

□ Направление/специальность: **060108 –
Фармация**

□ Дисциплина: **ОПД.Ф.03 Фармакология**

□ Уровень образования, форма обучения, курс,
семестр: **ВПО, 3 курс, 5 семестр**

□ Тема лекции № 1 «**Введение в курс
фармакологии. Современное определение
предмета. Задачи фармакологии в подготовке
современного провизора. Этапы создания
новых лекарственных средств**»

□ Количество часов: 2

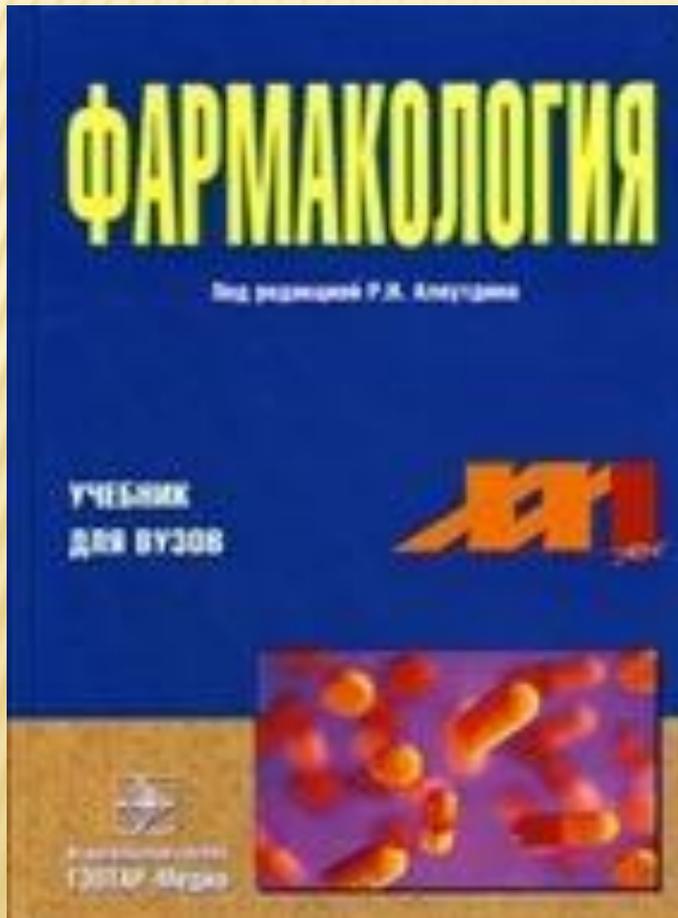
□ Ответственный исполнитель: _____

□ проф. В.А.Николаевский 2011 г.

□ **Фармакология** (от греч (от греч *pharmakon* (φάρμακον) — лекарство (от греч *pharmakon* (φάρμακον) — лекарство или яд, и *logos* (λόγος) — наука) — медико биологическая наука о лекарственных веществах и их действии на организм; — наука о физиологически активных веществах вообще и их действии на биологические системы.



Ренад **Аляутдин**, зав. кафедрой фармакологии ММА



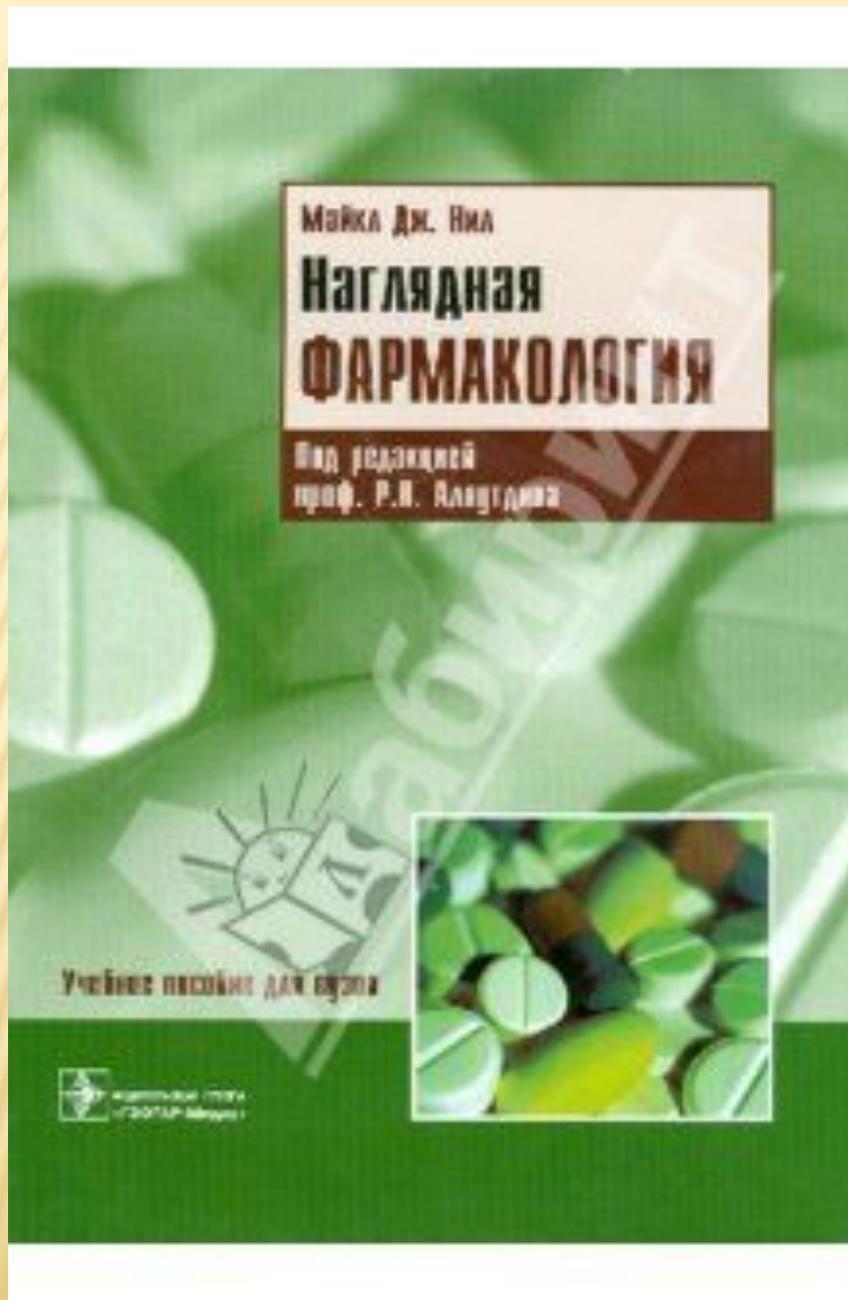
В учебнике «Фармакология» содержатся сведения об основных фармакологических свойствах лекарственных препаратов (классификация, химическая структура, фармакокинетика, фармакодинамика, показания и противопоказания к применению, побочные эффекты, нежелательное взаимодействие между лекарственными средствами, формы выпуска и информация для пациентов). Учебник «Фармакология» полностью отвечает программе по фармакологии 2002 г. и предназначен для самостоятельной подготовки студентов к практическим занятиям.



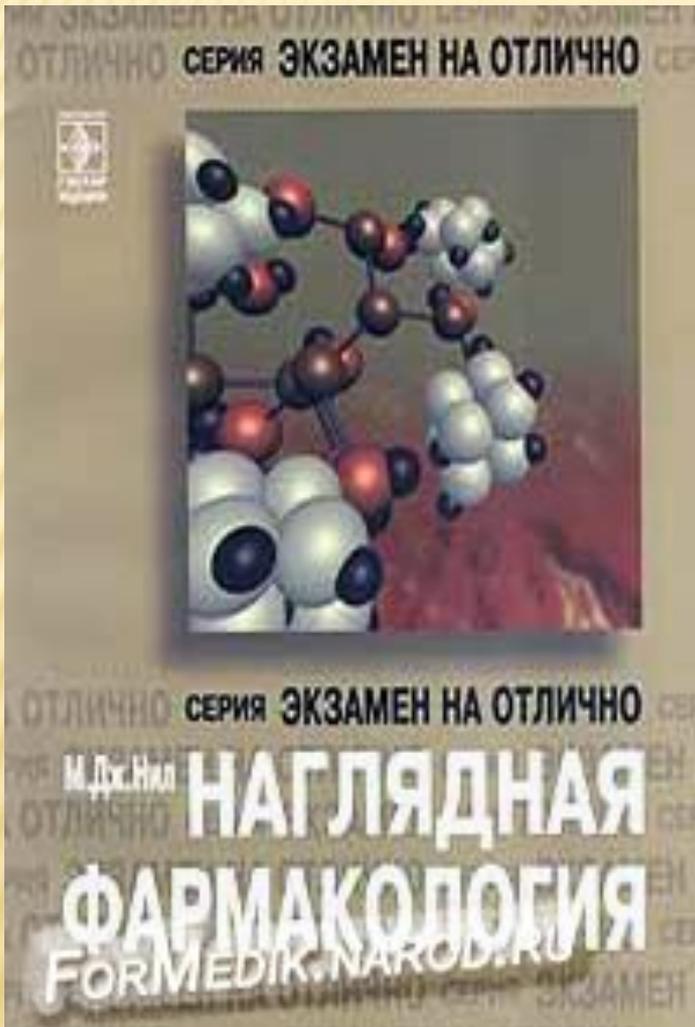
□ **Аляутдин**



- ▣ **Аляутдин Р.Н.**
Фармакология в
вопросах и
ответах.



- Нил; Аляутдин Р. Н.. Наглядная фармакология.



