

# ЛЕКЦИИ ПО ФАРМАКОЛОГИИ

Вводная лекция

к.м.н. Хоконова Т.М.

# Фармакология

-наука по изысканию новых лекарственных средств и изучению изменений в живом организме при их действии.

# В результате изучения фармакологии студент должен:

## ЗНАТЬ:

- а) основы Законодательства РФ в сфере обращения лекарственных средств: Федеральный закон «О лекарственных средствах», Приказ №110 от февраля 2007 г. «О порядке назначения и выписывания лекарственных средств».
- б) принципы изыскания новых лекарственных средств,
- в) государственную систему экспертизы испытаний новых лекарственных средств,
- г) общие принципы фармакокинетики и фармакодинамики лекарственных средств,
- д) классификацию и характеристику основных групп лекарственных препаратов, фармакодинамику и фармакокинетику, показания и противопоказания к применению лекарственных средств; виды лекарственных форм, дозы отдельных препаратов; несовместимость лекарств,
- е) основные нежелательные реакции наиболее распространённых лекарственных средств, способы профилактики и коррекции;
- ж) общие принципы оформления рецептов и составление рецептурных прописей лекарственных средств, общепринятые сокращения и обозначения в рецептах, употребление латинского языка, правила хранения и использования лекарственных средств;
- з) источники информации: Государственная фармакопея, Регистр лекарственных средств России, Государственный реестр лекарственных средств, Энциклопедия лекарств и др.

## В результате изучения фармакологии студент должен: **уметь**

- а) отличать понятия «лекарственная форма», «лекарственное вещество», «лекарственное средство», «лекарственный препарат», «лекарственное сырьё», «биологически активная добавка к пище» (БАД), «гомеопатическое средство»;
- б) анализировать действие лекарственных средств по совокупности их фармакологических свойств;
- в) оценивать возможности использования лекарственных средств для фармакотерапии;
- г) выписывать рецепты лекарственных средств;
- д) оценивать возможность токсического действия лекарственных средств и способы терапии отравлений лекарственными средствами;
- е) проводить поиск по вопросам фармакологии, используя источники информации – справочники, базы данных, Интернет-ресурсы.

## В результате изучения фармакологии студент должен: **владеть**

- а) навыками выбора лекарственного средства по совокупности его фармакологических свойств, механизмов и локализации действия и возможности замены препаратом других групп;
- б) навыком выбора определённой лекарственной формы, дозы и пути введения препаратов с учётом патологического состояния;
- в) навыками прогнозирования возможного взаимодействия лекарственных средств при комбинированном применении различных препаратов;
- г) навыками выписывания лекарственных средств в рецептах при определённых патологических состояниях, исходя из особенностей фармакодинамики и фармакокинетики;
- д) основами лечебных мероприятий по оказанию первой врачебной помощи при неотложных и угрожающих жизни состояниях, остром отравлении лекарственными средствами.

## РАЗДЕЛЫ ФАРМАКОЛОГИИ:

1. Теоретическая (история, теории, концепции, методы, расчёты и т.д.);
2. Экспериментальная (фундаментальная);
3. Клиническая.

# ■ КЛИНИЧЕСКАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ –

это совокупность научно-обоснованных принципов рационального выбора лекарственных средств для терапии заболевания или синдрома, индивидуального подбора фармакологических препаратов каждому больному, а также комплекс методов контроля терапевтической эффективности и безопасности лекарств.



# История фармакологии.





**Николай  
Павлович  
Кравков**

24.2.(8.3).1865, Рязань, —  
24.4.1924, Ленинград]

**русский фармаколог,  
основоположник  
отечественной  
фармакологии**

член-корреспондент Российской АН  
(1920), академик Военно-медицинской  
академии (1914).

# Лекарственное средство

- (лекарство – drug) – это биологически активное вещество, которое применяется в определённых дозах и удобной форме для профилактики и лечения заболеваний.

# Лекарственный препарат

- (упаковка) – это лекарственное средство, зарегистрированное конкретным производителем в определённой дозе и лекарственной форме.

# Лекарственное вещество

- – это индивидуальное химическое соединение, обладающее свойством ускорять выздоровление или препятствовать возникновению заболевания.

# Лекарственная форма

- – это форма лекарственного вещества удобная для хранения и применения. Существуют твёрдые, мягкие и жидкие лекарственные формы.

# Источники получения лекарств:

1. Лекарственные растения
2. Животный мир
3. Минералы
4. Микроорганизмы
5. Химический синтез

# Пути поиска новых лекарственных веществ среди вновь синтезированных соединений:

1. Эмпирическое изучение
2. Модификация известных химических структур
3. Составление комбинированных препаратов
4. Целенаправленный синтез
5. Лекарственная биотехнология.

# Геномика

- – наука, занимающаяся изучением структуры и функций генов. Её технологии позволяют установить индивидуальную вариабельность организма на действие лекарственного вещества и на этой основе создавать эффективные и безопасные лекарственные средства.

# Протеомика

- (от слов протеин и геномика) – наука, занимающаяся изучением совокупности белков и их взаимодействий в живых организмах. Она ориентирована на создание новых лекарственных средств, основой действия которых будут те или иные белки, а также на исследования действия препаратов на белковые совокупности и их взаимодействие в организме.

# Этапы изучения и внедрения новых ЛС:

- I Доклинические (эксперимент) исследования
- II Рассмотрение материалов в Фармкомитете Минздрава РФ
- III Клинические исследования препарата
- IV Рассмотрение в Фармкомитете и получение разрешения на выпуск

# Стандарт GLP

- («*Good Laboratory Practice*», Надлежащая лабораторная практика) — система норм, правил и указаний, направленных на обеспечение согласованности и достоверности результатов лабораторных исследований.

# Стандарт GCP

- (Good Clinical Practice - Надлежащая клиническая практика) - международный стандарт этических норм и качества научных исследований, описывающий правила разработки, проведения, ведения документации и отчетности об исследованиях, которые подразумевают участие человека в качестве испытуемого (клинические исследования).

# Стандарт GMP

- (Good Manufacturing Practice - Надлежащая производственная практика) - система норм, правил и указаний в отношении производства лекарственных средств, медицинских устройств, изделий диагностического назначения, пищевых добавок и активных ингредиентов.

# Классификация лекарственных средств обусловлена следующими принципами:

- *1.Терапевтическое применение* – противоаритмические средства, наркотные средства, противоопухолевые средства и т.д.
- *2.Точки приложения или механизм действия:*
  - а) молекулярный уровень - стимуляторы или блокаторы рецепторов,
  - б) влияние на ферментативную активность (ингибиторы АПФ), ионные каналы (блокаторы кальциевых каналов) и т.д.;
  - в) уровень органа – гепатопротекторы, гастропротекторы, стимуляторы ЦНС и т.д.;
  - г) уровень физиологической системы – антисклеротические средства, средства, влияющие на систему РАСК и т.д.
- *3.Химическое строение:* производные фенотиазина, бензодиазепины, барбитураты и т.д.

# Анатомо-терапевтическо-химическая классификация

- международная система классификации лекарственных средств. Используются сокращения: латиницей АТС (от *Anatomical Therapeutic Chemical*) или русское: АТХ (*анатомо-терапевтическо-химическая*). Полное английское название — *Anatomical Therapeutic Chemical Classification System*.

# Классификация CAS

- (Chemical Abstracts Service).  
Представляет собой однозначный идентификатор химических субстанций, где определенной химической структуре присвоен регистровый номер.

# Формулярная система

- (англ. Formulary – свод правил) – это обязательный стандарт лечения, основанный на доказательной медицине. Это система выбора лекарственного средства в ежедневной практике врача, которая должна быть свободна от внешнего воздействия и коммерческого давления.

# Доказательная медицина

- (медицина основанная на доказательствах) включает в себя добросовестное, точное, осмысленное использование лучших результатов клинических исследований для выбора лечения больного.

# Источники информации

- Официальными источниками информации о лекарственных препаратах (ЛП), в которых прописана вся информационная база, являются: фармакопейная статья, клинико-фармакологическая статья (типовая клинико-фармакологическая статья ЛС и клинико-фармакологическая статья ЛП), паспорт ЛП, Государственный реестр лекарственных средств РФ. Источником информации о лекарствах являются инструкции по применению препарата, Перечень жизненно необходимых лекарственных средств (общий и по основным направлениям: педиатрия, кардиология и т.д.), Федеральное руководство по использованию лекарственных препаратов (формулярная система) а также научные статьи, справочники, учебники, интернет, в частности: сайт [RLSNET.RU](http://RLSNET.RU) – самый посещаемый, сайт [MEDI.RU](http://MEDI.RU), сайт [VIDAL.RU](http://VIDAL.RU).

