



ФАРМАКОЛОГИЯ



ТЕМА

Введение. Общая фармакология

лекция



ФАРМАКОЛОГИЯ



Цель - Сформировать знания студентов о разделах общей фармакологии: фармакокинетики и фармакодинамике.

Задачи:

Учебные - изучить пути введения и выведения лекарственных веществ, выделить виды действия и взаимодействия лекарственных веществ, изучить дозы и концентрации, виды осложнений при применении лекарственных препаратов ((ПК 2.3.)

Развивающие - развивать стремление к расширению своих профессиональных знаний (ОК.8)

Воспитательные - развивать аккуратность, добросовестность, интерес к профессии, интеллект, трудолюбие, стремление брать на себя ответственность за результат выполнения заданий.(ОК.7)



ФАРМАКОЛОГИЯ



Изучаемые вопросы

ОБЩАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ

- 1. Фармакокинетика**
- 2. Фармакодинамика**



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакология (от греч. *pharmakon* – лекарство, яд; и *logos* – учение) – это наука о взаимодействии лекарственных веществ с биологическими системами.

Задачи фармакологии -

1. Создание и обоснование рационального применения новых лекарственных средств.
2. Изучение новых свойств уже известных лекарственных препаратов.



ФАРМАКОЛОГИЯ



История фармакологии (когда, кто, что, где...)

до XIX века – «лекарь у постели больного»

Гиппократ (460 – 377 гг до нэ) описал более 200 лекарственных растений и способов их применения. Первым призвал лекарей лечить не болезнь, а больного человека.

Клавдий Гален (129 – 201 гг) – основатель «аптекарской» фармакологии. Широко применял настои, вытяжки лекарственных растений. Эти препараты получили название «галеновые».

Авиценна (980 – 1037 гг) – среднеазиатский медик эпохи средневековья. Также работал с травами, но добавлял туда минералы. Его главный труд – «Канон врачебной науки».

Луи Пастер – французский учёный, создатель вакцин (оспа, полиомиелит, гепатит, корь и т.д.)

Вакцина (греч. "vaccīna" – коровья) – жидкость, в которой содержатся ослабленные микробы и их яды.

Эдуард Дженнер – врач, первым прививший оспу 8-ми летнему мальчику.

Пауль Эрлих – основоположник химиотерапии. В 1909 г. синтезировал сальварсан – средство против сифилиса.

Александр Флеминг – синтезировал антибиотик пенициллин из грибка рода *Penicillium*.





ФАРМАКОЛОГИЯ



История фармакологии (когда, кто, что, где...)

XIX-XX вв. – «врачи-экспериментаторы»

Середина 19 в. - начало 20 в. - начало экспериментальной фармакологии - Р. Бухгейм (г.Дерпт, Россия), Н.П.Кравков, И.П.Павлов (ВМА, Россия) + О.Шмидеберг, Г.Мейер, В.Штрауб, К.Шмидт (Германия), А.Кешни, А.Кларк (Великобритания), Д.Бове (Франция), К. Гейманс (Бельгия), О.Леви (Австрия) и др.

**XX-XXI вв. - производители (фарм. фирмы),
НИИ, вузы, лаборатории
Драг-дизайн, ICH - GLP, GCP.**

**Регуляция и контроль:
государство и потребители**





ФАРМАКОЛОГИЯ



Терминология (язык фармакологии)

Лекарственное вещество (ЛВ, «субстанция») – химическое вещество для фармакотерапии, диагностики, фармакопрофилактики, предупреждения беременности и ведения родов.

Лекарственное средство (ЛС, «фармакологический агент») – ЛВ или комбинация ЛВ и других веществ любого производителя.

Лекарственный препарат (ЛП, «упаковка») – ЛС, зарегистрированное конкретным производителем в определенной лекарственной форме и дозе

Лекарство (drug) – устаревшее собирательное обозначение ЛВ, ЛС и ЛП.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Терминология (язык фармакологии)

Драг-дизайн – процесс создания ЛП

Бренд (оригинальный ЛП) – впервые предложенный, общеизвестный ЛП.

Генерик – воспроизведенный ЛП, обычно «биоэквивалентный» бренду.