- **Наглядная фармакология**

Автор: Х. Люльман, К. Мор, Л. Хайн

- **Год выпуска: 1999**

- **Язык: русский**

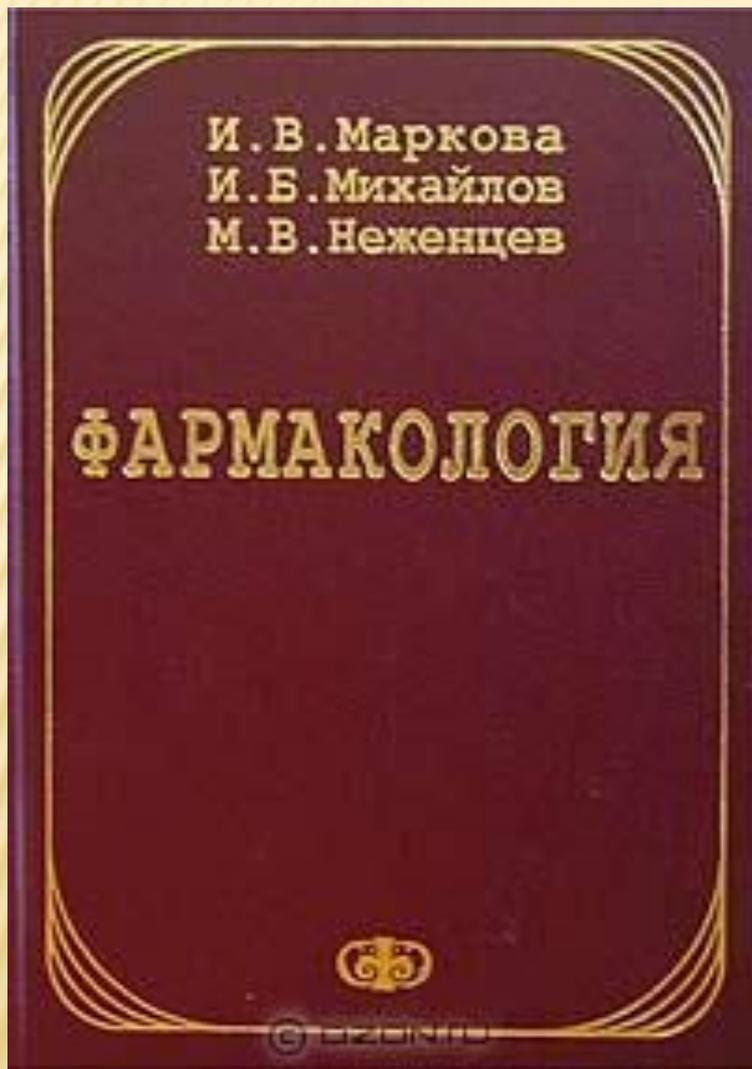
- **Формат: DJVU**

- **Размер файла: 7,8 МВ**

- **Описание книги:**

- **В книге содержится современная информация по вопросам общей и частной фармакологии. Фармакологический материал представлен в виде рисунков и схем, что делает его наглядным и удобным в использовании при подготовке к занятиям. Предназначена студентам медицинских вузов, фармакологам и врачам различных специальностей.**

-

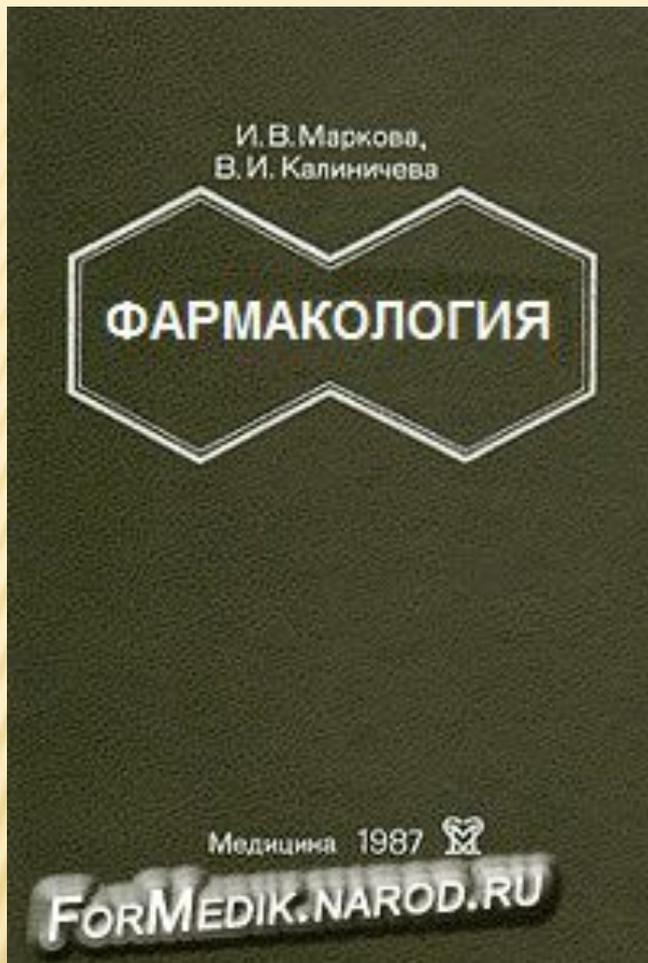


- Десятое издание учебника существенно переработано и дополнено многими новыми данными. Учебник включает разделы о лечении и профилактике остеопороза, о фармакологии мозгового кровообращения, о новых гиполипидемических препаратах, о фармакотерапии ожирения, о новых негликозидных кардиотониках, о противобластомных средствах из группы моноклональных антител, ингибиторов тирозинкиназ, о перспективах генной терапии и многие другие.
- [Гэотар-Медиа](#), твердый переплет, 2009
- ISBN: 978-5-9704-1210-7



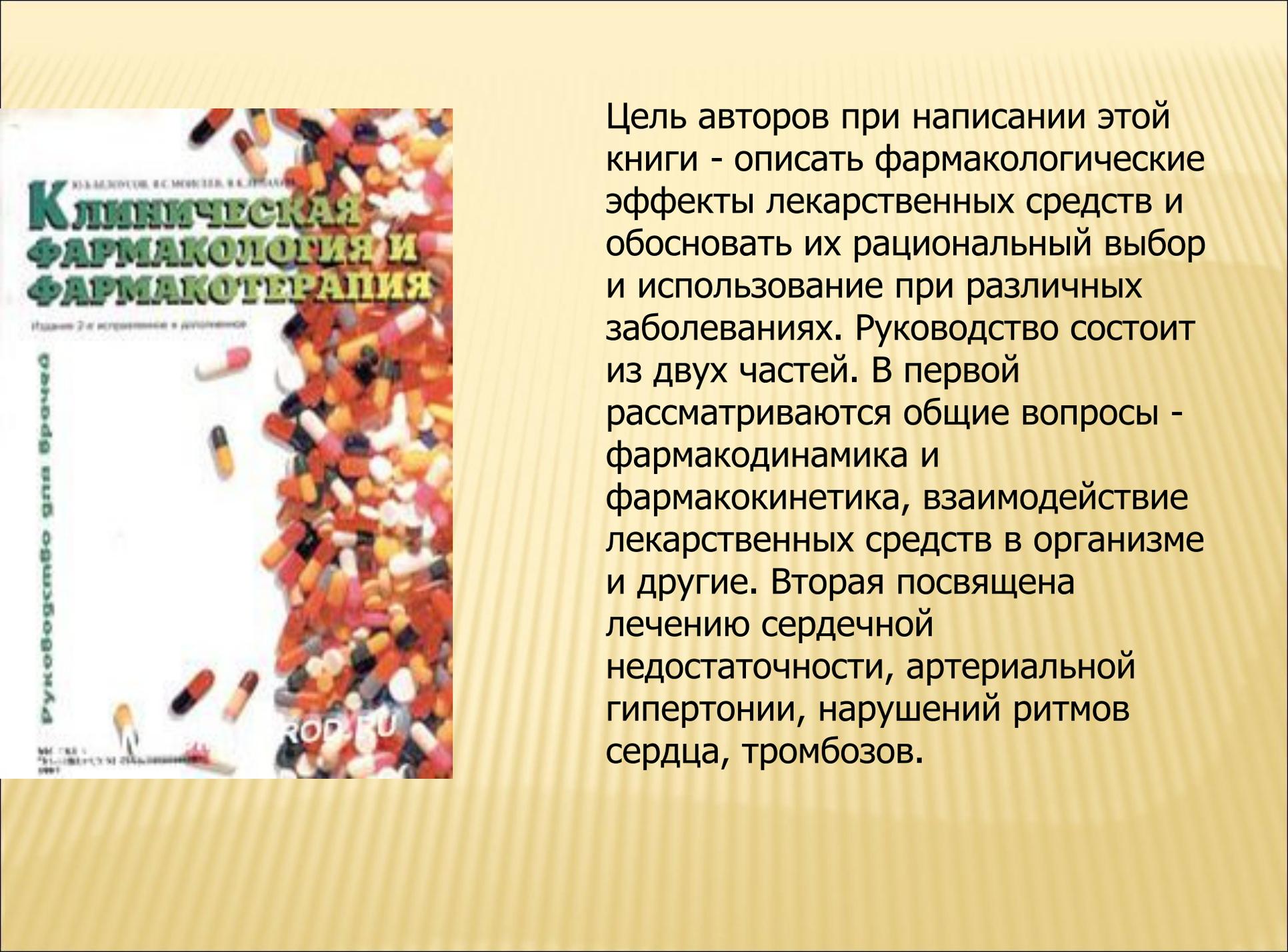
Девятое издание учебника существенно переработано и дополнено многими новыми данными. Учебник включает разделы о лечении и профилактике остеопороза, о фармакологии мозгового кровообращения, о новых гиполипидемических препаратах, о фармакотерапии ожирения, о новых негликозидных кардиотониках, о перспективах генной терапии и многие другие. Обсуждаются современные представления о принципах фармакотерапии ряда заболеваний. Механизм действия веществ рассматривается на основе последних достижений фундаментальной фармакологии.

Предназначен студентам высших медицинских учебных заведений.



Во второе издание включены современные сведения о фармакологии вообще, об отдельных группах и новых препаратах, о применении лекарств у детей.

Учебник предназначен для студентов третьего курса педиатрических и лечебных факультетов медицинских институтов.