# Общая фармакология

**Фармакокинетика** – раздел фармакологии, изучающий процессы всасывания, распределения, метаболизма и выведения лекарственных веществ в сопоставлении с изменениями, вызываемыми ими в организме.

# Фармакокинетика

От греч. *Pharmakon* - лекарство, *kinetikos* - движущий) - раздел фармакологии, изучающий процессы

- всасывания,
- распределения,
- метаболизма,
- выделения лекарственных средств.

# Основные фармакокинетические процессы

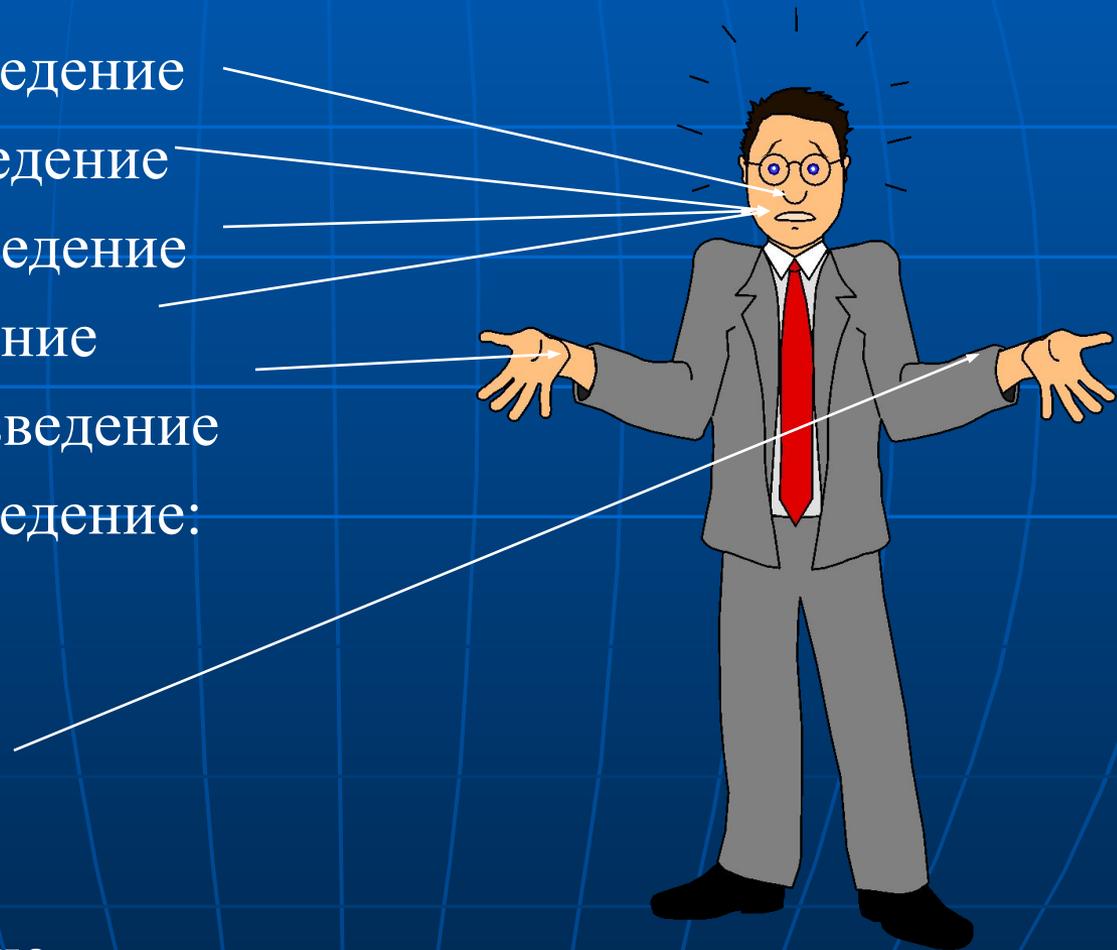
- Высвобождение из лекарственной формы
- Всасывание (адсорбция)
- Распределение
- Метаболизм
- Выведение (экскреция)

# Пути введения

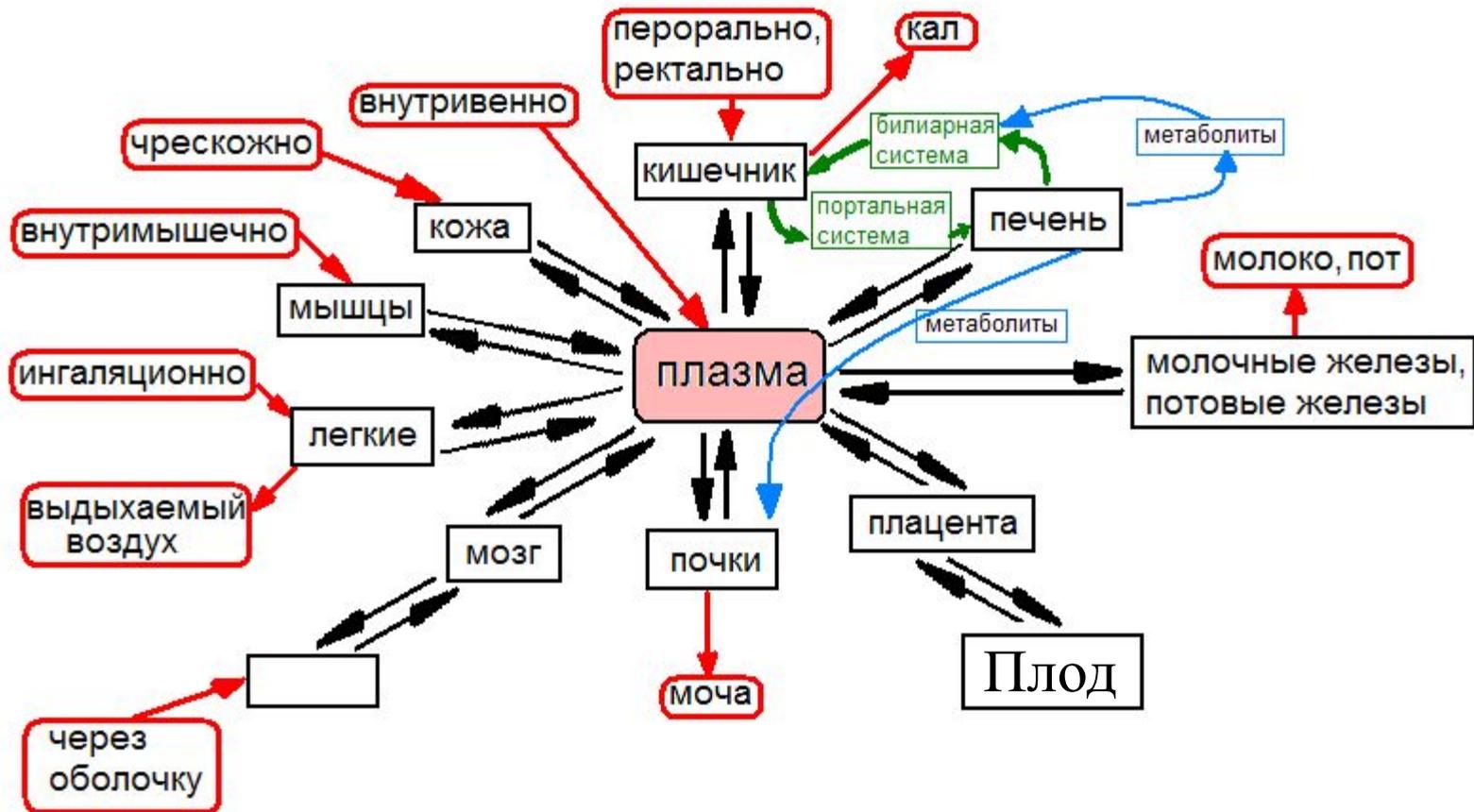
1. Энтеральный путь
2. Парентеральный путь
  - неинъекционные и
  - инъекционные