МНН - международное непатентованное наименование ЛС (химическое).



ФАРМАКОЛОГИЯ



НАЗВАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

1. **Химическое название** - отражает состав и структуру ЛВ. (например: 5-этил-5-фенилбарбитуровая кислота)
2. **Международное непатентованное название** (МНН, International Nonproprietary Name, INN, генерическое) - это название лекарственного вещества, рекомендованное ВОЗ, принятое для идентификации по принадлежности к определенной фармакологической группе и с целью избежать предвзятость и путаницу. Как правило, отражает химическое строение лекарственного вещества, например: ацетилсалициловая кислота.
3. **Патентованное коммерческое название** (Brand name). Оно присваивается фармацевтическими фирмами, производящими данный конкретный лекарственный препарат и может являться их коммерческой собственностью (торговой маркой), охраняемой патентом.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Классификации ЛС

1. **Алфавитные** (на русском - от «А» до «Я» или иных языках)
2. **Химические** (производные... + химическая структура)
3. **Фармакологические** («смешанные», для самых разных потребителей информации – врач, провизор, разработчик..) –

РАЗРЯД – КЛАСС – ГРУППА - ПОДГРУППА

1. **М.Д.Машковского**
2. **АТС-классификация** («Анатомо-Терапевтически-Химическая», «ВОЗовская», «Скандинавская»)
4. **Фармакотерапевтические** (для врача – средства лечения...)
5. **Классификация CAS** (Chemical Abstracts Service - индексы)



ФАРМАКОЛОГИЯ



ФАРМАКОЛОГИЯ

1. Фундаментальная
(Теоретическая и
Экспериментальная):

- **Общая**
- **Частная**

2. Клиническая





ФАРМАКОЛОГИЯ



ОБЩАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ

- 1. Фармакокинетика**
- 2. Фармакодинамика**
- 3. Фармакогенетика**
- 4. Хронофармакология**



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакокинетика - это раздел общей фармакологии, изучающий процессы всасывания, транспорта, распределения, метаболизма и выведения лекарственных веществ.

«Судьба лекарства в организме» - это то, что организм делает с лекарством.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакодинамика - раздел фармакологии, изучающий совокупность эффектов лекарственных средств, локализацию и механизмы их действия.

«Изучает то, что лекарство делает с организмом».



ФАРМАКОЛОГИЯ



Всасывание (абсорбция – от лат. *absorbeo* – всасываю) – процесс поступления лекарственного вещества из места введения в кровеносную и/или лимфатическую систему через биологические мембраны.

Всасывание осуществляется по нескольким механизмам:

Механизмы всасывания:

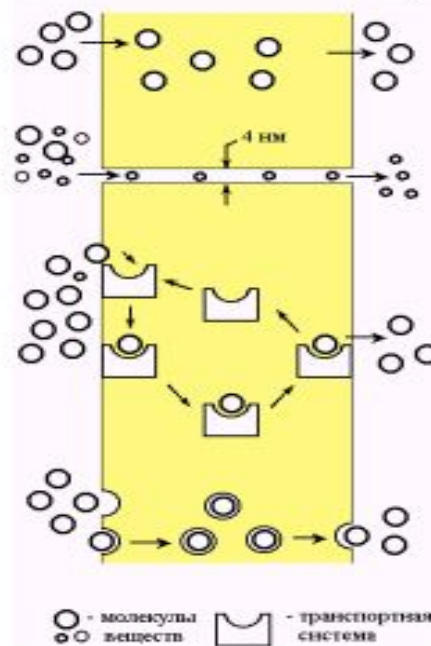
1. Пассивная диффузия

2. Фильтрация

3. Активный транспорт

4. Пиноцитоз

Биологическая мембрана





ФАРМАКОЛОГИЯ



Транспорт ЛВ - это поступление ЛВ с места введения в кровеносную и/или лимфатическую систему через ткани и биологические мембраны.

Транспорт ЛВ осуществляется :

1. Через покровные (наружные) ткани - кожу, слизистые оболочки.
2. Всасыванием из ЖКТ
3. Проникновением через тканевые барьеры
4. Непосредственное введение в кровь, лимфу, спинномозговую жидкость.