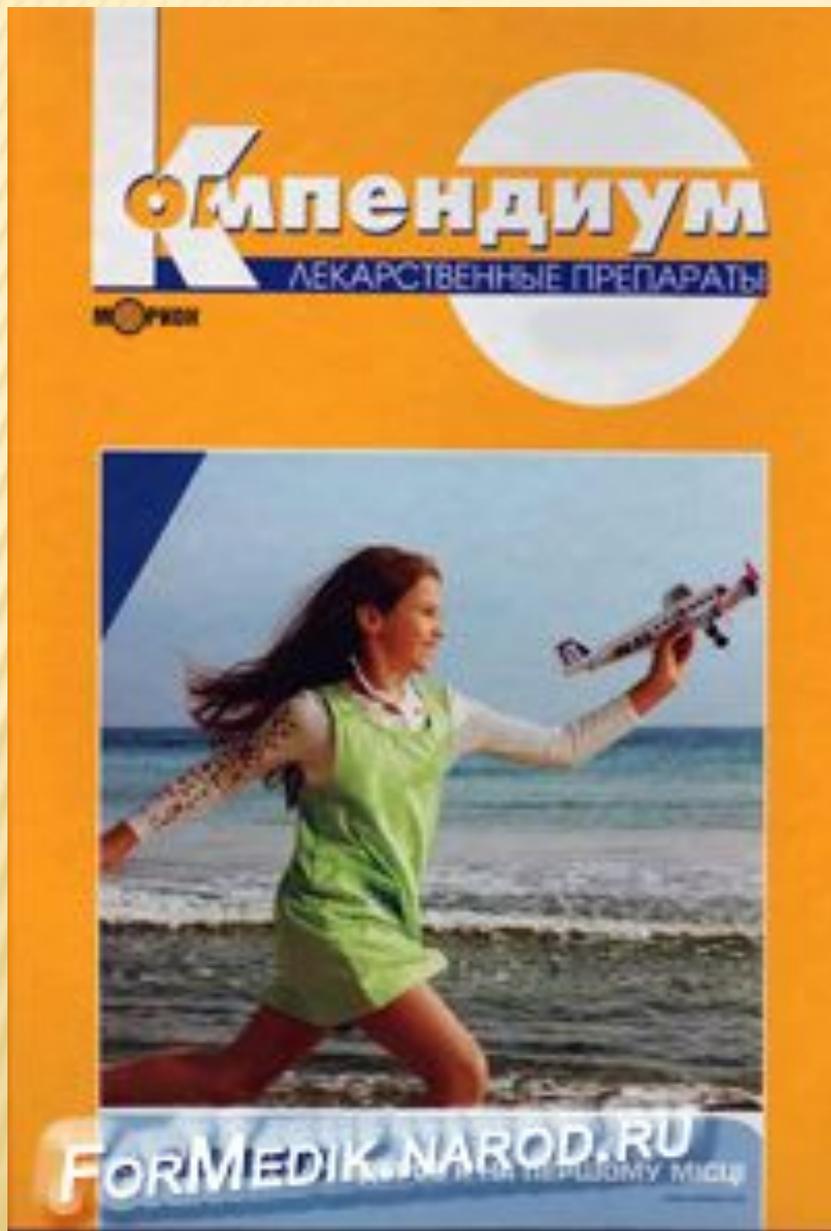
Клиническая
ФАРМАКОЛОГИЯ И
ФАРМАКОТЕРАПИЯ

Издание 2-е исправленное и дополненное

Руководство для врачей

ГОРБУ

Цель авторов при написании этой книги - описать фармакологические эффекты лекарственных средств и обосновать их рациональный выбор и использование при различных заболеваниях. Руководство состоит из двух частей. В первой рассматриваются общие вопросы - фармакодинамика и фармакокинетика, взаимодействие лекарственных средств в организме и другие. Вторая посвящена лечению сердечной недостаточности, артериальной гипертензии, нарушений ритмов сердца, тромбозов.



В справочнике «КОМПЕНДИУМ» даны описания лекарственных препаратов с указанием форм выпуска, владельцев лицензий, фирм - производителей, приведены международные непатентованные названия активных фармацевтических субстанций, рекомендуемые или предложенные ВОЗ (International Nonproprietary for pharmaceutical substances, WHO, Names (INN) Geneva, 2002, WHO Drug information; Proposed INN list, 2003–2005; Recommended INN list, 2003–2005), а также указаны коды препаратов в соответствии с системой АТС последнего пересмотра (Anatomical Therapeutic Chemical (ATC) classification system, WHO, 2005).

Базисная и клиническая Фармакология

Бертрам Г. Катцунг


FORMEDIK.NAROD.RU

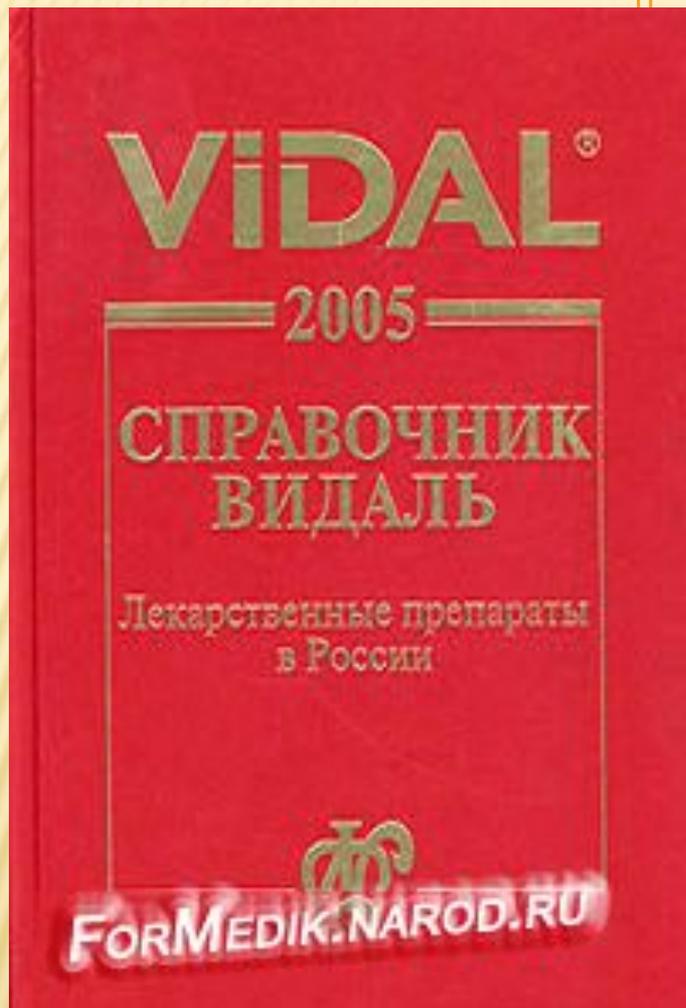
В 1-ом томе рассмотрены общие принципы фармакологии; вопросы фармакокинетики, фармакодинамики и биотрансформации лекарств. Подробно охарактеризованы средства, влияющие на центральную и вегетативную нервную систему, сердечно - сосудистую систему и почки, гладкую мускулатуру.

Во 2-ой том включены разделы, посвященные средствам лечения заболеваний крови, воспалительных заболеваний и подагры; химиотерапии опухолей, протозойных и паразитарных заболеваний; лекарственной терапии болезней эндокринной системы. Проблемы лекарственной токсикологии представлены в главах, касающихся как собственно токсического действия лекарств, так и лечения отравлений.

Книга предназначена для врачей, студентов медицинских учебных заведений.

- Представляет собой современную базу данных, снабженную мощной поисковой системой, удобной подсказкой и средствами вывода информации на печать.
В справочнике содержится информация о более чем 1500 (не считая синонимов) отечественных и зарубежных лекарственных средств, тщательно проверенных и разрешенных к применению в медицинской практике. В него включены подробные сведения о современных лекарственных средствах и механизмах их действия, показаниях и противопоказаниях к применению, дозировке, побочных эффектах, фармакологических свойствах и многое другое.



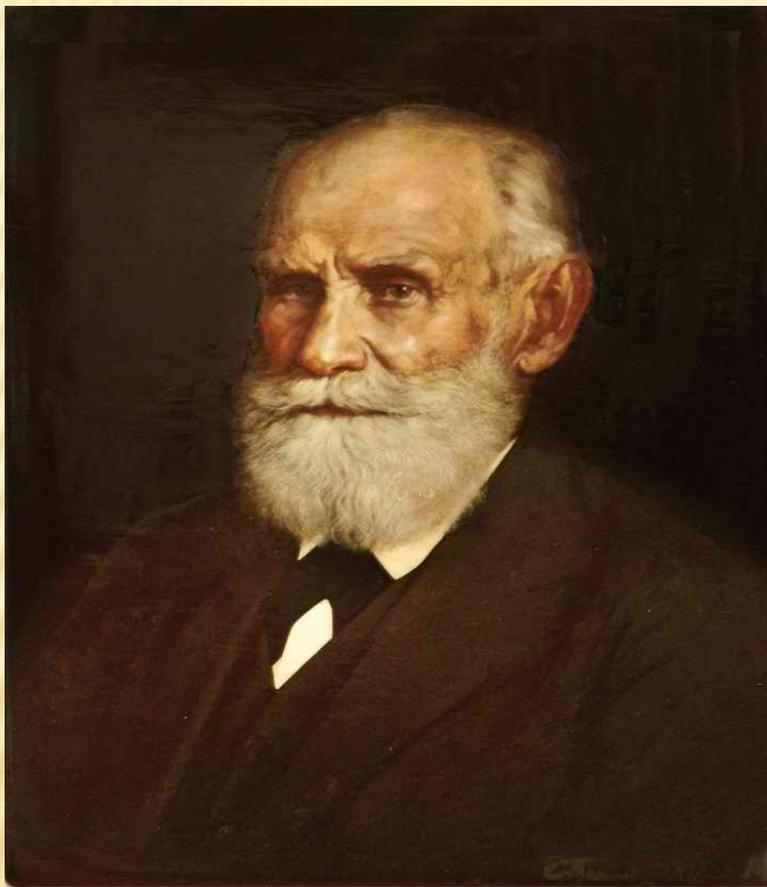


СПРАВОЧНИК ВИДАЛЬ содержит информацию о 3038 лекарственных препаратах и активных веществах, представленных на российском фармацевтическом рынке 408 предприятиями и фирмами 52 стран. Полные описания включают торговое название препарата, рекомендованное международное наименование, состав и формы выпуска (с фотографиями упаковок), фармакологическое действие, фармакокинетические параметры, показания к применению и режимы дозирования для различных групп пациентов, побочные эффекты, противопоказания, симптомы передозировки и тактику их купирования, лекарственное взаимодействие и особые указания по применению.



В разделе "Общая клиническая фармакология" подробно освещены общие вопросы фармакодинамики и фармакокинетики, лекарственного взаимодействия, особенностей клинической фармакологии в разных возрастных группах, у беременных и кормящих матерей. В разделе "Частная клиническая фармакология" описаны различные группы лекарственных препаратов с учётом фармакокинетических и фармакодинамических особенностей, режима дозирования, побочных эффектов и показаний к применению.

Многочисленные таблицы, а также контрольные вопросы и задачи, завершающие каждую главу, помогают более успешному усвоению материала,



Иван Петрович Павлов - великий русский ученый-физиолог, академик, лауреат Нобелевской премии (1849-1936).