# Наиболее часто используемые пути введения лекарственных веществ

- Интраназальное введение
- Ингаляционное введение
- Сублингвальное введение
- Пероральное введение
- Трансдермальное введение
- Парентеральное введение:
  - в/в
  - в/м
  - п/к
- Местное введение
- Ректальное введение

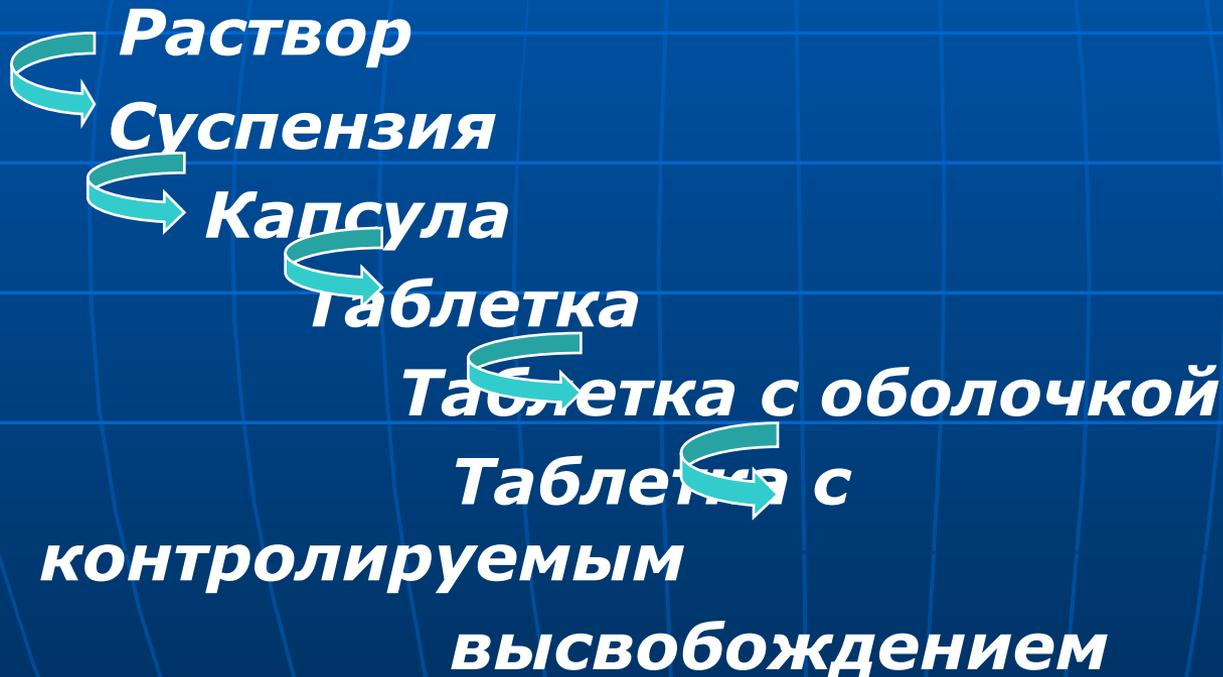


# Поступление и удаление лекарственных веществ



# Высвобождение из лекарственной формы

- **Скорость**



# Лекарственные формы с контролируемым высвобождением

## Достоинства

- Уменьшенная частота дозирования и увеличение удобств для больного
- Увеличенная комплаентность
- Высокая стабильность концентрации в плазме
- Высокая стабильность фармакодинамических эффектов

# Лекарственные формы с контролируемым высвобождением

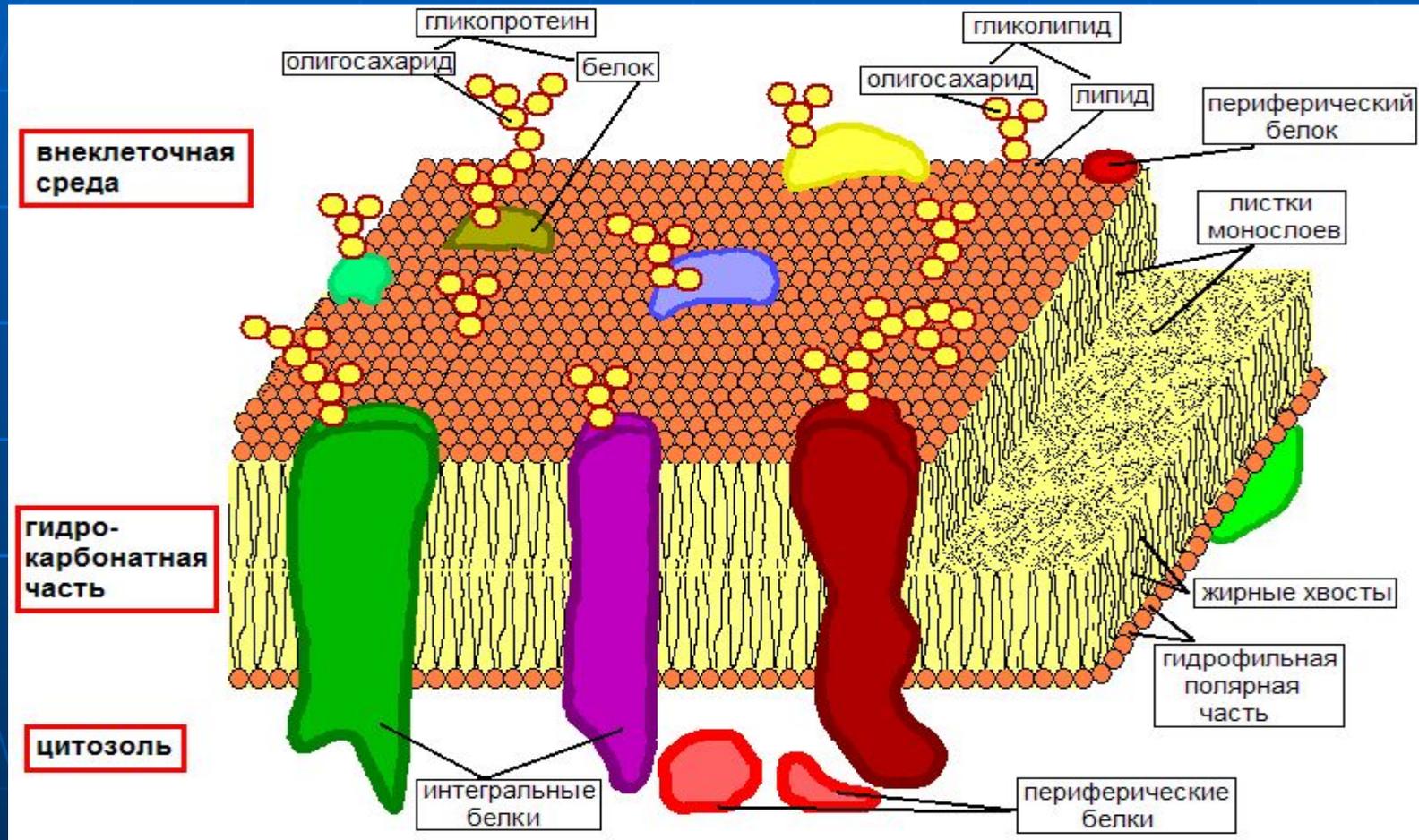
## Разновидности

- Оральные формы (капсулы, таблетки)
- Накожные формы (пластыри)
- Парентеральные формы (соли, эфиры, суспензии, имплантанты)

# Биологические барьеры:

1. Кожа
2. Гемато-энцефалический барьер
3. Фето-плацентарный барьер
4. Через эпителий молочных желез
5. Капиллярная стенка