ФАРМАКОЛОГИЯ



1. Пути введения ЛВ в организм

Пути введения разделяют на:

- **энтеральные** (через ЖКТ)
- **парентеральные** (минуя ЖКТ).

Путь введения определяет:

скорость наступления фарм. эффекта
его величину

продолжительность

характер фармакологического эффекта.



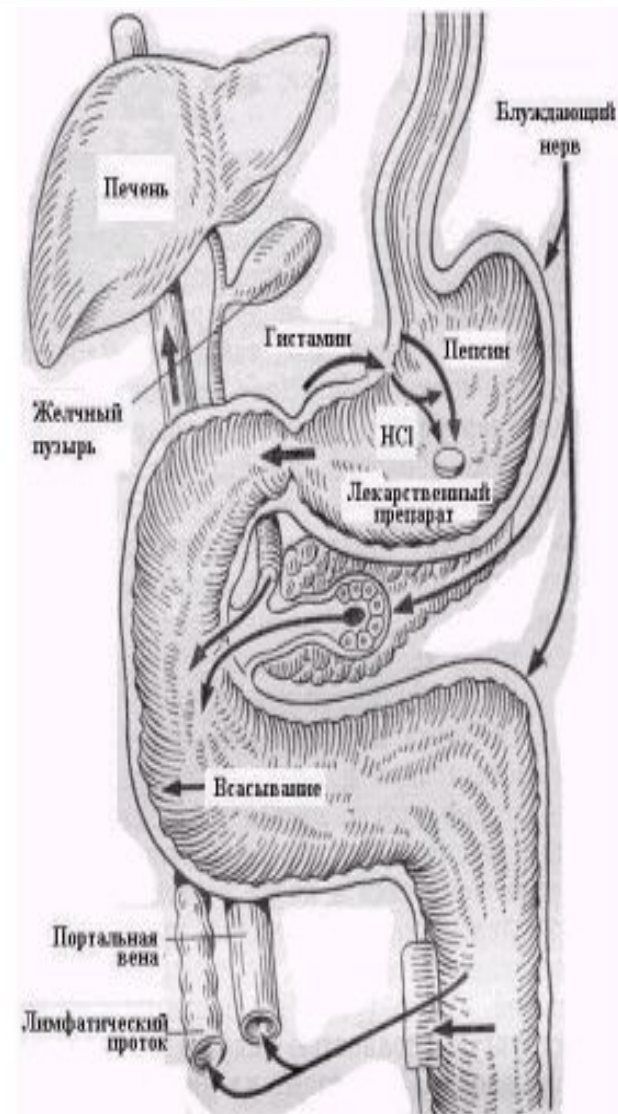
ФАРМАКОЛОГИЯ



I. Энтеральные пути введения

К энтеральным (от греч. *ento* – внутри и *enteron* – кишка) путям введения относятся:

1. **Через рот** (внутри, пероральный, *per os*);
2. **На слизистую полости рта** (трансбуккальный) - лингвально, сублингвально, буккально, дентально
3. **Через прямую кишку** (ректальный, *per rectum*).





ФАРМАКОЛОГИЯ



II. Парэнтеральные пути введения

К парэнтеральным путям введения относятся:

- 1. Местно - на кожу, слизистые и зубы (кроме ЖКТ)**
- 2. Ингаляционно - в дыхательные пути**
- 3. Инъекционно -**
 - 1. В мягкие и твердые ткани.**
 - 2. В сосудистые системы (вены, артерии, ЛУ).**
 - 3. Внутрикожно и подкожно.**
 - 4. Около/над/под твердую и мягкую. оболочки мозга и оболочку нервов.**
 - 5. В естественные и патологические полости.**
- 4. Электро-, и фонофорез**



ФАРМАКОЛОГИЯ



ТРАНСПОРТ, РАСПРЕДЕЛЕНИЕ, ДЕПОНИРОВАНИЕ ЛВ

После всасывания лекарственных веществ в кровеносную систему они распределяются во всем объеме крови, составляющем около 7% массы тела (в среднем 5 литров), разносятся по всему организму и попадают в клетки органов и тканей.

