疗效果

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

(3) 混悬剂：难溶性药物在胃肠道中的吸收比溶液剂慢，但比胶囊剂、片剂、丸剂等固体制剂的吸收要好。

水混悬液中药物的吸收取决于药物的溶出速度、脂水分配系数。影响混悬剂生物利用度的因素有药物颗粒大小、晶型、分散溶剂种类、附加剂、黏度等。微粉化可减小颗粒的粒径，增加药物的溶出速度。

(4) 散剂

(5) 胶囊剂

(6) 片剂

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

2. 制剂处方对药物吸收的影响

(1) 液体制剂：

①**增黏剂**会影响药物的吸收

②**络合物与络合作用**：使药物在吸收部位的浓度减小

③**吸附剂与吸附作用**：如果辅料和药物是化学吸附，为不可逆，影响吸收；解离趋势大，可能不影响药物的吸收，有的可能只影响药物的吸收快慢，而不影响药物的吸收总量。活性炭对一些药物有很强的吸附作用，吸附物解离趋势小，使药物的生物利用度减少。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

④表面活性剂：降低表面张力+形成胶团增溶作用。浓度达到临界胶束浓度以上时，由于形成胶团使溶液中游离的药物浓度降低，可使药物吸收速度变小。当胶团中的药物能迅速分配到溶液中，转变成游离药物，则药物的吸收不受影响。

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

(2) 固体制剂中的药物和辅料的理化性质对吸收的影响

① 药物颗粒大小：减少粒径加快溶出

② 固体制剂辅料

③ 制剂包衣：一些肠溶衣片的疗效与胃肠道pH及在胃中的滞留时间有关。由于胃液的pH及片剂在胃中滞留时间在个体间变动很大，因此肠溶衣制剂血药浓度的个体差异可能也大

(3) 制剂制备工艺对药物吸收的影响

2019

5073

➤ 第二节药物的胃肠道吸收

四、生物药剂学分类系统与制剂设计

	高溶解度	低溶解度
高渗透性	I 类 高溶解度 高渗透性 （快速溶出）	II 类 低溶解度 高渗透性
低渗透性	III 类 高溶解度 低渗透性	IV 类 低溶解度 低渗透性

感谢观看

请继续关注，精彩内容待续……

2019

5073

》 第三节 药物的非胃肠道吸收

内容		历年分值
1. 注射部位的吸收	(1) 注射途径与吸收的关系	2015B (2) , 2016A, 2018B (1)
	(2) 影响注射给药吸收的因素	
2. 肺部吸收	(1) 肺部吸收的特点	2015B (1) , 2016A
	(2) 影响肺部药物吸收的因素	

2019

5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

续表

内容		历年分值
3. 黏膜吸收	(1) 鼻腔黏膜的生理环境与影响药物吸收的因素	
	(2) 口腔黏膜的生理环境与影响药物吸收的因素	
	(3) 眼部的生理环境与影响药物吸收的因素	
4. 皮肤吸收	(1) 皮肤吸收的特点	2018B(1)
	(2) 影响药物经皮渗透吸收的因素	

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

一、注射给药 2015B(2)

注射给药、吸收快、生物利用度高；

口服不吸收、在胃肠道降解、首过效应大、胃肠道刺激性大的药物常以注射给药，急救用药或不能吞咽的患者也往往采用注射给药。

静脉、肌肉、皮下、鞘内与关节腔内注射等。除关节腔内注射及局部麻醉药外，注射给药一般产生全身作用。静脉注射药物直接进入血液循环，无吸收过程，生物利用度为100%。

2019

5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

(1) 肌肉注射有吸收过程，药物经结缔组织扩散→毛细血管和淋巴吸收→血液循环。容量一般为2~50ml。长效注射剂常是油溶液或混悬剂，注射后在局部形成储库，缓慢释放药物达到长效目的。