# Мембрана клетки



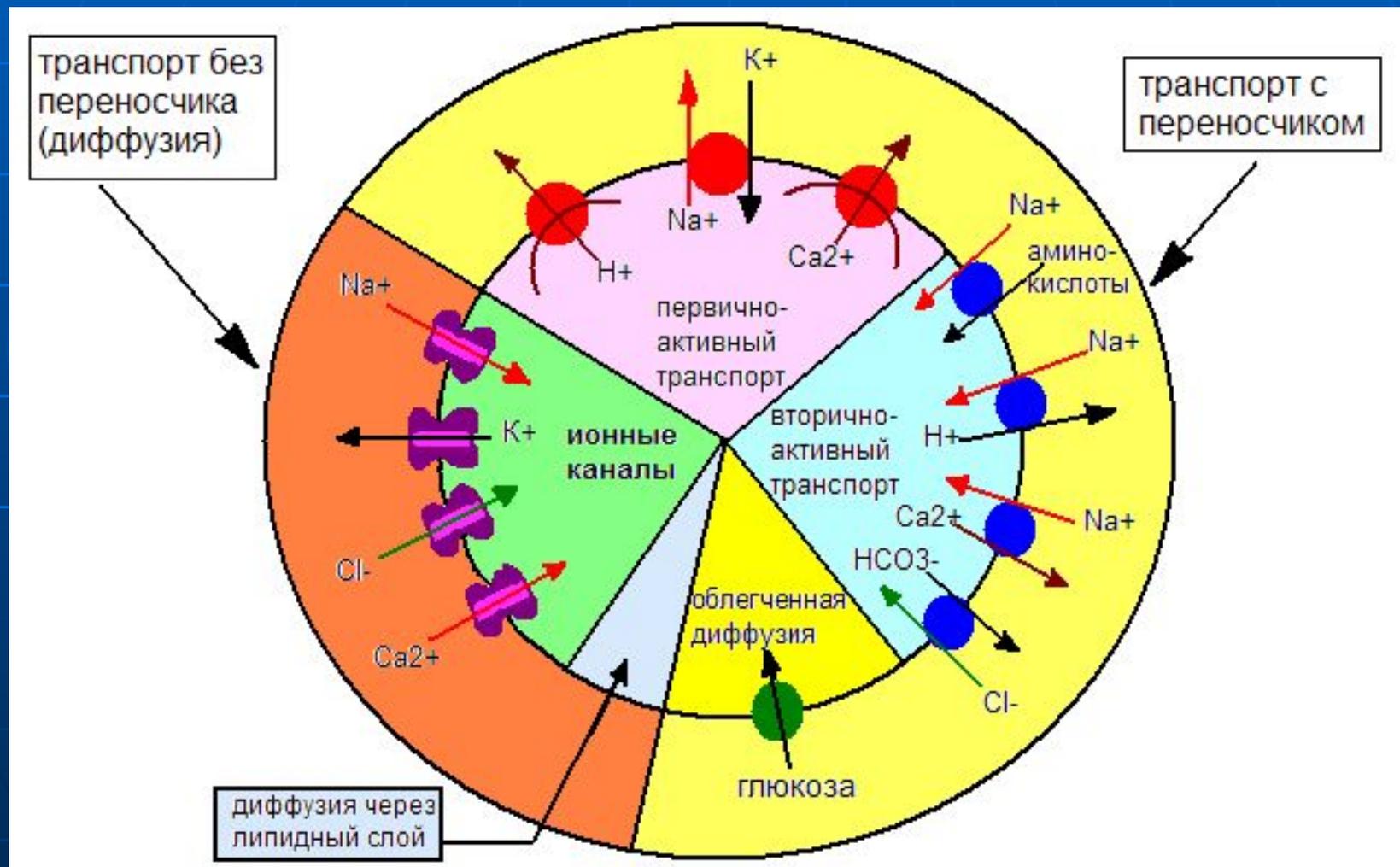
# Всасывание

**Всасывание-это процесс движения лекарственного вещества из места введения в системный кровоток**

## Механизмы

- Пассивная диффузия
- Активный транспорт
- Фильтрация через поры
- Пиноцитоз

# Проникновение веществ в клетку



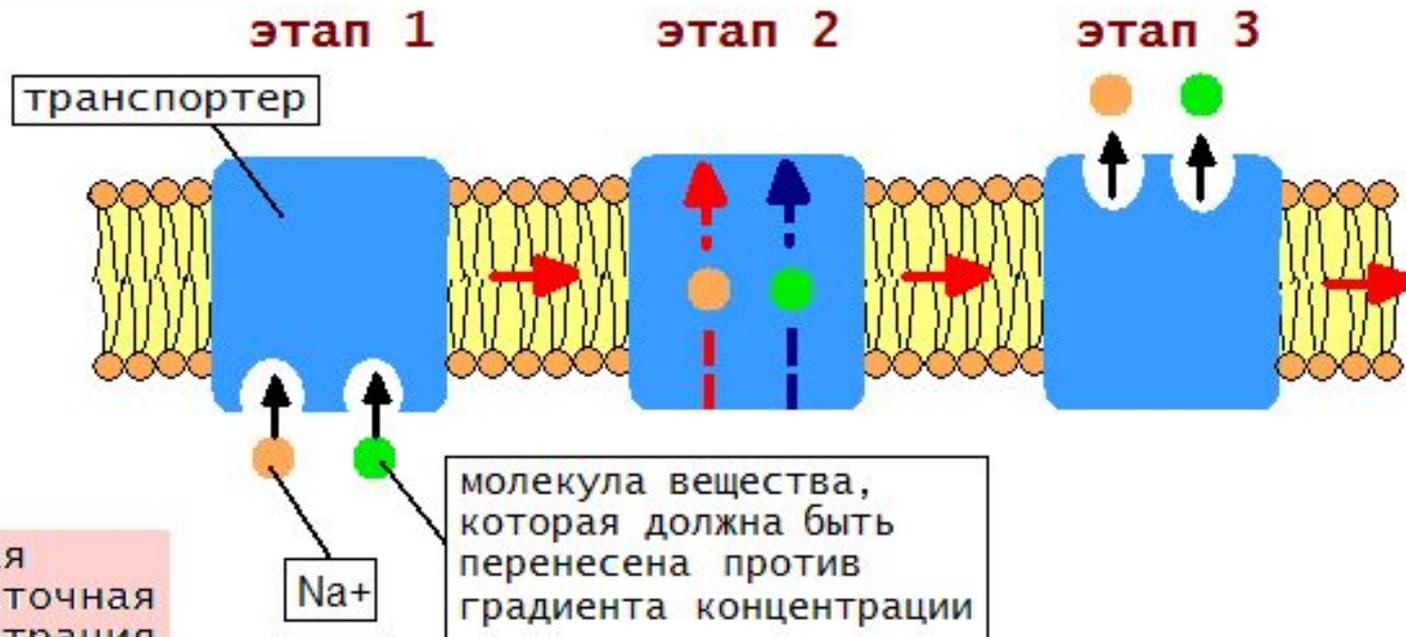
# Пассивная диффузия

- Основной (не требует энергии)
- Лучше - жирорастворимые ЛС
- Тонкая кишка (главным образом)
- Толстая и прямая кишка (дополнительно)

# Активный транспорт

низкая  
внутриклеточная  
концентрация  
ионов  $\text{Na}^+$

внутриклеточная жидкость



высокая  
внеклеточная  
концентрация  
ионов  $\text{Na}^+$

внеклеточная жидкость

# Влияние pH желудка на всасывание

- Слабые кислоты

↑ pH (щелочная среда) ↓  
↑ Степень ионизации ↓  
↓ Липофильность ↓  
↓ Всасывание ↓

- Слабые основания

↓ pH (кислая среда) ↓  
↑ Степень ионизации ↓  
↓ Липофильность ↓  
↓ Всасывание ↓

# ЛС, всасывание которых ухудшается при изменении рН в желудке

■ рН 

Салицилаты  
Фенилбутазон  
Сульфаниламиды  
Барбитураты

■ рН 

Кодеин  
Хинидин  
Рифампицин  
Эритромицин

# ЛС, которые принимают внутрь во время еды

- Гипотиазид
- Гризеофульвин
- Пропроналол
- Метопролол
- Цефуроксим аксетил

# Препараты, которые принимают внутрь за 1 час до еды

- Разрушаются при ↓ рН

Ампициллин  
Эритромицин

- Связываются с пищей рН ↑

Тетрациклин  
Эритромицин  
Фузидин  
Сульфаниламиды  
Каптоприл  
Препараты Fe

# ЛС, которые принимают внутрь после еды

- НПВС (курсовой прием)
- Глюкокортикоиды
- Резерпин, раунатин
- Теофиллин, аминофиллин
- Препараты калия

# Распределение препараты в организме

## 1 фаза

Зависит от кровотока:

поступление в органы с хорошим кровоснабжением (сердце, печень, мышцы)