Лекарственные вещества циркулируют в крови либо в свободной форме, либо в форме, связанной с белками плазмы (в основном с альбуминами).



ФАРМАКОЛОГИЯ



Биологические барьеры:

Гистогематический - это стенки капилляров.

Плацентарный барьер - между матерью и плодом.

Гематофтальмический

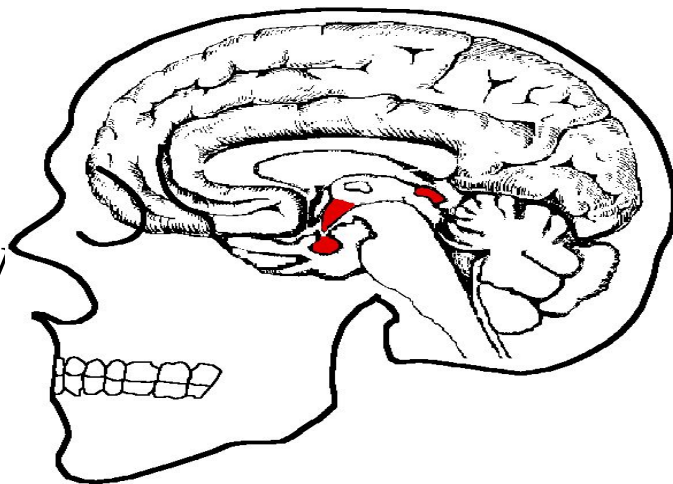
Гематоэнцефалический барьер

кровью и мозгом.

Биодоступность

всасываемость препарата в %)

(биоу





ФАРМАКОЛОГИЯ



РАСПРЕДЕЛЕНИЕ ЛВ

В одних органах концентрация ЛВ может быть высокой, в других - ничтожно малой.

Липофильные ЛВ накапливаются НЕРАВНОМЕРНО - в мозге, жировой ткани и меньше в мышечной ткани. Так, при наркозе в головном мозге содержание наркотических средств значительно больше, чем в скелетных мышцах.

Водорастворимые ЛВ накапливаются РАВНОМЕРНО - в межклеточной жидкости, в органах выделения (почках).

Многие ЛВ имеют свойство избирательно накапливаться (**депонироваться**) в местах специфического действия. Йод накапливается в щитовидной железе, сердечные гликозиды в сердечной мышце, женские половые гормоны в матке и влагалище.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Биотрансформация ЛВ - это превращение ЛВ в организме.

ВИДЫ:

- Метаболическая трансформация** (окисление, восстановление, гидролиз);
- Конъюгация** (ацетилирование, метилирование, образование соединений с глюкуроновой кислоты и др.).

Ведущая роль в биотрансформации ЛВ принадлежит **микросомальным ферментам печени** активность которых определяется рядом причин.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Выведение ЛВ (Экскрекция) - это процесс вывода ксенобиотика из организма

Через почки

Через легкие

Через ЖКТ

Через железы

Элиминация (биотрансформация и экскрекция).

Период полуэлиминации ($T_{1/2}$) - это время за которое концентрация вещества в плазме крови снижается наполовину.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакодинамика - раздел фармакологии, изучающий совокупность эффектов лекарственных средств и механизмы их действия.

«Изучает то, что лекарство делает с организмом.»

Механизм действия лекарственных средств – это лечебное действие путем изменения деятельности физиологических систем клеток.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Различают два вида действия
лекарств –

1. Местное (возникает на месте его приложения) и
2. Резорбтивное (действие всосавшегося в кровь и поступившего в ткани лекарства).

И местное и резорбтивное действие может быть:
прямым (на месте непосредственного контакта с тканью) и
рефлекторным (влияние лекарств на рецепторы).