- Фармакология как медицинская доктрина ... вещь чрезвычайно важная, так как уже первый прием лечения по универсальности есть введение лекарственных веществ в человеческий организм. Ведь какой бы случай ни был, даже акушерский или хирургический, почти никогда не обходится дело без того, чтобы вместе с специальными приемами не были введены в организм лекарства.

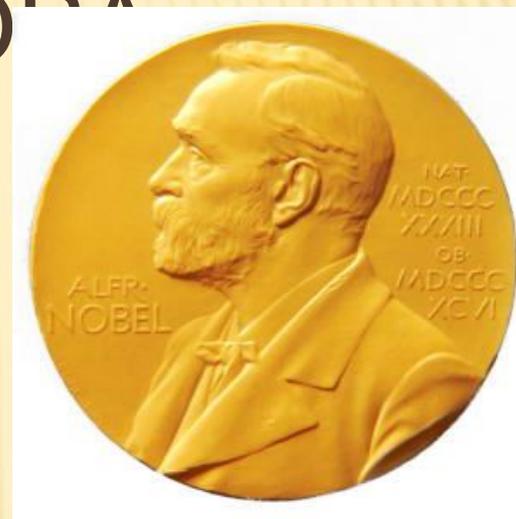
И.П.ПАВЛОВА.

(1849 - 1936)

Родился в Рязани. В 1860 году в возрасте 11 лет поступил в церковное приходское училище, а после его окончания - в духовную семинарию, но на последнем курсе под влиянием эволюционных идей Дарвина и материалистических воззрений И.М. Сеченова, Павлов уехал из Рязани в Петербург и в 1870 г. поступил в Университет на естественное отделение физико-математического факультета. После окончания университета в 1875 году Павлов поступил на 3 курс Медико-Хирургической Академии (в настоящее время это Российская Военно-Медицинская Академия), которую закончил в 1879 году с золотой медалью и начал работать в физиологической лаборатории клиники С.П. Боткина , проводя исследования по физиологии кровообращения. В 1890 году И.П. Павлов был избран профессором кафедры фармакологии Военно-медицинской академии, а в 1895 году - кафедры физиологии, где проработал до 1925 года.

Основное внимание И.П. Павлов сконцентрировал на изучении проблем физиологии пищеварения. Обширные и уникальные экспериментальные данные И. П. Павлов представил в книге "Лекции о работе главных пищеварительных желез", опубликованной в 1897 г. на русском, в 1898 - на немецком, в 1901 - на французском, в 1902 - на английском языках. В 1904 году И.П. Павлову присуждается Нобелевская премия за выдающиеся достижения в области изучения физиологии пищеварения. Получившие высшее международное признание работы И.П. Павлова по физиологии пищеварения, послужили также толчком для развития нового направления в физиологии - физиологии высшей нервной деятельности. Этому направлению исследований И.П. Павлов посвятил 35 лет своей деятельности, создав метод условных рефлексов. с помощью которого изучение психических процессов у животных привело к созданию учения о высшей нервной деятельности и механизмов мозга, обеспечивающих высшие проявления психической деятельности животных.

ДИПЛОМ И НОБЕЛЕВСКАЯ МЕДАЛЬ И.П. ПАВЛОВА



«ЛЕКАРСТВО» - ПРОИЗВОДНОЕ ФРАНЦУЗСКОГО СЛОВА DROGUE (СУХАЯ ТРАВА):

- любое вещество, которое может быть использовано с целью:
- 1) диагностики,
- 2) профилактики,
- 3) облегчения или лечения заболеваний человека или животных,
- 4) регуляции рождаемости.



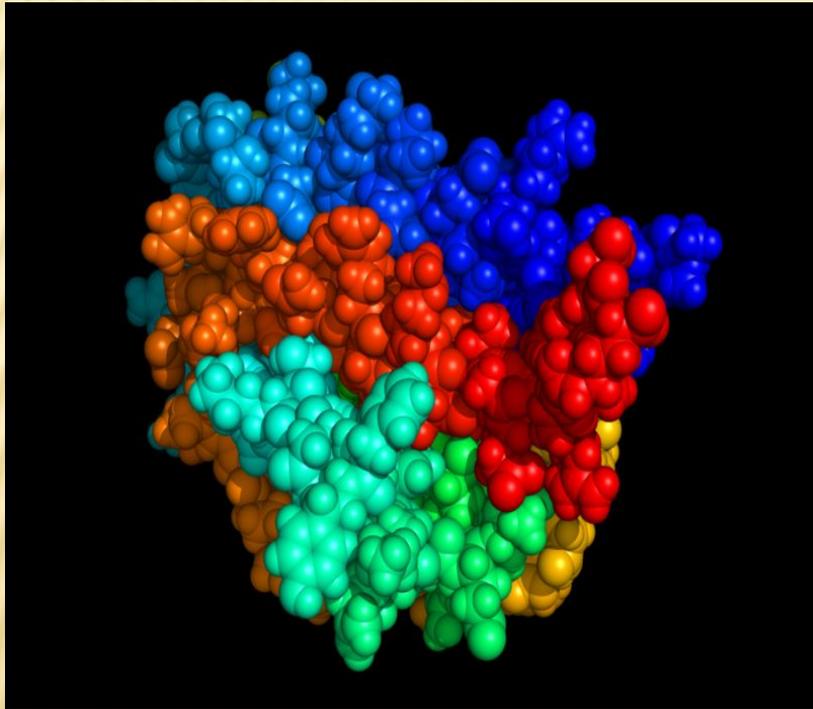
- Фармакология - это наука о лекарственных препаратах, используемых в медицине с различными целями
- Лекарственный препарат** - дозированное лекарственное средство - дозированное лекарственное средство в определенной лекарственной форме. Министерство Здравоохранения Российской Федерации
- Приказ от 29 февраля 2000 г.
N 82

По определению ВОЗ, лекарственным является любое вещество или продукт, который может быть использован или используется для исследования изменения физиологических систем или патологических процессов с пользой для реципиента.

Цель фармакологии- поиск средств для лечения, профилактики и диагностики заболеваний.

Задача - создание новых высокоактивных селективных ЛС на основе продуктов химического синтеза, генной инженерии, биотехнологии, нанотехнологии сырья природного происхождения (растения, ткани животных, минералы, продукты жизнедеятельности микроорганизмов и грибов) с последующим внедрением их в практическую медицину.

НАПРИМЕР СОЗДАНИЕ ГЕННО ИНЖЕНЕРНОГО ЭРИТРОПОЭТИНА



ПРЕДМЕТ ФАРМАКОЛОГИИ :

изучение механизмов взаимодействия лекарственных, с биологическими системами (организмом человека, животных) и возникающих при этом фармакодинамических эффектов.

□ Лекарственные вещества влияют на различные физиологические, патофизиологические и биохимические процессы, происходящие в организме человека. Это влияние называется механизмом действия. Подавляющее большинство лекарств оказывает лечебное действие путем изменения деятельности физиологических систем клеток, которые вырабатывались у организма в процессе эволюции.

□ Под влиянием лекарственного вещества в организме, как правило, не возникает новый тип деятельности клеток, лишь изменяется скорость протекания различных естественных процессов. Торможение или возбуждение физиологических процессов приводит к снижению или усилению соответствующих функций тканей организма.

ЛЕКАРСТВА МОГУТ ВОЗДЕЙСТВОВАТЬ

на различные ферменты, угнетая или стимулируя их (так работают, например, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента - каптоприл, эналаприл и др.), могут воздействовать на активные химические соединения, например, на т. н. медиаторы воспаления (так действует кислота ацетилсалициловая, вольтарен), могут работать по механизму "конкурентного антагонизма". Так функционируют бета-адреноблокаторы (анаприлин, атенолол).

ФАКТОРЫ, КОЛИЧЕСТВЕННО И КАЧЕСТВЕННО ИЗМЕНЯЮЩИЕ ЭФФЕКТ ЛЕКАРСТВ

- ❑ Особенности индивидуальной фармакокинетики лекарств.
- ❑ Время приёма лекарств в зависимости от приёма и характера пищи, влияния факторов внешней среды.
- ❑ Генетические факторы, влияющие на биоусвояемость и эффективность лекарств.
- ❑ Лекарственное взаимодействие при приёме нескольких лекарств.
- ❑ Сопутствующие патологические изменения в органах (печень, почки, желудочно-кишечный тракт).
- ❑ Чувствительность больного к лекарству.
- ❑ Приверженность больного назначаемому врачом лечению.

ЕСТЕСТВЕННО-НАУЧНАЯ ОСНОВА

ФАРМАКОЛОГИИ

▣ физиология, фармакогнозия, патология, патофизиология, микробиология, биохимия, фарм.химия, технология готовых лекарственных форм, философия и др.

Без познания этих дисциплин невозможно правильно ориентироваться в тех или иных процессах, которые протекают в организме человека и животных.

ФАРМАКОЛОГИЯ ЯВЛЯЕТСЯ ОСНОВОЙ

современной терапии (греч. *therapia* — лечение), включающей различные клинические дисциплины — внутренние болезни, хирургию, акушерство и гинекологию, психиатрию, инфекционные болезни, фито терапию, клиническую фармакологию и др.