## 2 фаза

Зависит от связывания с белками

Основные связывающие белки:

- альбумины (ЛС - кислоты)
- альфа 1 - кислый гликопротеин (ЛС - основания)

# Факторы, влияющие на распределение

## I. Свойства организма - барьеры

- Гематоэнцефалический
- Гематоофтальмический
- Капсула предстательной железы
- Клеточные мембраны

## II. Свойства препарата

- растворимость в жирах

## III. Доза препарата

# Резервуары ЛС в организме

## *Белки плазмы*

- активностью обладает несвязанная фракция ЛС
- связывание зависит от концентрации белков
- связывание является неселективным
- ЛС могут вытесняться эндогенными веществами и другими ЛС
- при вытеснении ЛС из связи с белками - усиление эффекта, риск развития нежелательных реакций

# Резервуары ЛС в организме

- Клетки (макролиды)
- Жировая ткань (амиодарон)
- Кости (тетрациклины)
- Трансцеллюлярные резервуары (ЖКТ, ликвор)

# Степень связывания препаратов с белками плазмы крови

Препарат	% связанного препарата
Варфарин	99,5
Диазепам	99
Фенитоин	96
Хинидин	71
Лидокаин	51
Дигоксин	25
Гентамицин	3
Атенолол	0

Наибольшее значение имеет связывание на 85-90% и более

# Метаболизм

Метаболизм - процесс химического изменения ЛС в организме

Реакции I типа (несинтетические):

- окисление
  - восстановление
  - гидролиз
  - комбинация процессов
- микросомы  
печени

## **Реакции II типа (синтетические, конъюгации)**

- **Глюкуронизация - микросомы печени**
- **Аминоконъюгация**
- **Ацетилирование**
- **Сульфоконъюгация**
- **Метилирование**

# Биодоступность (биоусвояемость):

- определенная часть неизменного лекарства, достигающая системной циркуляции.

# Выведение лекарственных веществ и их метаболитов:

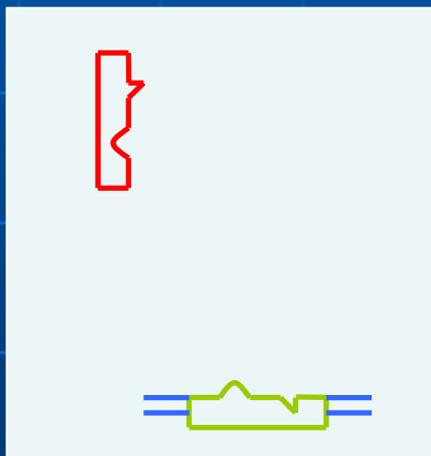
- Почки
- ЖКТ
- С молоком
- Со слюзью, слюной, потом
- С выдыхаемым воздухом

# Фармакодинамика

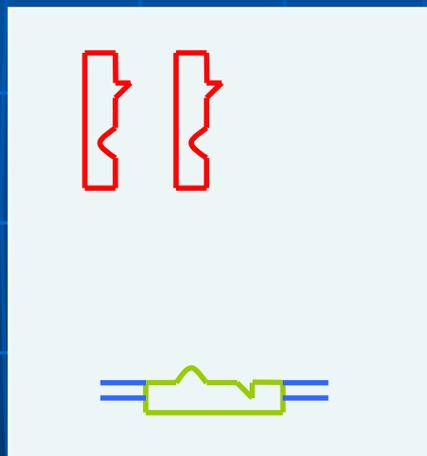
**Фармакодинамика** – это раздел фармакологии, изучающий механизмы взаимодействия лекарственных веществ с живыми системами, и эффекты этого взаимодействия.

# Взаимодействие ЛВ с рецепторами

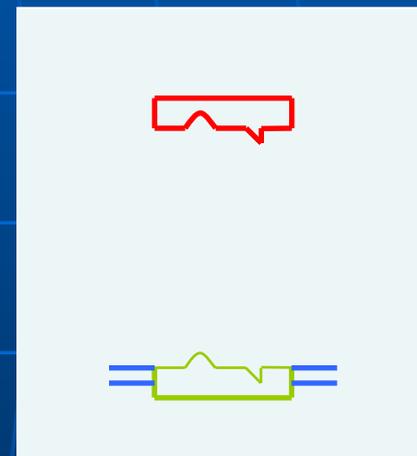
Этапы взаимодействия:



Ориентация  
молекулы ЛВ



Притяжение



Контактирование

# Типовые фармакологические реакции

1. Воспроизведение действия естественного метаболита.
2. Изменение выделения или синтеза медиатора
3. Конкурентное торможение действия медиатора
4. Изменения проницаемости мембран
5. Изменение активности ферментов.

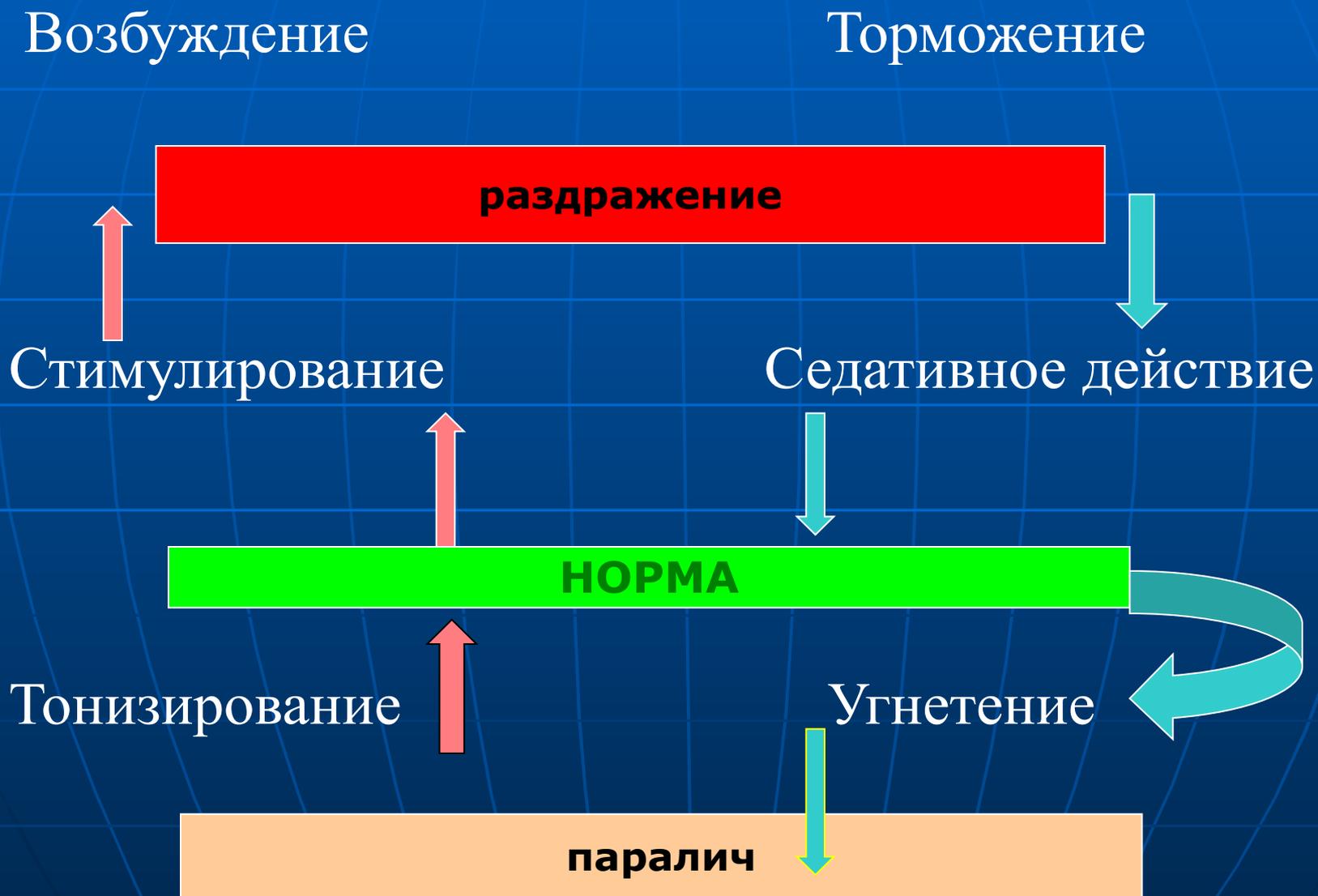
# Типовые конечные эффекты:

