

药代动力学：吸收-4

Lily Qtof 2019-06-22

其他给药途径

其他给药途径

- 注射给药

静脉注射

肌内注射

皮下注射

皮内注射

腹腔内注射

鞘内注射

- 口腔给药

- 鼻腔给药

- 肺部用药

- 皮肤吸收

- 眼部用药

- 直肠及阴道给药

一 注射给药

注射方法有静脉、肌内、皮下、鞘内与关节腔内注射等数种。除关节腔内注射和局部麻醉药外，注射给药一般产生全身作用。注射部位不同，所能容纳的注射液体积、允许的药物分散状态及药物吸收的快慢均不同。

1. 静脉注射 (intravenous injection)

- 直接进入血液循环，无吸收过程，生物利用度100%；
- 迅速注射后4min内血药浓度达最大；

- 由于药物迅速进入血液循环，比其他给药途径更容易产生药物休克、过敏反应等危险的副作用，因此要求静脉注射缓慢进行；
- 刺激性太大的药物不宜肌肉注射或皮下注射，必须用静脉注射，可以用等渗溶液稀释后静脉滴注，但也有可能引起静脉炎，甚至因药液流出血管外引起注射部位坏死。

静脉注射与静脉滴注：

- 静脉注射的容量一般小于50mL,当药物的半衰期小或需大容量（100~1000mL）给药时，可以静脉滴注给药；
- 有时要求药物在血浆中的浓度保持在相当窄的范围内，或者不低于所需最低浓度，可用连续静脉滴注维持稳定的血浆浓度水平；
- 静脉注射或静脉滴注一般为水溶液，亦有乳剂。

2. 肌肉注射 (intramuscular injection)

药物的肌肉注射有吸收过程，药物先经结缔组织扩散，再经毛细血管和淋巴进入血液循环。肌肉结缔组织中有细密的毛线血管网和淋巴管网。

毛细血管壁具有小孔道，药物可以通过扩散和滤过两种方式转运，通过速度比其他生物膜快。一般认为脂溶性药物可直接通过毛细血管的内皮细胞吸收，而水溶性药物主要通过毛细血管壁上的细孔进入毛细血管。

一般影响肌肉注射的药物吸收的因素比口服少得多，药物吸收程度与静脉注射相当。然而，亦有一些药物肌肉注射后吸收缓慢而不完全，例如四环素、地西洋、氯氮卓、苯妥英钠、地高辛和奎尼丁等药物肌肉注射的吸收不比口服好。

肌肉注射的容量一般为2~5mL,其溶媒为水、复合溶媒或油，可以使溶液剂或混悬剂。长效注射剂常是药物的油溶液或混悬剂，注射后在局部形成储库，缓慢释放药物达到长效目的。

3. 皮下注射

皮下结缔组织内间隙多，药物注射后扩散进入毛细血管吸收。由于皮下组织血管较少，血流速度亦比肌肉组织慢，故皮下注射药物的吸收较肌肉注射慢，有些甚至比口服慢。需延长药物作

用时间的药物可采用皮下注射，如治疗糖尿病的胰岛素。一些作用于注射部位的药物如局部麻醉剂，可与血管收缩剂如肾上腺素合用，可延长其作用时间。

4. 皮内注射

皮内注射是将药物注射到真皮以下部位，此部位血管细小、吸收差，只用于诊断与过敏试验。注射量在0.2mL以内。

5. 腹腔内注射

腹腔内注射以门静脉为主要吸收途径，药物在向组织分布前首先通过肝后才转运至全身，因此很多药物的生物利用度受到影响。由于腹腔内注射给药有一定的危险性，所以此给药途径多用于动物实验。

6. 鞘内注射

鞘内注射可用于克服血脑屏障。药物经血流向中枢神经系统转运时，可能要通过血脑屏障。尽管脑内血流速度极快，血流量也非常丰富，但大多数药物进入脑内的速度却很慢，有些药物完全不能进入脑内，鞘内注射能完全避免该屏障的作用使药物向脑组织分布。

二 口腔给药

口腔粘膜给药可发挥局部或全身治疗作用，局部作用剂型多为溶液型或混悬型漱口剂、气雾剂、膜剂、口腔片剂等，可用于治疗口腔溃疡、细菌或真菌感染，以及其他口腔科或牙科疾病。全身作用常采用舌下片、粘附片、贴膏等剂型。

三 鼻腔给药

鼻粘膜给药以往多用于局部作用，如杀菌、抗病毒、血管收缩、抗过敏药物，可制成溶液剂滴入鼻腔，也可以气雾剂给药。

近年来研究发现许多药物通过鼻粘膜给药可以获得比口服给药更好的生物利用度。某些本来很难从鼻腔吸收的多肽和蛋白质类药物，通过加入吸收促进剂、酶抑制剂或生物粘附性微球给药，能提高鼻腔吸收的生物利用度。

鼻粘膜给药被认为是较理想的取代注射给药的全身给药途径。其优点为：

- 鼻粘膜内的丰富血管和鼻粘膜的高度渗透性有利于吸收；
- 可避开肝首过作用、消化道粘膜代谢和药物在胃粘液中的降解；
- 吸收程度和速度有时可与静脉注射相当；
- 鼻粘膜内给药方便易行。

四 肺部的吸收

吸入给药能产生局部或全身治疗作用，涉及的剂型有气雾剂、粉雾剂和粉末吸入剂。

正常人的肺部总面积约为 140m^2 ，肺泡细胞间隙中存在致密的毛细血管，肺泡表面至毛细血管的距离仅为 $1\mu\text{m}$ ，是气体交换和药物吸收的良好场所。巨大的肺泡表面积、丰富的毛细血管和极小的转运距离，决定了肺部给药的迅速吸收，而且吸收后的药物直接进入血液循环，不经受肝的首过作用。

呼吸道粘膜中存在多种代谢酶，如磷脂酶和肽酶。药物可能在肺部上皮组织被代谢，从而失去活性。

五 皮肤吸收

皮肤用药常起保护皮肤与局部治疗作用。药物渗透通过皮肤进入血液循环的途径有两条：

- 1是透过角质层和表皮进入真皮，被毛细血管吸收进入血液循环，即表皮途径，这是药物经皮吸收的主要途径；

- 2是通过皮肤的附属器，即通过毛囊、皮脂腺和汗腺。药物通过皮肤附属器的渗透速度要比表皮途径快，但皮肤附属器在皮肤表面所占的面积只有0.1%左右，因此不是药物经皮吸收的主要途径。

六 眼部用药

眼部用药主要用于发挥局部治疗作用，如缩瞳、散瞳、降低眼压、抗感染。甾体激素类抗炎药和抗感染药物在眼用制剂中应用最广泛。

常用制剂有各类灭菌的水溶液、水混悬液、油溶液、油混悬液、眼膏和眼用膜剂等。

使用后必须使药物到达作用部位并能保持有效浓度，所谓眼部吸收也就是药物在眼内个部位的透过性问题。

参考文献：

[1]魏树礼，张强.《生物药剂学与药物动力学》，2007，第二版。

[2]Malcolm Rowland, Thomas N. Tozer, Clinical Pharmacokinetics and Pharmacodynamics: concepts and Applications.2011, Fourth edition.



正因为你在玫瑰上花费了时间，
才使你的玫瑰如此重要。