Терапия (синоним: *лечение*) — процесс, целью которого является облегчение, снятие или устранение **СИМПТОМОВ**) — процесс, целью которого является облегчение, снятие или устранение симптомов и проявлений того или иного **заболевания**) — процесс, целью которого является облегчение, снятие или устранение симптомов и проявлений того или иного заболевания, патологического состояния или иного нарушения **жизнедеятельности**) —

ВАЖНЕЙШИЕ ПРИНЦИПЫ МЕДИЦИНЫ

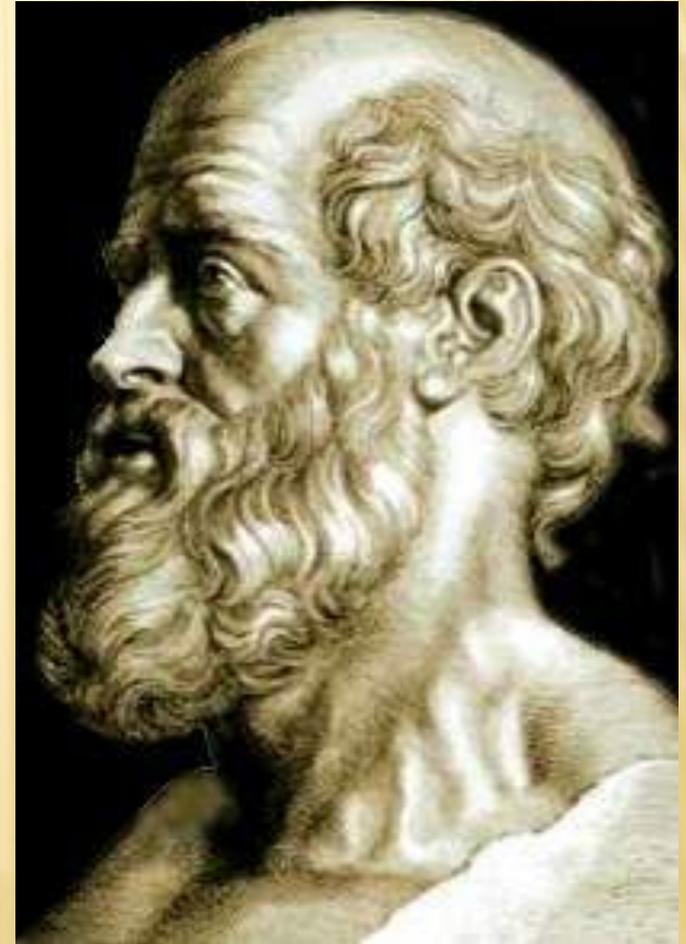
“Primum non nocere “

(Прежде всего – не навреди) и

“ Natura sanat, medikus curat morbos “

(Природа оздоравливает, врач лечит болезни).

Эти принципы отражают заложенную в организме способность бороться с болезнью.



Гиппократ

ГИППОКРАТ

- Гиппократ древнегреческий врач, реформатор античной медицины. Медицинское образование получил под руководством своего отца Гераклида. Гиппократ вёл жизнь странствующего врача (периодевта) в Греции, Малой Азии, Ливии; посетил берега Чёрного моря, был у скифов, что позволило ему ознакомиться с медициной народов Передней Азии и Египта. Сочинения, дошедшие до нас под именем Гиппократа, представляют собой сборник из 59 сочинений различных авторов, собранных воедино учёными Александрийской библиотеки. Самому Гиппократу приписывают чаще всего следующие сочинения: «О воздухе, воде и местности», «Прогностика», «Диета в острых болезнях», 1-я и 3-я книга «Эпидемии», «Афоризмы», «Вправление сочленений», «Переломы», «Раны головы».
- Заслугой Гиппократа было освобождение медицины от влияний жреческой, храмовой медицины и определение пути её самостоятельного развития. Гиппократ учил, что врач должен лечить не болезнь, а больного, принимая во внимание индивидуальные особенности организма и окружающую среду.

ГИППОКРАТ

- Он исходил из мысли об определяющем влиянии на формирование телесных (конституция) и душевных (темперамент) свойств человека факторов внешней среды. Гиппократ выделял эти факторы (климат, состояние воды, почвы, образ жизни людей, законы страны и пр.) с точки зрения их влияния на человека. Гиппократ явился родоначальником медицинской географии. Различал по темпераменту 4 основных типа людей – сангвиники, холерики, флегматики и меланхолики. Разрабатывал вопросы этиологии, отрицая при этом сверхъестественное, божественное происхождение болезней. Установил основные стадии развития болезни, разрабатывал вопросы диагностики. Выдвинул 4 принципа лечения: приносить пользу и не вредить, противоположное лечить противоположным, помогать природе и, соблюдая осторожность, щадить больного.
- Гиппократ известен и как выдающийся хирург; разработал способы применения повязок, лечение переломов и вывихов, ран, фистул, геморроя, эмпием. Гиппократу приписывают текст так называемой врачебной клятвы («клятва Гиппократа»), сжато формулирующей моральные нормы поведения врача (хотя первоначальный вариант клятвы существовал ещё в Египте). Гиппократа называют «отцом медицины».

ВИДАЫ ТЕРАПИИ:

- фармакотерапия — лечение лекарственными веществами;
- химиотерапия — лечение химическими ядами или токсинами, убивающими возбудителей болезни или злокачественные клетки;
- психотерапия — лечение словом, внушением, изменением восприятия или поведения;
- физиотерапия — лечение физическими воздействиями и процедурами, например токами или теплом;
- радиотерапия радиотерапия, или лучевая терапия, в частности рентгенотерапия радиотерапия, или лучевая терапия, в частности рентгенотерапия и телегамматерапия — лечение ионизирующими

РАЗДНЛЫ ФАРМАКОЛОГИИ

Токсикология, витаминология,
эндокринология, химиотерапия,
клиническая, санитарная,
военная, космическая и др.

Теоретическая фармакология.

Экспериментальная

фармакология:

физиологическая,

биохимическая.

ТОКСИКОЛОГИЯ

Наука, изучающая ядовитые ~~Наука,~~
изучающая ядовитые,
токсичные ~~Наука, изучающая~~
ядовитые, токсичные и вредные
вещества, потенциальную
опасность их воздействия на
организмы ~~Наука, изучающая~~
ядовитые, токсичные и вредные
вещества, потенциальную
опасность их воздействия на
организмы и экосистемы,

ВИДЫ ТОКСИКОЛОГИ

- 1 Клиническая
- 2 Профилактическая
- 3 Экологическая
- 4 Теоретическая
- 5 Токсикодинамика

ТЕОРЕТИЧЕСКАЯ

ФАРМАКОЛОГИЯ

Занимается обоснованием разрабатываемых или используемых методов исследования, предназначенных для поиска, новых биологически активных соединений и рационального применения известных ЛП, а также созданием теорий и концепций относительно механизмов избирательного фармакотерапевтического действия ЛВ

Теоретическая фармакология

занимается обоснованием
разрабатываемых или используемых
методов исследования,
предназначенных для поиска, новых
биологически активных соединений и
рационального применения известных
ЛП, а также созданием теорий и
концепций относительно механизмов
избирательного
фармакотерапевтического действия ЛВ.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ

Изучает влияние биологически

активных веществ и ЛВ в условиях эксперимента, выполняет роль связующего звена между теоретической и клинической фармакологией. Она составляет основу имеющихся достижений в области фармакологии. Более того, "экспериментальное направление фармакологии, — отмечал Н.П. Кравков, - для научной медицины имеет первостепенное значение и ценность".



НАУЧНЫЕ НАПРАВЛЕНИЯ

хронофармакология,
фармакогенетика,
иммунофармакология,
возрастная фармакология,
радиационная,
космическая фармакология.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

От греч. *pharmakon* - лекарство и *kinetikos* - приводящий в движение, изучает кинетические закономерности процессов, происходящих с лекарством в организме. Предметом фармакинетики является изучение процессов всасывания, распределения, связывания с белками, биотрансформации и выведения лекарственных веществ. Определение фармакокинетических характеристик новых лекарственных веществ является важной частью их доклинического и клинического испытания.

ПРОВОДЯТСЯ

Специалистами в области аналитической химии, провизорами, фармацевтами, биологами. На основании данных о фармакокинетике того или иного препарата определяют дозы, оптимальный путь введения, режим применения препарата и продолжительность лечения. Регулярный контроль содержания лекарственных средств в биологических жидкостях позволяет своевременно корректировать лечение.

Фармакокинетические исследования необходимы при разработке новых препаратов, их лекарственных форм, а также при экспериментальных и клинических испытаниях лекарственных средств

ПАРАМЕТРЫ ФАРМАКИНЕТИКИ

Константы скорости элиминации (K_{el}), абсорбции (K_a) и экскреции (K_{ex}) характеризуют соответственно скорость исчезновения препарата из организма путем биотрансформации и выведения, скорость поступления его из места введения в кровь и скорость выведения с мочой, калом, слюной и др.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) — время, необходимое для уменьшения вдвое концентрации препарата в крови, зависит от константы скорости элиминации ($T_{1/2} = 0,693/K_{el}$)

Период полуабсорбции ($T_{1/2,a}$) — время, необходимое для всасывания половины дозы препарата из места введения в кровь, пропорционален константе скорости абсорбции ($T_{1/2,a} = 0,693/K_a$).

РАСПРЕДЕЛЕНИЕ ПРЕПАРАТА В ОРГАНИЗМЕ ХАРАКТЕРИЗУЮТ

□ Период полураспределения ($T_{1/2,a}$) — время, необходимое для достижения концентрации препарата в крови, равной 50% от равновесной, т.е. при наличии равновесия между кровью и тканями. Кажущаяся начальная концентрация (C_0) — концентрация препарата, которая была бы достигнута в плазме крови при внутривенном его введении и мгновенном распределении по органам и тканям.

Равновесная концентрация (C_{ss}) — концентрация препарата, которая установится в плазме (сыворотке) крови при поступлении препарата в организм с постоянной скоростью. При прерывистом введении (приеме) препарата через одинаковые промежутки времени в одинаковых дозах выделяют максимальную (C_{ssmax}) и минимальную (C_{ssmin}) равновесные концентрации.

Объем распределения препарата (V_d) характеризует степень его захвата тканями из плазмы (сыворотки) крови. V_d ($V_d = D/C_0$) — условный объем жидкости, в котором нужно растворить всю попавшую в организм дозу препарата (D), чтобы получилась концентрация, равная кажущейся начальной концентрации в сыворотке крови (C_0).

ОБЩИЙ КЛИРЕНС ПРЕПАРАТА (CLT)

Характеризует скорость “очищения” организма от лекарственного препарата. Выделяют почечный (Cl_r) и внепочечный (Cl_{er}) клиренсы, которые отражают выведение лекарственного вещества соответственно с мочой и другими путями (прежде всего с желчью). Общий клиренс является суммой почечного и внепочечного клиренса.

ПЛОЩАДЬ ПОД КРИВОЙ “КОНЦЕНТРАЦИЯ – ВРЕМЯ” (AUC)

Площадь фигуры, ограниченной фармакокинетической кривой и осями координат ($AUC = C_0/K_{el}$). Величина (AUC) связана с другими фармакокинетическими параметрами — объемом распределения, общим клиренсом. При линейности кинетики препарата в организме величина AUC пропорциональна общему количеству (дозе) препарата, попавшего в системный кровоток. Часто определяют площадь под частью кривой (от нуля до некоторого времени t); этот параметр обозначают AUC_t , например, площадь под кривой от 0 до 8 ч — AUC_8 .