ФАРМАКОЛОГИЯ

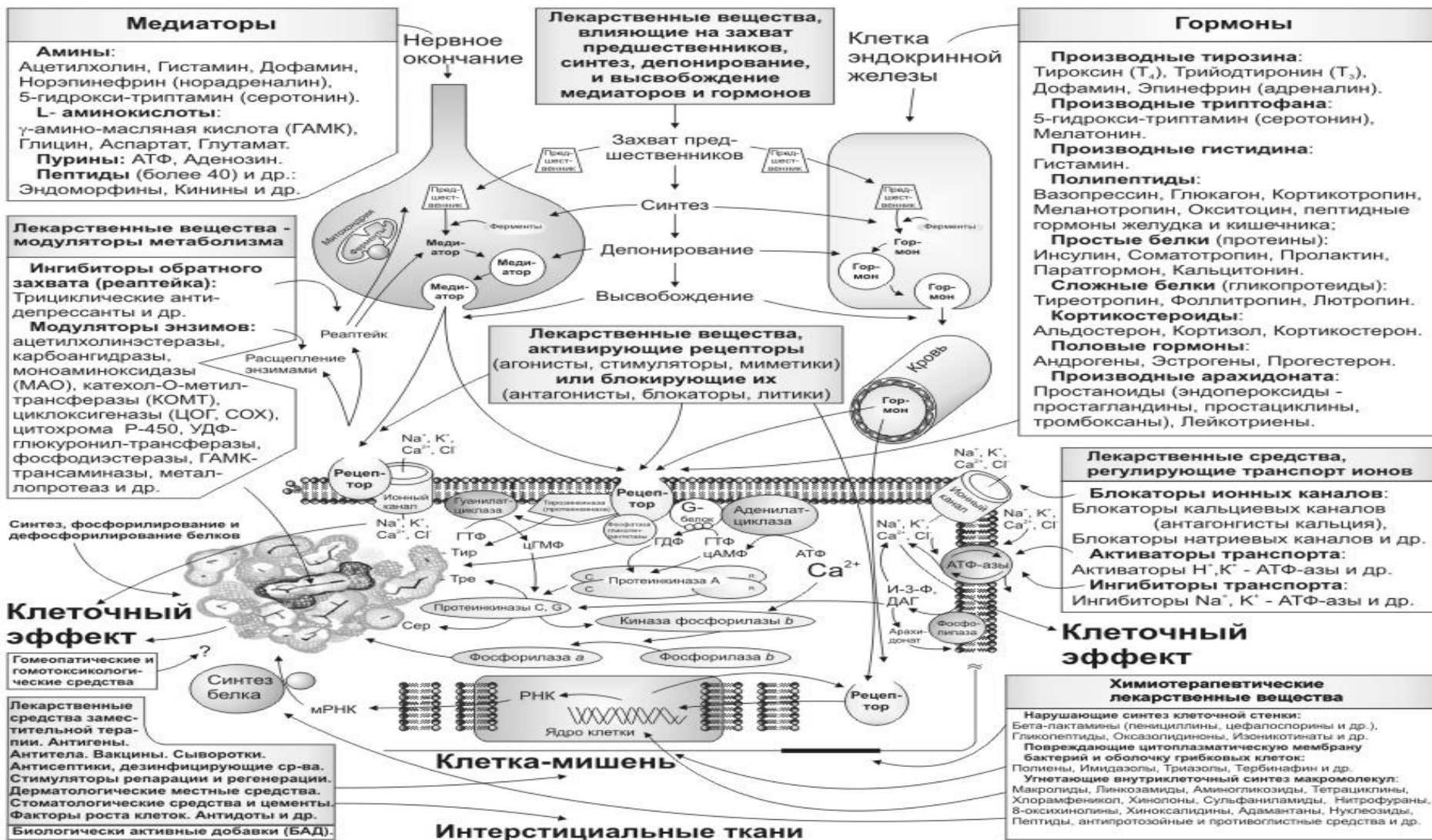


«МИШЕНИ» ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

1. Биомембраны и ионные каналы
2. Рецепторы (вне-, и внутри клетки)
3. Ферментные системы
4. Внутриклеточные метаболиты
5. Межклеточные вещества
6. Возбудители инфекционных и паразитарных заболеваний
7. Токсины и яды



ФАРМАКОЛОГИЯ





ФАРМАКОЛОГИЯ



Рецепторы - макромолекулярные структуры, избирательно чувствительные к определенным химическим соединениям. Препараты, прямо возбуждающие или повышающие функциональную активность рецепторов, называют **агонистами**, а вещества, препятствующие действию специфических агонистов - **антагонистами**.