1. Местное действие
2. Резорбтивное действие
3. Рефлекторное действие

# Типы действия лекарств:

1. Обще клеточное
2. Преимущественное
3. Избирательное

# Фазы действия лекарств:



# Факторы, определяющие действие ЛВ в организме.

Свойства препарата

Свойства организма человека

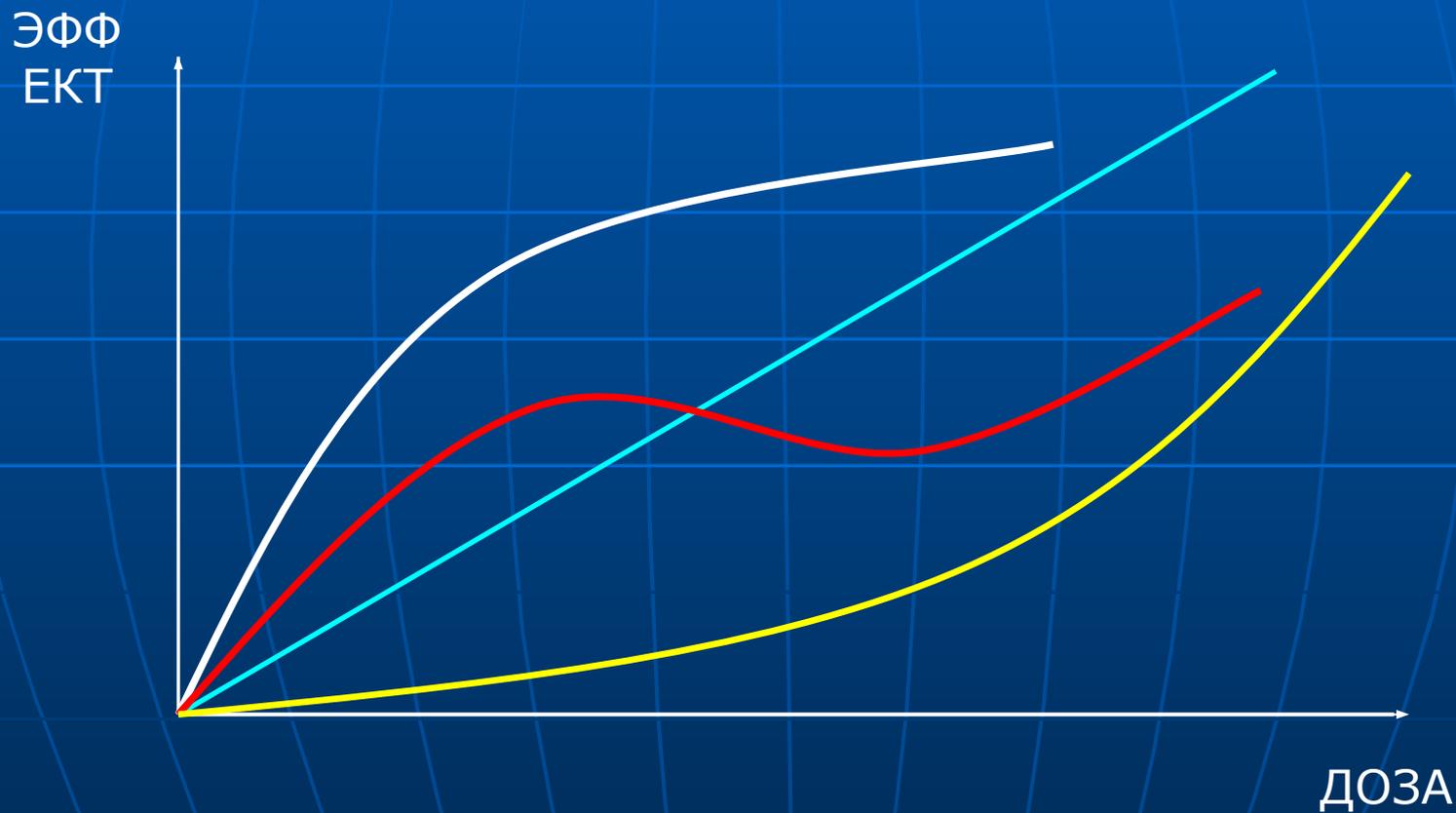
Влияние окружающей среды

Доза - это количество препарата, проникающего в организм, связывающегося с рецепторами и оказывающего эффект.

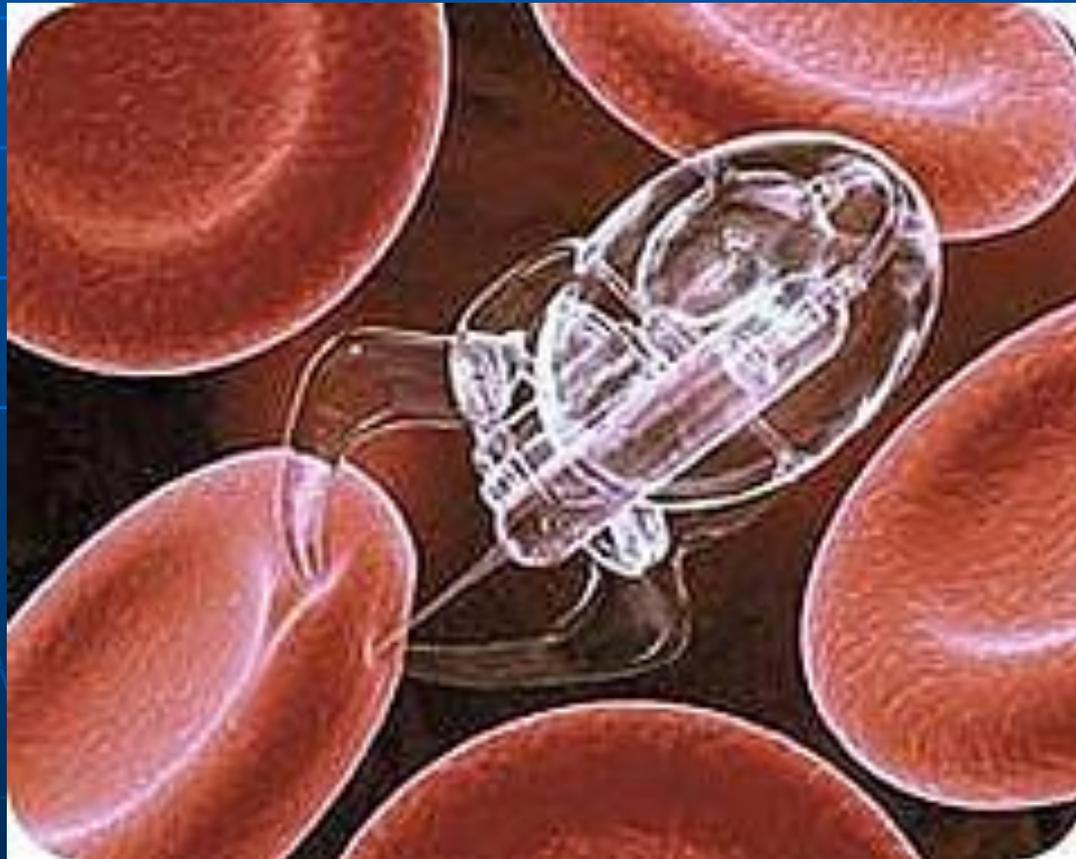
Зависимость от дозы:

С увеличением дозы возрастает скорость действия, сила, длительность, меняется эффект.