АБСОЛЮТНАЯ БИОДОСТУПНОСТЬ

(F)

Часть дозы препарата (в %), которая достигла системного кровотока после внесосудистого введения, равна отношению AUC после введения исследуемым методом (внутрь, в мышцу и др.) к AUC после внутривенного введения.

Относительная биодоступность

определяют для сравнения биодоступности двух лекарственных форм для внесосудистого введения. Она равна отношению $(AUC'/AUC)(D/D')$ после введения двух сравниваемых форм.

Общая биодоступность — часть принятой внутрь дозы препарата, которая достигла системного кровотока в неизмененном виде и в виде метаболитов, образовавшихся в процессе всасывания в результате так называемого пресистемного метаболизма, или “эффекта первичного прохождения”.

- **Фармакодина́мика** — раздел фармакологии, изучающий биохимические эффекты и физиологические действия лекарств на тело человека, на микроорганизмы или паразитов, находящихся внутри тела человека или снаружи. Она также изучает механизмы действия лекарств, связь между концентрацией лекарственных веществ и достигнутым ими действием.
- Достигаемые эффекты выражают в виде уравнения $L + R \leftrightarrow L^*R$, где L — это лиганд (лекарство), R — это рецептор (место приложения действия). Иногда говорят, что фармакодинамика — это наука о действии

Достигаемые эффекты выражают
в виде уравнения $L + R \leftrightarrow L^*R$,
где L — это лиганд (лекарство),
 R — это рецептор (место
приложения действия).

Иногда говорят, что
фармакодинамика — это наука о
действии лекарства на тело
человека

Отмечают 5 эффектов, оказываемых
лекарственными средствами:

подавляющее,

стимулирующее,

разрушающее клетки
(цитотоксическое),

раздражающее,

замещающее недостающие вещества.

Лекарственные вещества оказывают как желательные, так и нежелательные действия. К числу первых относят:

1.нарушение клеточных мембран.

2.химические реакции.

3.взаимодействие с ферментными белками.

4.взаимодействие со структурными белками.

5.взаимодействие с белками-переносчиками.

6.взаимодействие с ионными каналами.

Задачи фармакологии:

- 1) испытания новых фармакологических средств;
- 2) разработка методов наиболее эффективного и безопасного применения лекарственных препаратов;
- 3) клинические исследования и переоценка старых препаратов;
- 4) информационное обеспечение и консультативная помощь медицинским работникам.

Разработка новых лекарственных средств

осуществляется совместными усилиями многих отраслей науки, при этом основная роль принадлежит специалистам в области химии, фармакологии, фармации. Создание нового лекарственного средства представляет собой ряд последовательных этапов, каждый из которых должен отвечать определенным положениям и стандартам, утвержденным государственными учреждениями Фармакопейным Комитетом, Фармакологическим Комитетом, Управлением МЗ РФ по внедрению новых лекарственных средств.

ЭТАПЫ СОЗДАНИЯ НОВЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

Процесс создания новых лекарственных средств выполняется в соответствии с международными стандартами GLP (Good Laboratory Practice Качественная лабораторная практика), GMP (Good Manufacturing Practice Качественная производственная практика) и GCP (Good Clinical Practice Качественная клиническая практика).

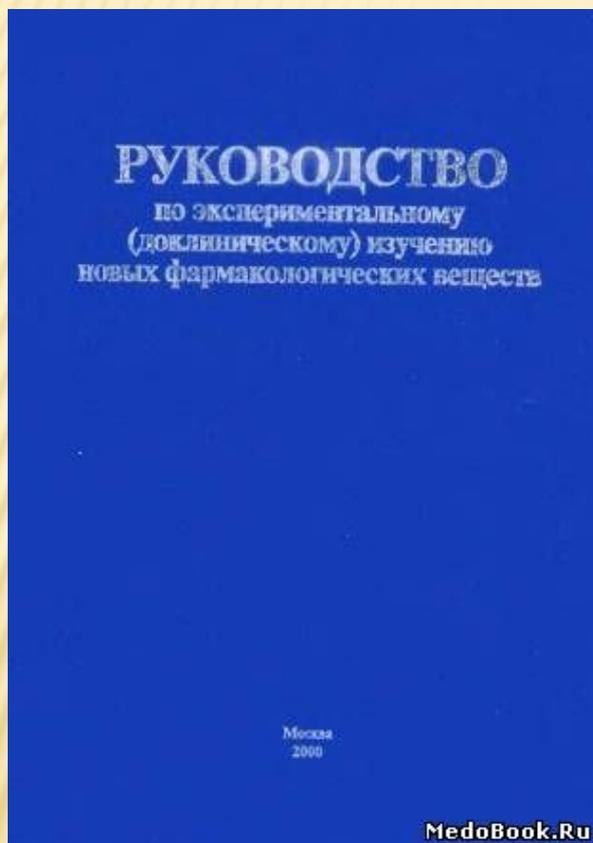
Знаком соответствия разрабатываемого нового лекарственного средства этим стандартам является официальное разрешение процесса их дальнейшего исследования IND (Investigation New Drug).

Получение новой активной субстанции (действующего вещества или комплекса веществ) идет по трем основным направлениям.

Химический синтез лекарственных веществ

- **Эмпирический путь: скрининг, случайные находки;**
- **Направленный синтез: воспроизведение структуры эндогенных веществ, химическая модификация известных молекул;**
- **Целенаправленный синтез (рациональный дизайн химического соединения), основанный на понимании зависимости «химическая структура фармакологическое действие».**

Эмпирический путь (от греч. *empeiria* — опыт) создания лекарственных веществ основан на методе «проб и ошибок», при котором фармакологи берут ряд химических соединений и определяют с помощью набора биологических тестов (на молекулярном, клеточном, органном уровнях и на целом животном) наличие или отсутствие у них определенной фармакологической активности.



ГЛАВА I. Нормативные правовые акты, регламентирующие доклинические исследования безопасности и эффективности фармакологических веществ в Российской Федерации
Федеральный закон «О лекарственных средствах» (Ст. 36) Приказ Минздрава России № 267 от 19 июня 2003 г

ГЛАВА II. Доклинические исследования безопасности лекарственных средств

ГЛАВА III. Доклинические исследования эффективности лекарственных средств

Методические указания по проведению доклинических исследований фармакокинетики фармакологических веществ и лекарственных средств **Часть 1. Доклинические исследования эффективности лекарственных средств, предназначенных для лечения заболеваний центральной и периферической нервной системы.**

Часть 2. Доклинические исследования эффективности лекарственных средств, предназначенных для лечения заболеваний сердечно-сосудистой системы.

Часть 3. Доклинические исследования эффективности лекарственных средств, предназначенных для лечения заболеваний системы органов дыхания.

Часть 4. Доклинические исследования эффективности химиотерапевтических лекарственных средств.

Часть 5. Доклинические исследования эффективности лекарственных средств разных фармакотерапевтических групп.

Часть 6. Методические указания по подготовке регистрационного досье

ИСТОРИЯ ФАРМАКОЛОГИИ

АВИЦЕННА (ИБН СИНА)

Величайшим творением Ибн Сины, принесшим ему мировую славу, является медицинский трактат «Ал-Канун фи-Тибб» («Канон врачебной науки»).



□ Основоположниками Т.
в России были А. П.
Нелюбин (1785— 1858)
и Е. В. Пеликан
(1824—1884).



- Нелюбин Александр Петрович - академик (1785 - 1858), доктор медицины и хирургии. Окончил курс Императорского медико-хирургической академии, был там же профессором фармации.



- Главная заслуга **Е. В. Пеликана** состоит в его многочисленных научных трудах по токсикологии, судебной медицине, гигиене, эпидемиологии и др. предметам. Работы его, большая часть которых основывалась на многочисленных физиологических опытах, сильно способствовали развитию названных наук, давая в то же время ценный материал по физиологии, химии и эпидемиологии.

НИКОЛАЙ ИВАНОВИЧ ПИРОГОВ



Значение деятельности Пирогова состоит в том, что своим самоотверженным и часто бескорыстным трудом он превратил хирургию в науку, вооружив врачей научно обоснованной методикой оперативного вмешательства.

ученый сделал еще одно открытие - предложил совершенно новый способ бальзамирования умерших. премия и медаль его имени за достижения в области анатомии и хирургии.



▣ **Аничков Сергей Викторович (1892-1982) – ведущий советский фармаколог, академик АМН СССР (1950), Герой Социалистического Труда (1967), почётный доктор университетов многих стран мира. впервые в мире (1919-1924) использовал изолированные органы для изучения фармакологии сосудов; провёл исследования по физиологии и биохимии каротидных химиорецепторов. Мировую известность получила его работа по изучению действия строфантина на сердечно-лёгочный препарат. Он синтезировал такие препараты, как: дибазол, сигетин, бензогексоний, этимизол, метамизил**

▣

Впервые в мире (1919-1924) использовал изолированные органы для изучения фармакологии сосудов; провёл исследования по физиологии и биохимии каротидных химиорецепторов. Мировую известность получила его работа по изучению действия строфантина на сердечно-лёгочный препарат. Он синтезировал такие препараты, как: дибазол, сигетин, бензогексоний, этимизол, метамизил

Фармаколог, академик АМН СССР (1952). Окончил Военно-медицинскую академию в 1926, ученик Н. П. Кравкова. Основные работы посвящены фармакологии нервной, сердечно-сосудистой и дыхательной систем, общей фармакологии, промышленной токсикологии. Создал школу фармакологов. Председатель Всесоюзного фармакологического общества.