(2) 皮下注射的吸收较肌肉注射慢，因皮下组织血管较少及血流速度比肌肉组织慢。一些需延长作用时间的药物如治疗糖尿病的胰岛素。植入剂常植入皮下。

(3) 皮内注射：真皮中，此部位血管稀且小，吸收差，只用于诊断与过敏试验，注射量在0.2ml以内。

2019

5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

(4) 动脉内注射：药物或诊断药直接输入靶组织或器官。如抗肿瘤药经动脉作区域性滴注，用于肿瘤治疗，可提高疗效和降低毒性。

2019

5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

（二）影响注射给药吸收的因素

生理因素、药物理化性质、制剂处方组成等

- 药物：分子量小的药物主要通过毛细血管吸收，分子量大的主要通过淋巴系统吸收；难溶性药物的溶解度影响药物的吸收
- 药物和蛋白结合，扩散通过生物膜的游离药物浓度降低，吸受到影响，药物与蛋白质的结合可能是可逆的平衡过程，当药物与蛋白质结合物的解离速率小于药物扩散通过生物膜的速率时，蛋白结合能显著影响药物的吸收。

2019

5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

- 剂型：水溶液 > 水混悬液 > 油溶液 > O/W乳剂 > W/O乳剂 > 油混悬液。

2019

5073

➤ 第三节 药物的非胃肠道吸收

二、吸入给药（肺部吸收-起效速度快）2015B(1)，2016A

可避免肝脏首过效应，

影响吸收的因素：

1、药物的性质

- 脂溶性——脂溶性药物易吸收
- 粒径——影响药物到达的部位，大于10mm的粒子沉积于气管中，2~10mm的粒子可到达支气管与细支气管，2-3mm的粒子可到达肺泡。粒径太小的粒子不能停留在呼吸道，容易通过呼气排出。
- 吸湿性

2019

5073

》 第三节 药物的非胃肠道吸收

2、制剂因素

- 处方组成、吸入装置的结构

3、生理因素

- 呼吸道黏膜中代谢酶的影响
- 吸入装置的使用

2019

5072

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

三、鼻粘膜吸收

其优点有：

- ①鼻黏膜内的丰富血管和鼻黏膜的高度渗透性有利于全身吸收；
- ②可避开肝脏的首过作用、消化酶的代谢和药物在胃肠液中的降解；
- ③吸收程度和速度有时可与静脉注射相当；
- ④鼻腔内给药方便易行。