Известно более 70 подтипов более чем 20 известных типов рецепторов:

1. Адренорецепторы – 9 подтипов (альфа-1А,В,С; альфа-2А,В,С; бета-1,2,3)
2. Холинорецепторы – 6 подтипов (М-1,2,3,4; Н-мышечного и нейронального типа)
3. Опиатные рецепторы – 3 подтипа (мю, дельта, каппа)



ФАРМАКОЛОГИЯ



• Виды действия лекарств:

• основное,

• побочное (гепатотоксическое, нефротоксическое, иммунотоксическое, нейротоксическое, ототоксическое, фетотоксическое или эмбриотоксическое, тератогенное, ульцерогенное, канцерогенное),

• прямое,

• косвенное

• Виды взаимодействия лекарств с организмом:

местное, резорбтивное, рефлекторное



ФАРМАКОЛОГИЯ



• **Виды доз:**

- разовые, высшие разовые,
- суточные, высшие суточные,
- курсовые, ударные, поддерживающие,
- минимальная действующая (пороговая),
- средняя и высшая терапевтические,
- токсические (минимальная и средняя),
- летальные (LD100).

• **Широта терапевтического действия** – диапазон между min терапевтической и токсической дозами.



ФАРМАКОЛОГИЯ



- **Повышенная чувствительность:** идиосинкразия, сенсibilизация
- **Пониженная чувствительность** или **устойчивость** или **толерантность**
- **Тахифилаксия** или **быстрое привыкание**
- **Синергизм** (простое суммирование, потенцирование)
- **Антагонизм**
- **Кумуляция:** физическая (материальная), функциональная



ФАРМАКОЛОГИЯ



- **Пристрастие** или зависимость или аддикция
- **Эйфория** (психическая)
- **Абстиненция** (физическая)
- **«Феномен рикошета»**
- **Виды лечения:** этиотропное (причина болезни), симптоматическое, патогенетическое (механизм развития болезни), комбинированное, заместительная терапия
- **Ятрогенные заболевания**



ФАРМАКОЛОГИЯ



СВР:

Составление конспекта по теме:
«Особенности дозирования лекарств в детском и пожилом возрасте».

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.
«Фармакология с общей рецептурой»,
учебное пособие для мед. училищ,. – М.,
2015. Стр.22 – 23.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Информационные источники

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.

«Фармакология с общей рецептурой»,
учебное пособие для мед. училищ,. –
М., 2015. Стр.9-24.



ФАРМАКОЛОГИЯ



- Вопросы для контроля
- Фармакокинетика
- Фармакодинамика
- Биотрансформация, метаболизм
- Механизм действия
- Энтеральные пути введения
- Парентеральные пути введения
- Резорбция
- Кумуляция



ФАРМАКОЛОГИЯ



- Вопросы для контроля
- Виды взаимодействия лекарств с организмом: местное, резорбтивное, рефлекторное
- Виды действия лекарств: основное, побочное (гепатотоксическое, нефротоксическое, иммунотоксическое, нейротоксическое, ототоксическое, фетотоксическое или эмбриотоксическое, тератогенное, ульцерогенное, канцерогенное), прямое, косвенное
- Виды лечения: этиотропное, симптоматическое, патогенетическое, комбинированное, заместительная терапия



ФАРМАКОЛОГИЯ



- Вопросы для контроля
- Виды доз: разовые, высшие разовые, суточные, высшие суточные, курсовые, ударные, токсические, летальные
- Широта терапевтического действия
- Повышенная чувствительность: идиосинкразия, сенсibilизация
- Пониженная чувствительность или устойчивость или толерантность
- Тахифилаксия или быстрое привыкание



ФАРМАКОЛОГИЯ



- Вопросы для контроля
- Синергизм
- Антагонизм
- Кумуляция: физическая, материальная
- Пристрастие или зависимость или аддикция
- Эйфория
- Абстиненция
- «Феномен рикошета»
- Ятрогенные заболевания
- Элиминация