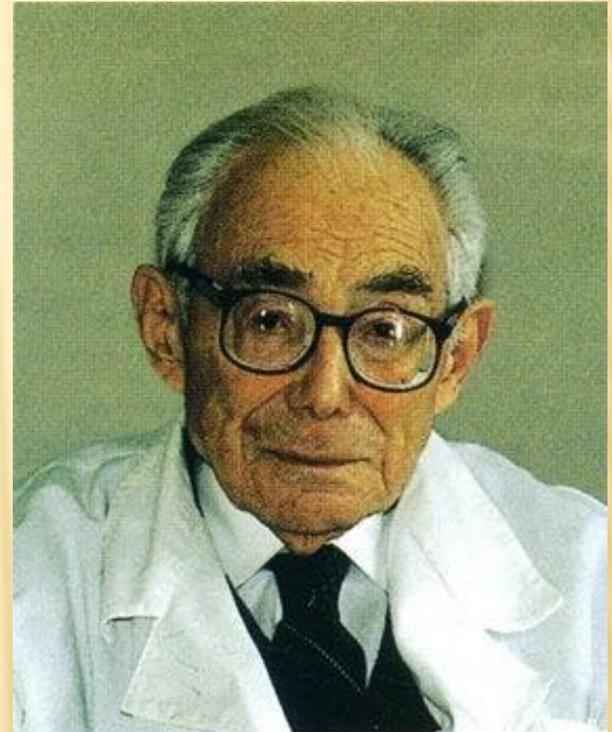
ЗАКУСОВ — Василий
Васильевич (1903 - 86)



Около полувека Павел Васильевич посвятил изучению токсичности и органотропности контрастных средств, а также созданию новых препаратов для рентгенодиагностики и магнитно-резонансной томографии.

Михаи́л Давы́дович

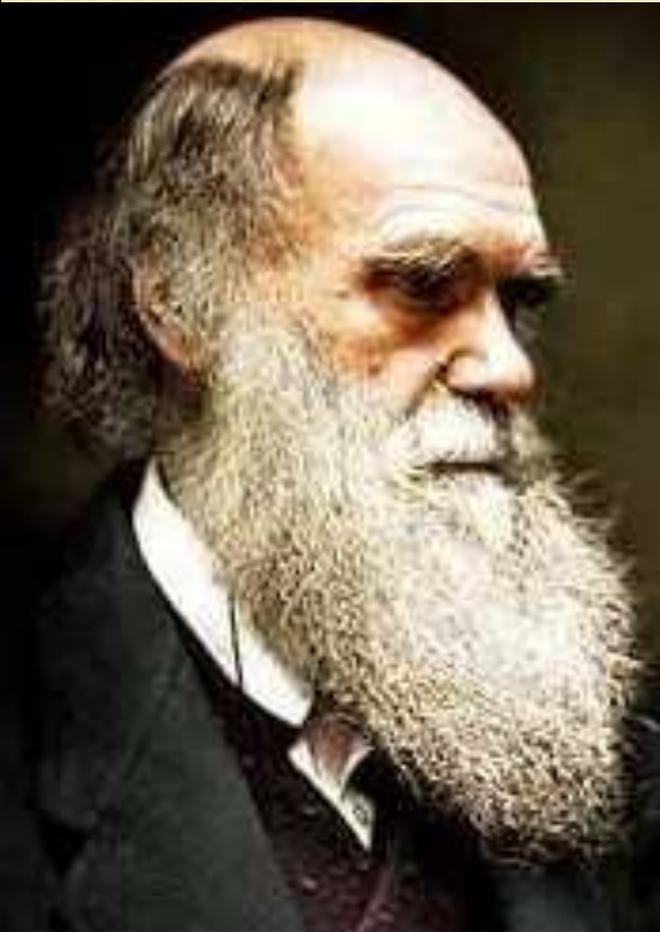
Машко́вский (— советский (— советский учёный (— советский учёный, академик (— советский учёный, академик РАМН (— советский учёный, академик РАМН, один из основоположников отечественной фармакологии (— советский учёный, академик РАМН, один из основоположников отечественной фармакологии, выдающийся специалист в области создания лекарственных средств, автор



Мендель, Грегор Иоганн

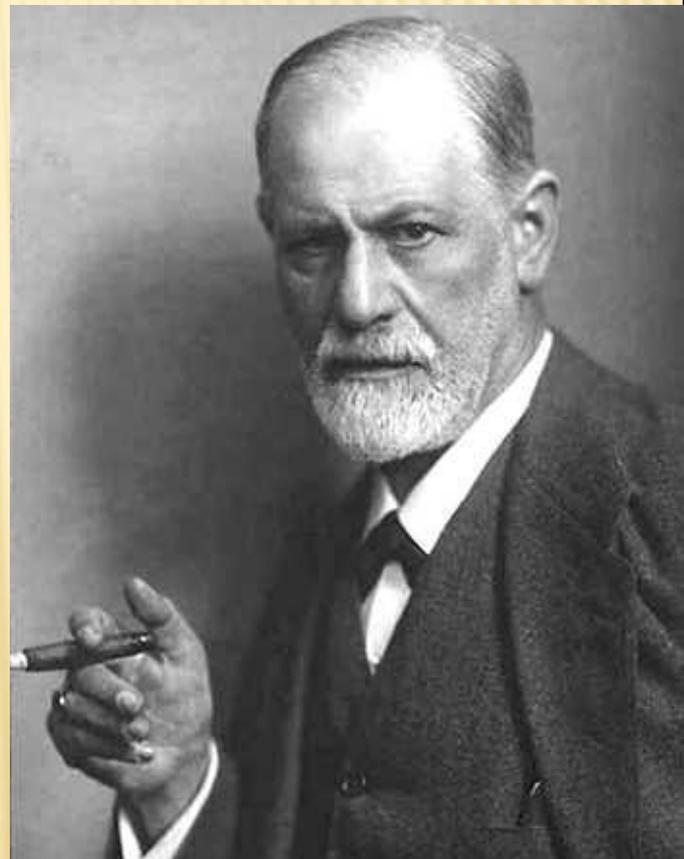
(Mendel, Gregor Johann) (1822–1884), австрийский биолог, основоположник генетики. Он впервые применил количественные методы, основанные на точном подсчете большого числа потомков с контрастирующими вариантами признаков. Г. Мендель выдвинул и экспериментально обосновал гипотезу о наследственной передаче дискретных наследственных факторов. В его работах, выполненных в период с 1856 по 1863 г., были раскрыты основы законов наследственности. Результаты своих наблюдений Г. Мендель изложил в брошюре «Опыты над растительными гибридами» (1865).

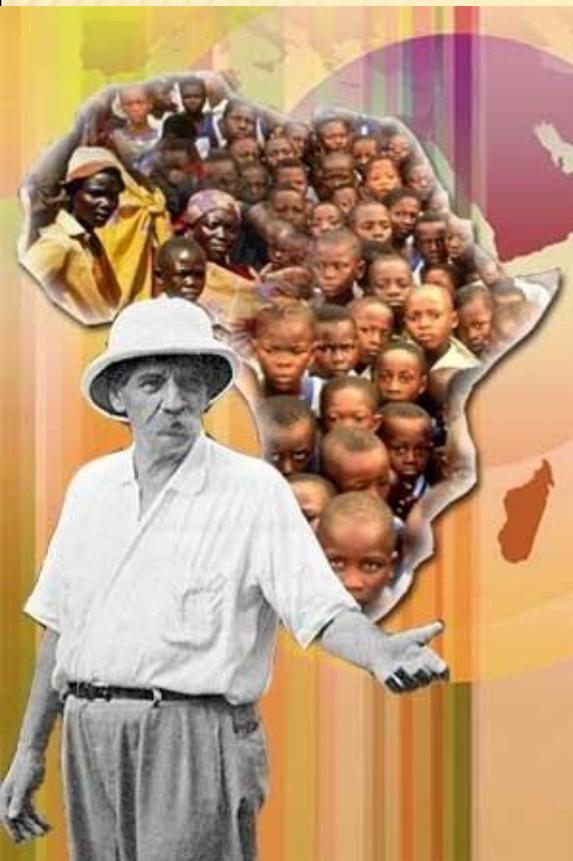




- **Чарлз Рóберт Дáрвин** (англ. Charles Robert Darwin; 1809; 1809—1882; 1809—1882) — английский натуралист и путешественник, заложивший основы современной эволюционной теории; 1809—1882) — английский натуралист и путешественник, заложивший основы современной эволюционной теории и направления эволюционной мысли, носящего его имя (дарвинизм). Он объяснил приспособленность живых организмов к условиям их существования и увеличение

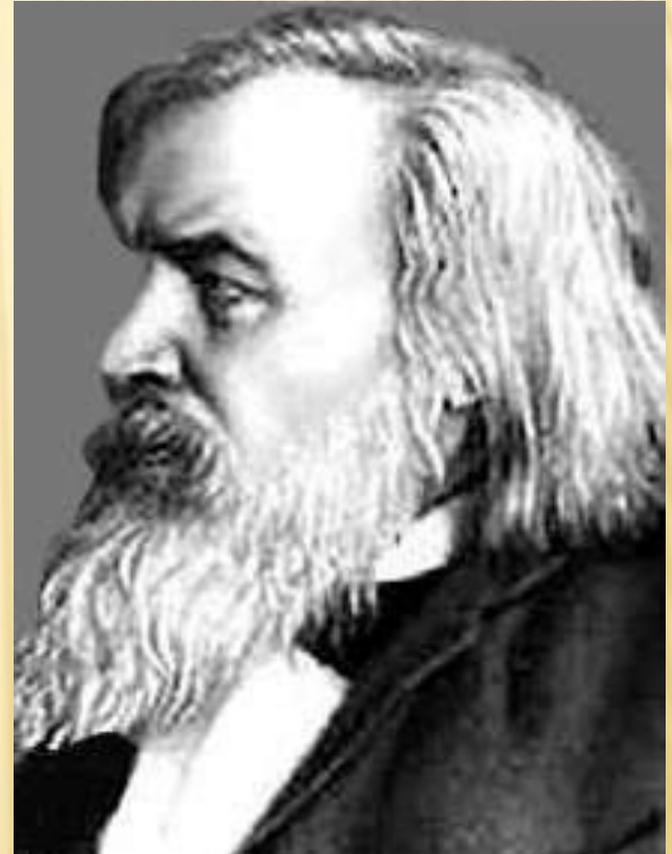
□ **Зигмунд Фрейд (Фройд)** (нем. *Sigmund Freud*, полное имя: **Сигизмунд Шломо Фрейд; 6 мая; 6 мая 1856; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор), Чехия; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор), Чехия — 23 сентября; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор), Чехия — 23 сентября 1939; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор), Чехия — 23 сентября 1939, Лондон; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор), Чехия — 23 сентября 1939, Лондон) — австрийский; 6 мая 1856, Фрайберг (ныне Пршибор), Чехия — 23 сентября 1939, Лондон) — австрийский**