2019

5073

➤ 第三节 药物的非胃肠道吸收

四、口腔黏膜给药

- 避免肝的首过效应及药物在胃肠道的破坏
- 影响因素：
药物、剂型、生理

2019
5072

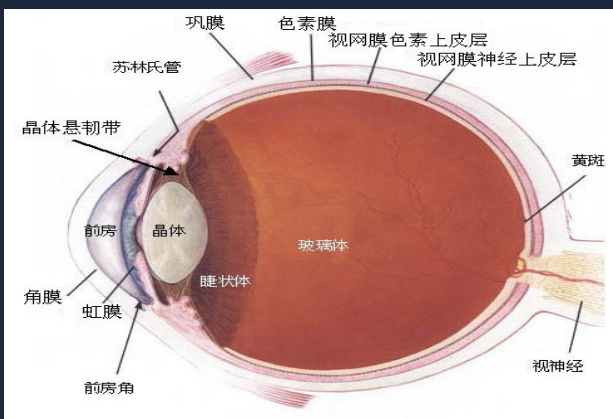
》 第三节 药物的非胃肠道吸收

五、眼部给药

（一）眼部药物吸收途径

经过角膜和结合膜两条途径吸收

- ① 角膜吸收：角膜→房水→前房→虹膜和睫状肌——局部作用
- ② 结合膜吸收：结膜→巩膜→眼球后部——体循环



2019

5073

》 第三节 药物的非胃肠道吸收

2、影响眼用制剂药物吸收的因素□

- 角膜的通透性
- 药物从眼睑缝隙的损失
- 药物的理化性质
- 制剂的pH和渗透压

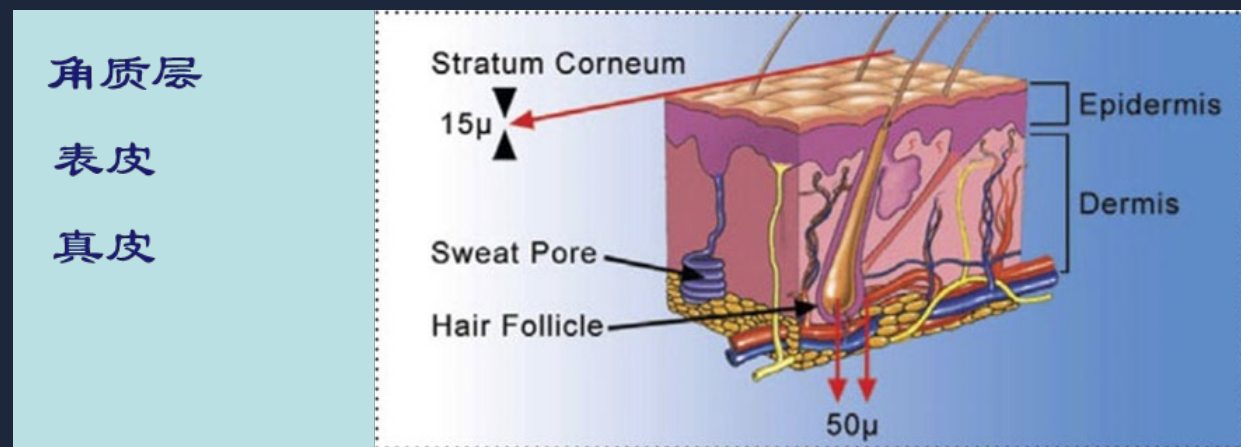
2019
5073

》 第三节 药物的非胃肠道吸收

六、皮肤给药 2018B(1)

1、药物透皮吸收途径

药物透皮吸收过程



2019

5072

》 第三节 药物的非胃肠道吸收

释放→穿透→吸收

- 释放：药物从基质中脱离并扩散到皮肤或黏膜表面
- 穿透：药物通过角质层扩散到达活性表皮，扩散至真皮，被毛细管吸收进入血液循环
- 吸收：通过角质层和活性表皮进入真皮被毛细管吸收进入血液循环，即表皮途径；

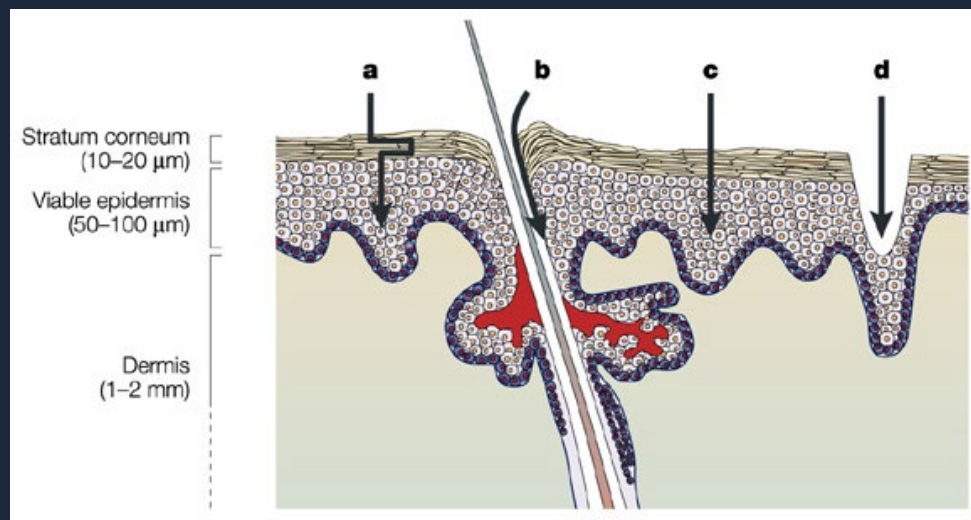
2019

5073

》 第三节 药物的非胃肠道吸收

透皮吸收的途径：

- 完整的表皮的角质层细胞及其细胞间隙——**主要途径**
- 皮肤的附属器毛囊、皮脂腺和汗腺



2019

5073

➤ 第三节 药物的非胃肠道吸收

2、影响药物透皮吸收的因素（药、人、用）

- 皮肤条件（人）
- 药物性质
- 基质的组成与性质

2019
5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

17. 大部份口服药物在胃肠道中最主要的吸引部位是

- A. 胃
- B. 小肠
- C. 盲肠
- D. 结肠
- E. 直肠

答案：B

2019
5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

2018A16. 关于药物吸收的说法，正确的是

- A. 在十二指肠由载体转运吸收的药物，胃排空缓慢，有利于其口服吸收
- B. 食物可减少药物的吸收，药物均不能与食物同服
- C. 药物的亲脂性会影响药物的吸收，油/水分配系数小
- D. 固体药物粒子越大，溶出越快，吸收越好
- E. 临床上大多数脂溶性小分子药物的吸收过程是主动转运