# Характер зависимости эффекта от дозы препарата

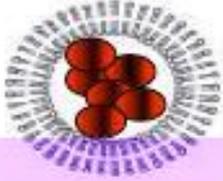


# НАНОТЕХНОЛОГИИ



# Many "Nanomedicines" are already in routine clinical use

**Liposomes**  
Bangham, Gregoriadis



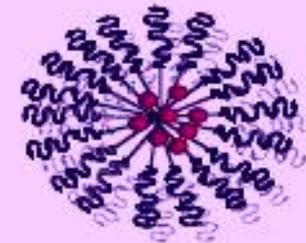
**Antibodies and their Conjugates**  
Celltech-UCB



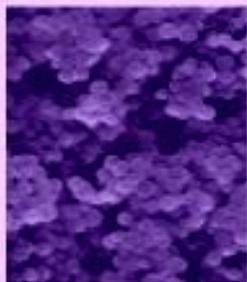
**Viruses as viral vectors for gene therapy**  
Seymour



**polymer micelles**



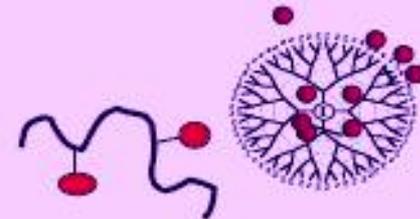
**Nanoparticles**  
Florence, Daves, Illum



**Polymer-protein conjugates**



**Unimolecular Polymeric Drugs and Conjugates**  
Duncan

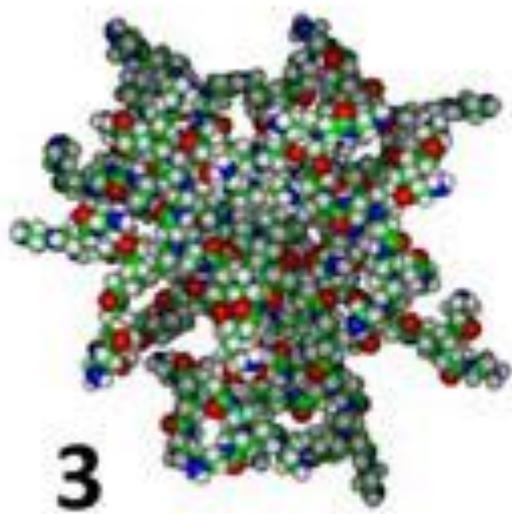
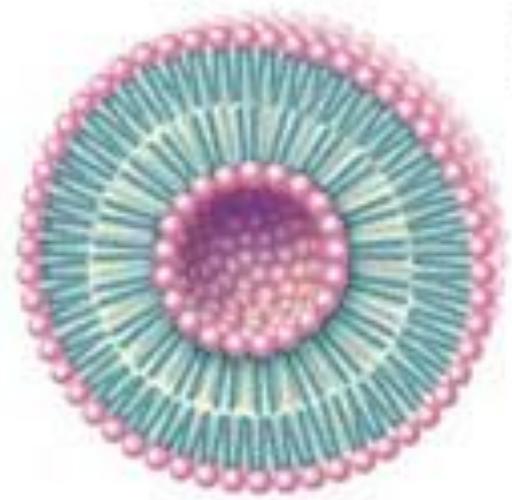
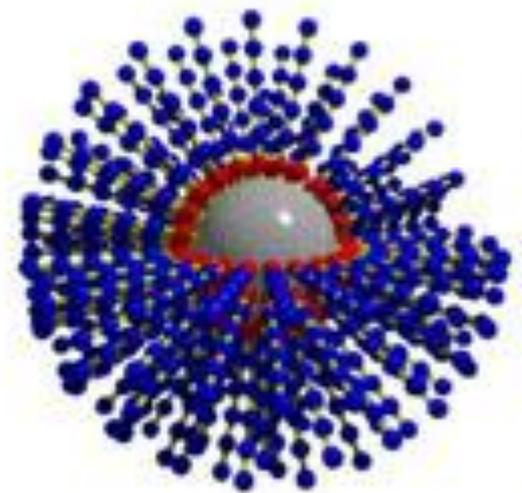
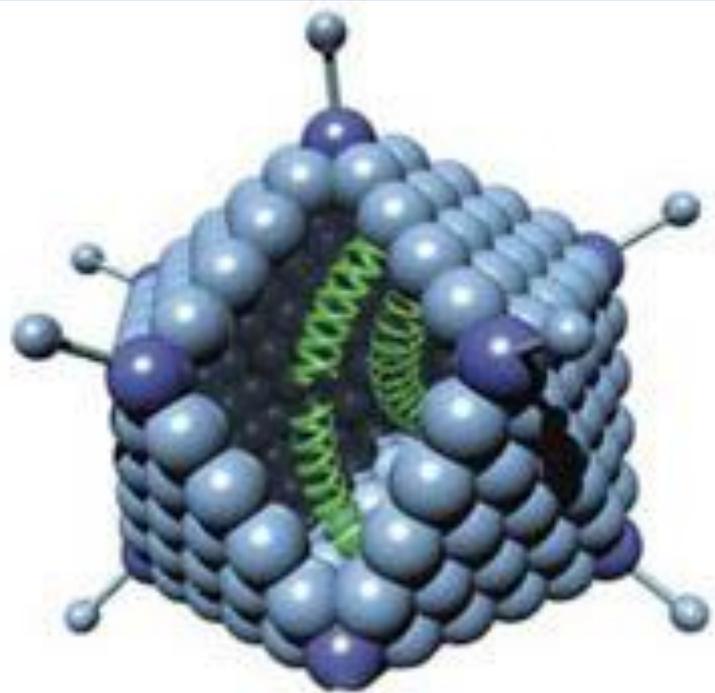


# НАНОТЕХНОЛОГИИ В ФАРМАКОЛОГИИ

- НАНОТЕХНОЛОГИИ ОПЕРИРУЮТ С ОБЪЕКТАМИ НАНОМЕТРИЧЕСКОГО РАЗМЕРА (ОТ ГРЕЧ. NANNOS –» КАРЛИК») НАЗЫВАЮТСЯ НАНОТЕХНОЛОГИЯМИ. ЭТИ ОБЪЕКТЫ ИСЧИСЛЯЮТСЯ МИЛЛИАРДНЫМИ ДОЛЯМИ МЕТРА
- $10^{-9}$ .

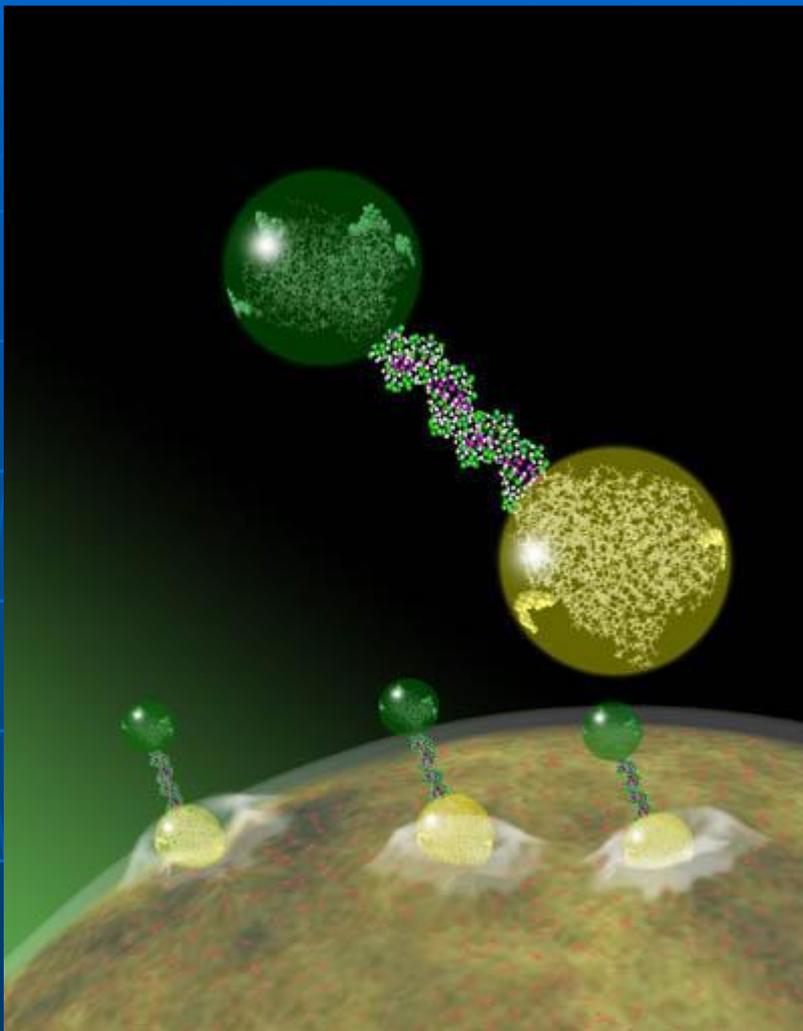
# ОБЛАСТИ ПРИМЕНЕНИЯ НАНОТЕХНОЛОГИЙ

- 1. АНАЛИТИЧЕСКИЕ  
НАНОТЕХНОЛОГИИ ДЛЯ  
ДИАГНОСТИКИ.
- 2. НАНОТЕХНОЛОГИИ ДЛЯ  
ТРАНСПОРТА ЛЕКАРСТВ.
- 3. НАНОМАТЕРИАЛЫ.
- 4. НАНОРОБОТЫ В МЕДИЦИНЕ.