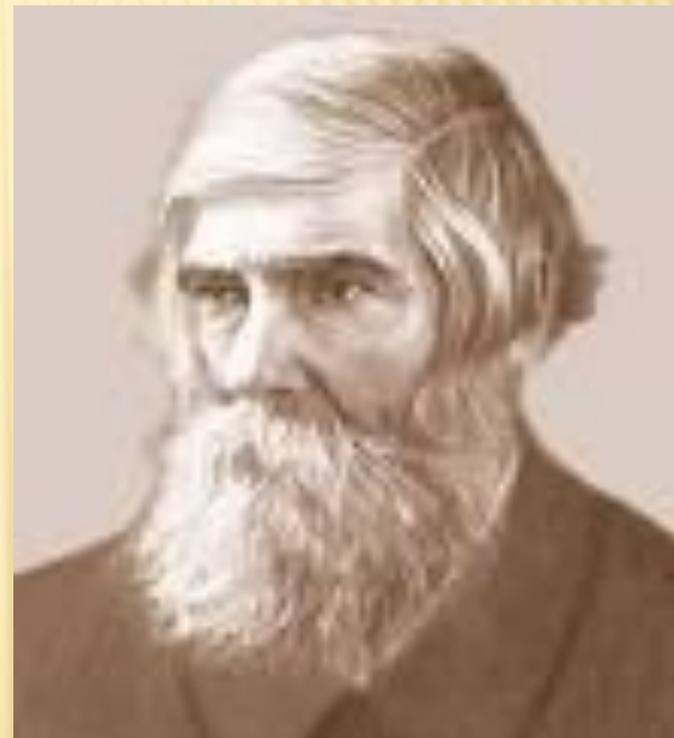
- ▣ **Альберт Швейцер** (нем. *Albert Schweitzer*, 14 января, 14 января 1875, 14 января 1875, Кайзерсберг, 14 января 1875, Кайзерсберг, Верхний Эльзас, 14 января 1875, Кайзерсберг, Верхний Эльзас — 4 сентября, 14 января 1875, Кайзерсберг, Верхний Эльзас — 4 сентября 1965, 14 января 1875, Кайзерсберг, Верхний Эльзас — 4

□ **Дмі́трий Ива́нович Менделеев** (27 январа (8 февраля) (27 январа (8 февраля) 1834 (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) 1907 (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) 1907, Санкт-Петербург (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) 1907, Санкт-Петербург) — **русский**

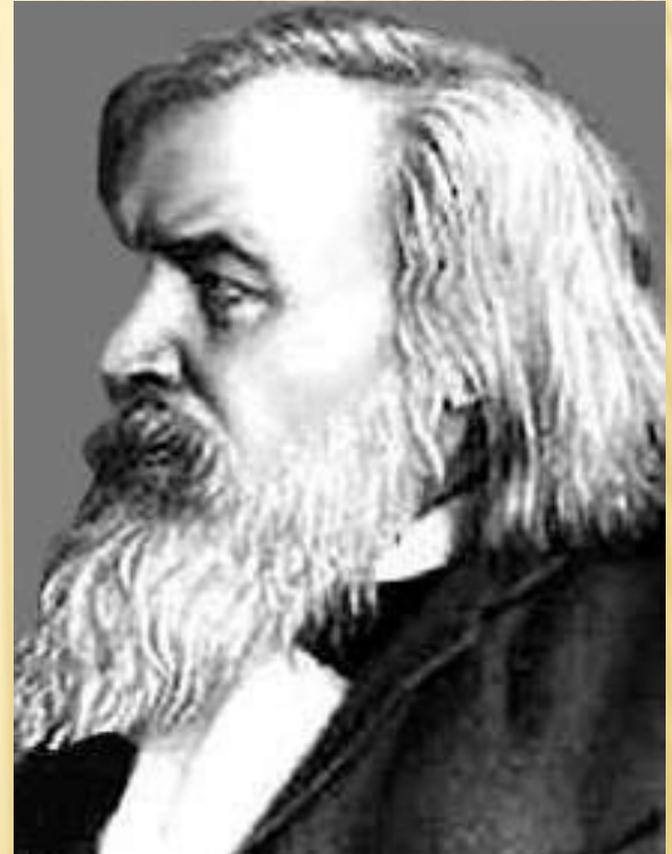


Владимир Михайлович

Бехтерев 12.01.1857, Вятской губернии, российский невропатолог, психиатр, психолог, физиолог и морфолог. В 1878 году окончил Медико-хирургическую академию; с 1885 года - заведующий кафедрой психиатрии Казанского университета, где Бехтерев впервые создал психофизиологическую лабораторию, основал (1893) журнал "Неврологический вестник" и Казанское общество невропатологов и психиатров.



□ **Дмі́трий Ива́нович Менделеев** (27 январа (8 февраля) (27 январа (8 февраля) 1834 (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) 1907 (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) 1907, Санкт-Петербург (27 январа (8 февраля) 1834, Тобольск — 20 январа (2 февраля) 1907, Санкт-Петербург) — **русский**



ИЛЬЯ ИЛЬИЧ МЕЧНИКОВ



- Его по праву называют одним из основоположников эволюционной эмбриологии и микробиологии; он был учителем многих русских биологов и практически всех русских микробиологов. Не будучи врачом, Мечников обогатил медицину многими открытиями, создав сравнительную патологию воспаления и фагоцитарную теорию иммунитета.

ИВАН СЕЧЕНОВ

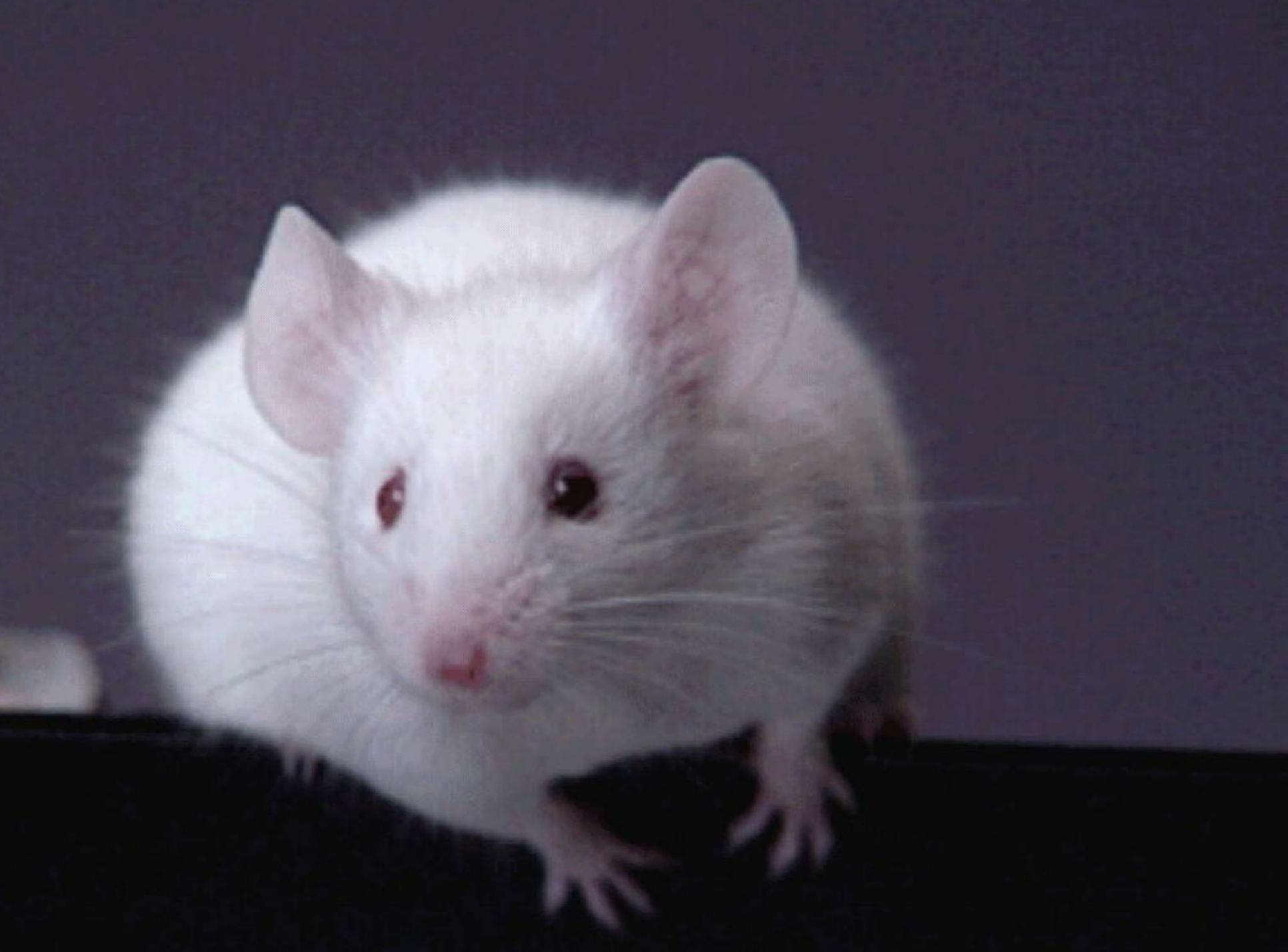


- выдающийся русский физиолог выдающийся русский физиолог и мыслитель-материалист выдающийся русский физиолог и мыслитель-материалист, создатель физиологической школы, член-корреспондент выдающийся русский физиолог и мыслитель-материалист, создатель физиологической школы, член-корреспондент (1869) выдающийся русский физиолог и мыслитель-материалист, создатель физиологической школы, член-корреспондент (1869), почётный член (1904) выдающийся русский физиолог и мыслитель-материалист, создатель физиологической школы, член-корреспондент (1869), почётный член (1904) Петербургской Академии Наук.
- В своём классическом труде «Рефлексы головного мозга» (1863) обосновал рефлекторную природу сознательной и бессознательной деятельности, доказав, что в основе всех психических явлений лежат физиологические процессы, которые могут

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ









ЖИВОТНОЕ	ИММОБИЛИЗАЦИЯ	ОБЩАЯ АНЕСТЕЗИЯ
Крыса	1 – 4 мг/100 г	2 – 5 мг/100 г
Хомяк	1 – 3 мг/100 г	3 – 8 мг/100 г
Мышь	8 – 10 мг/100 г	10 – 18 мг/100 г
Морская свинка	1 – 2 мг/100 г	3 – 4 мг/100 г
Кролик	2 - 3 мг/100 г	3 – 5 мг/100 г
Песчанка	0,5 – 1 мг/100 г	1 – 2 мг/100 г

















Рис. 3. Фиксация
мышы.