答案：A

2019

5073

» 第三节 药物的非胃肠道吸收

2018B [54-55]

- A. 经皮给药
- B. 直肠给药
- C. 吸入给药
- D. 口腔黏膜给药
- E. 静脉给药

54. 一次给药作用持续时间相对较长的给药途径是

55. 生物利用度最高的给药途径是

答案：AE

2019
5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

内容		历年分值
1. 药物分布	(1) 药物的分布及其影响因素	2015A, 2017A
	(2) 药物淋巴转运的特点	
	(3) 血脑屏障及转运机制	2017B (1)
	(4) 胎盘屏障及胎盘转运机制	
2. 药物代谢	(1) 药物的代谢与药理作用	
	(2) 药物代谢的部位与首过效应	2015A, 2018B (1)
	(3) 药物的代谢特点、代谢过程及其影响因素	2018B (1)
3. 药物排泄	药物的肾排泄、胆汁排泄与肠肝循环	2016A, 2017B (1), 2018B (2)

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

一、药物分布

药物的分布是指药物从给药部位吸收进入血液后，由循环系统运送至体内各脏器组织的过程。

2019

5073

▶▶ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

（一）影响分布的因素

（1）药物与**血浆蛋白结合的能力**：药物的脂溶性、分子量、解离度以及与蛋白质结合能力会影响分布，2017A

合并用药时，药物与血浆蛋白竞争结合可导致药物分布的改变，影响药物的作用强度和作用时间，甚至出现用药安全性问题。

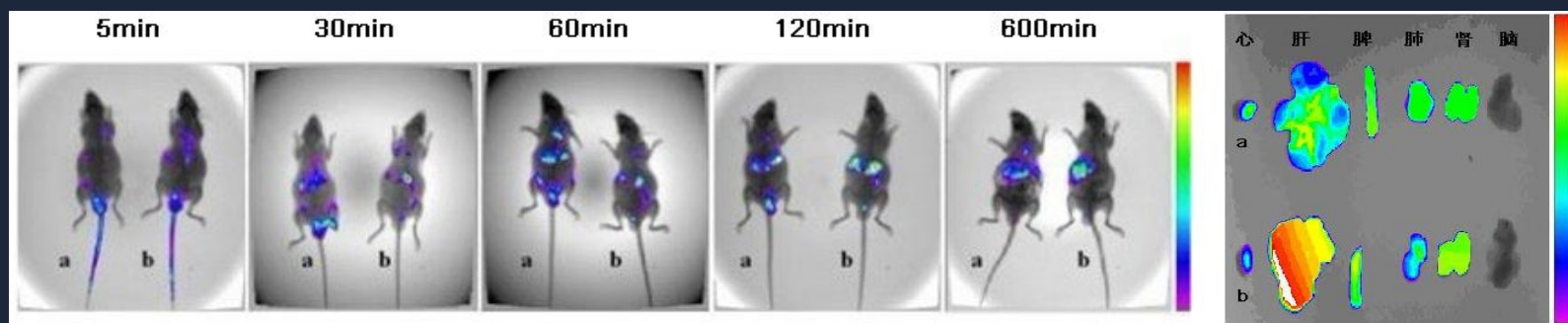
2019

5073

》 第四节 药物的分布、代谢和排泄

(2) 血液循环和血管透过性

血流量大，血管通透性好的组织器官，则药物分布速度快。



2019

5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

(3) 药物与组织的亲和力

非结合的游离型+结合型药物两种状态。而且结合时可逆过程，有饱和现象，游离型和结合型之间存在着动态平衡关系。

一旦结合，影响体内**分布**，**代谢**和**排泄**。不能透过血管壁向组织转运，不能由肾小球滤过，也不能经肝脏代谢。（一旦结婚啥都不能干）

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

4. 微粒给药系统

将药物制成脂质体、纳米粒、胶束、微乳等微粒给药系统，静脉注射后可明显改变原药物在体内的分布情况。可借助微粒给药系统产生**靶向作用**，使药物在靶器官或作用部位释放，而减少全身分布

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

(二) 淋巴系统转运

- 淋巴系统转运对脂肪、蛋白质转运十分重要；
- 淋巴系统为癌症等疾病的靶组织；
- 淋巴循环使药物避免肝首过效应

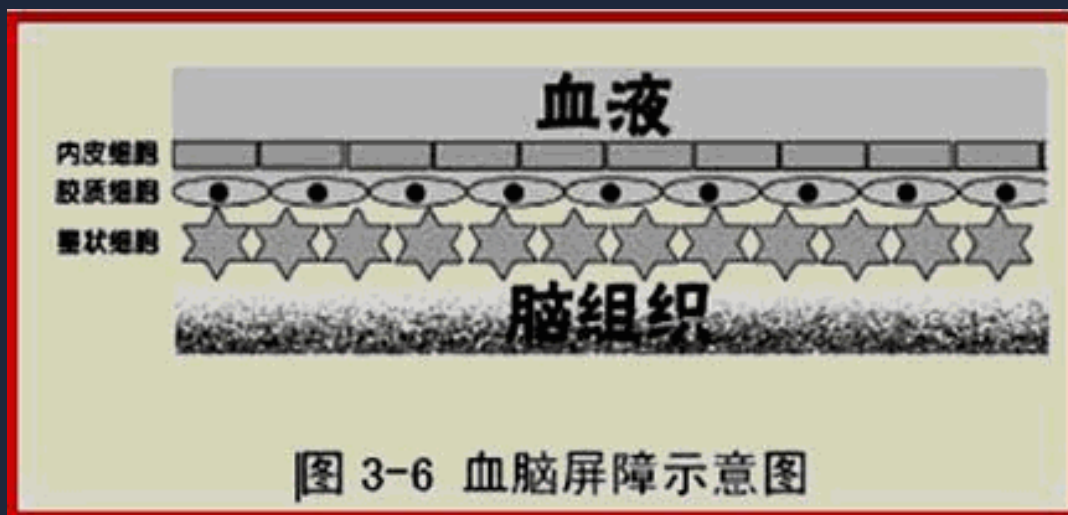
2019
5072

》 第四节 药物的分布、代谢和排泄

（三）脑内分布2017B(1)

血脑屏障

水溶性药物很难透入脑脊髓，而脂溶性药物却能迅速向脑脊髓转运。病理状态时血脑通透性增加。



2019

5073

▶▶ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

（四）胎儿内分布



2019

5073

▶▶ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

二、药物代谢

药物代谢是指药物在体内发生化学结构的变化过程，即在酶参与之下的生物转化过程。药物的代谢主要在肝脏中进行。

1、药物代谢与药理作用的关系

- (1) 代谢使药物失去活性或活性降低：氯丙嗪；
- (2) 代谢使药物活性增强或使药理作用激活：非那西丁；
- (3) 代谢产生毒性代谢物

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

2、药物代谢酶和代谢部位2015A

- (1) 肝脏的首过效应；
- (2) 许多研究证明，药物在肠道时的代谢率很高。

2019
5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

3、药物代谢酶和代谢的类型

(1) 微粒体药物代谢酶系统：氧化反应类型，称为肝微粒体混合功能氧化酶系统或称细胞色素P450酶系。

(2) 非微粒体酶：存在于肝脏外，如血浆、胎盘、肾、肠黏膜及其他组织中。在体内除与葡萄糖醛酸结合外，其他缩合，以及某些氧化、还原及水解反应都可为该酶系统所催化。

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

代谢类型

- **第Ⅰ相反应**：引入官能团的反应，通常是脂溶性药物经氧化、还原、水解和异构化，引入羟基、氨基或羧基等极性基团。
- **第Ⅱ相反应**：结合反应。极性基团与机体内源性物质结合生成结合物，增加药物的极性和水溶性，有利于药物的排泄。

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

4、影响代谢的因素：

给药途径、剂量与剂型、药物的光学异构特性、酶抑或酶促进作用、基因多态性、生理因素等。

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

三、排泄

排泄系指药物及其代谢产物可以通过肾脏、胆汁、消化道、呼吸系统、汗腺、唾液腺、乳汁、泪腺等途径排泄。主要——肾脏

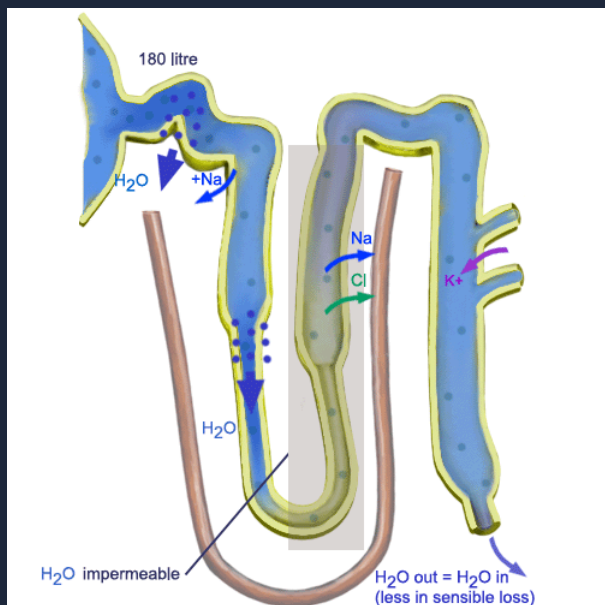
2019

5072

》 第四节 药物的分布、代谢和排泄

(一) 药物的肾排泄 2018B(1)

肾排泄：肾小球滤过、肾小管重吸收和肾小管分泌。



2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

影响药物排泄的因素：

- ①药物与血浆蛋白的结合：结合影响过滤——排泄减少
- ②药物的脂溶性、 pK_a 、尿液的 pH 、尿量——肾小管的重吸收。

2019

5073

▶▶ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

肾清除率：

肾清除率代表在一定时间内（通常以每分钟为单位）肾脏能使多少容积（通常以毫升为单位）的血浆中药物被清除的能力。肾清除率能反映药物排泄的机制。正常值为 120ml/min 。

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

（二）药物的胆汁排泄

1、胆汁排泄 2018B(1)

药物从血液向胆汁排泄时，首先由血液进入肝细胞并继续向毛细胆管转运。被动扩散和主动转运。

2019

5073

➤ 第四节 药物的分布、代谢和排泄

2、肠-肝循环

随胆汁排入十二指肠的药物或其代谢物，在肠道中重新被吸收，经门静脉返回肝脏，重新进入血液循环的现象。

有肠-肝循环的药物在体内能停留较长时间。己烯雌酚、卡马西平、氯霉素、吲哚美辛、螺内酯等药物口服后都存在肠-肝循环。一些药物会因肠-肝循环在血药浓度-时间曲线上出现第二个峰，即产生双峰现象。

2019

5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

历年考点 影响药物体内过程的因素

多项选择题

影响胃排空速度的因素是

- A. 空腹与饱腹
- B. 药物因素
- C. 食物的组成和性质
- D. 药物的多晶型
- E. 药物的油水分配系数

【答案】 ABC

2019

5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

一般认为在口服剂型中，药物吸收的快慢顺序大致是

- A. 散剂>水溶液>混悬液>胶囊剂>片剂>包衣片剂
- B. 包衣片剂>片剂>胶囊剂>散剂>混悬液>水溶液
- C. 水溶液>混悬液>散剂>胶囊剂>片剂>包衣片剂
- D. 片剂>胶囊剂>散剂>水溶液>混悬液>包衣片剂
- E. 水溶液>混悬液>散剂>片剂>胶囊剂>包衣片剂

【答案】 C

2019

5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

配伍选择题

- A. 肝脏
- B. 肾脏
- C. 肺
- D. 胆
- E. 心脏

- 1、药物排泄的主要器官是
- 2、吸入气雾剂的给药部位是
- 3、进入肠肝循环的药物的来源部位是
- 4、药物代谢的主要器官是

【答案】 B C D A

2019

5073

» 第四节 药物的分布、代谢和排泄

2018B[60-61]

- A. 肾小管分泌
- B. 肾小球滤过
- C. 肾小管重吸收
- D. 胆汁排泄
- E. 乳汁排泄

60. 属于主动转运的肾排泄过程是

61. 可能引起肠肝循环的排泄过程是

答案：AD

2019
5073

感谢观看

请继续关注，精彩课程内容待续……

2019

5073