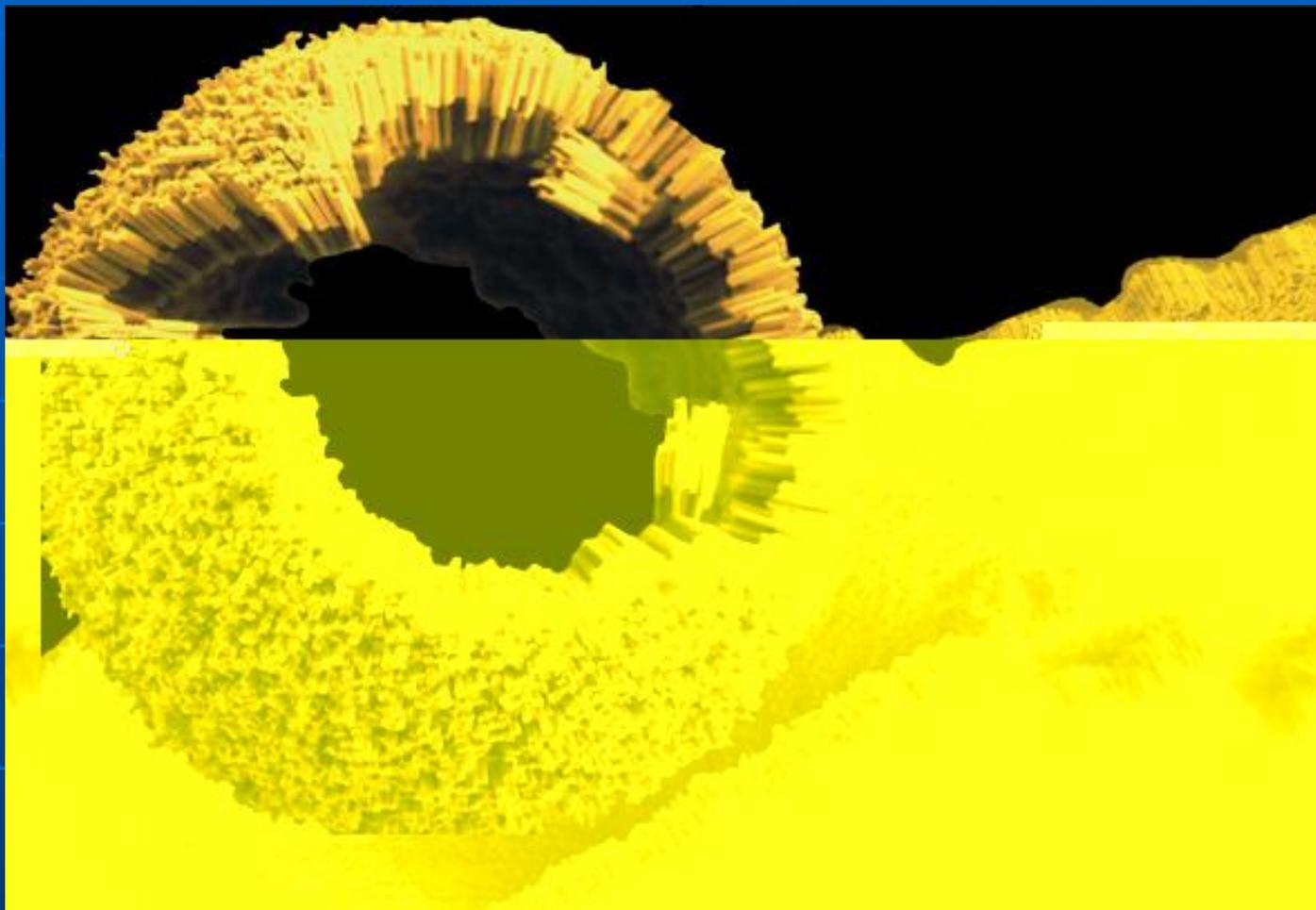


# ТРАНСПОРТНЫЕ СВОЙСТВА НАНОЧАСТИЦ

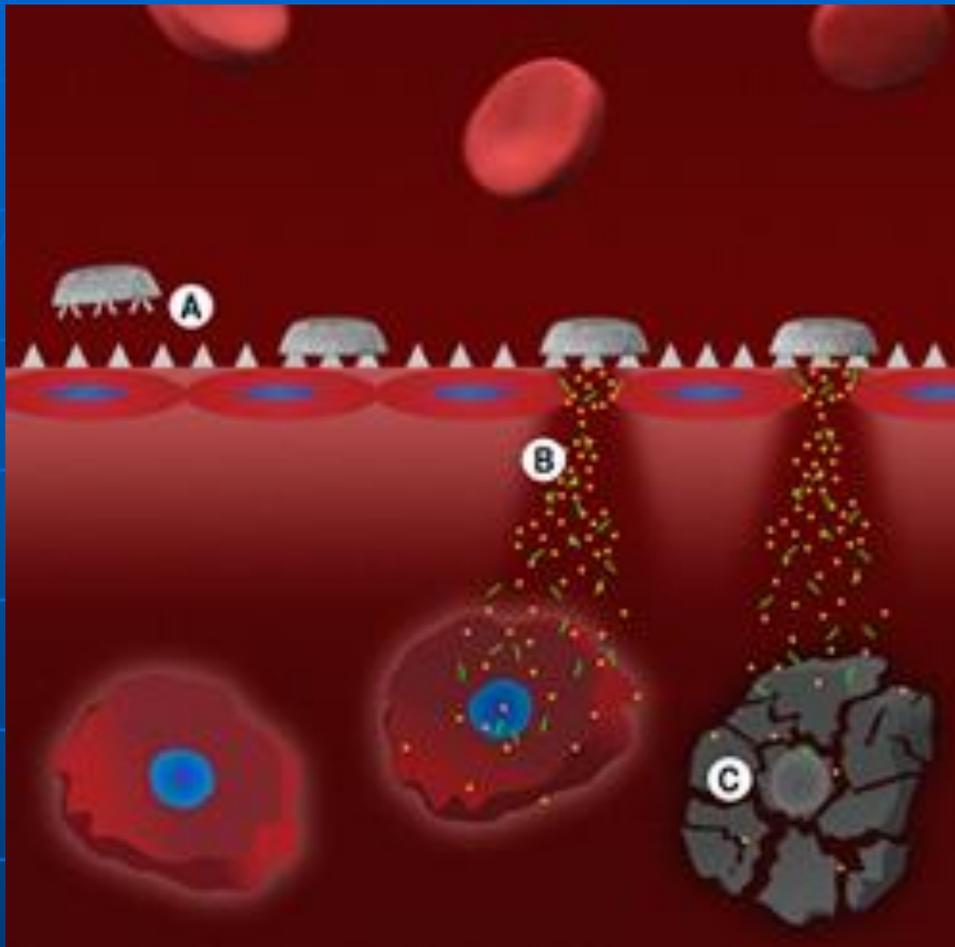
- 1. НЕОРГАНИЧЕСКИЕ НАНОЧАСТИЦЫ (ЗОЛОТЫЕ, СИЛИКАТНЫЕ, МАГНИТНЫЕ И ДР.).
- 2. ОРГАНИЧЕСКИЕ (НА ОСНОВЕ ПОЛИСАХАРИДОВ, ПОЛИАКРИЛАТОВ И ДР.).
- 3. ЛИПОСОМЫ И ПОЛИМЕРНЫЕ НАНОЧАСТИЦЫ.
- 4. ПОЛИМЕРНЫЕ МИЦЕЛЛЫ..
- 5. АКТИВНЫЕ НАНОКРИСТАЛЛЫ.



- Целевая доставка лекарства
- Микроскопические диски из пористого кремния для доставки противоопухолевых средств



«золотой» полимер – потенциальный  
носитель лекарственных препаратов



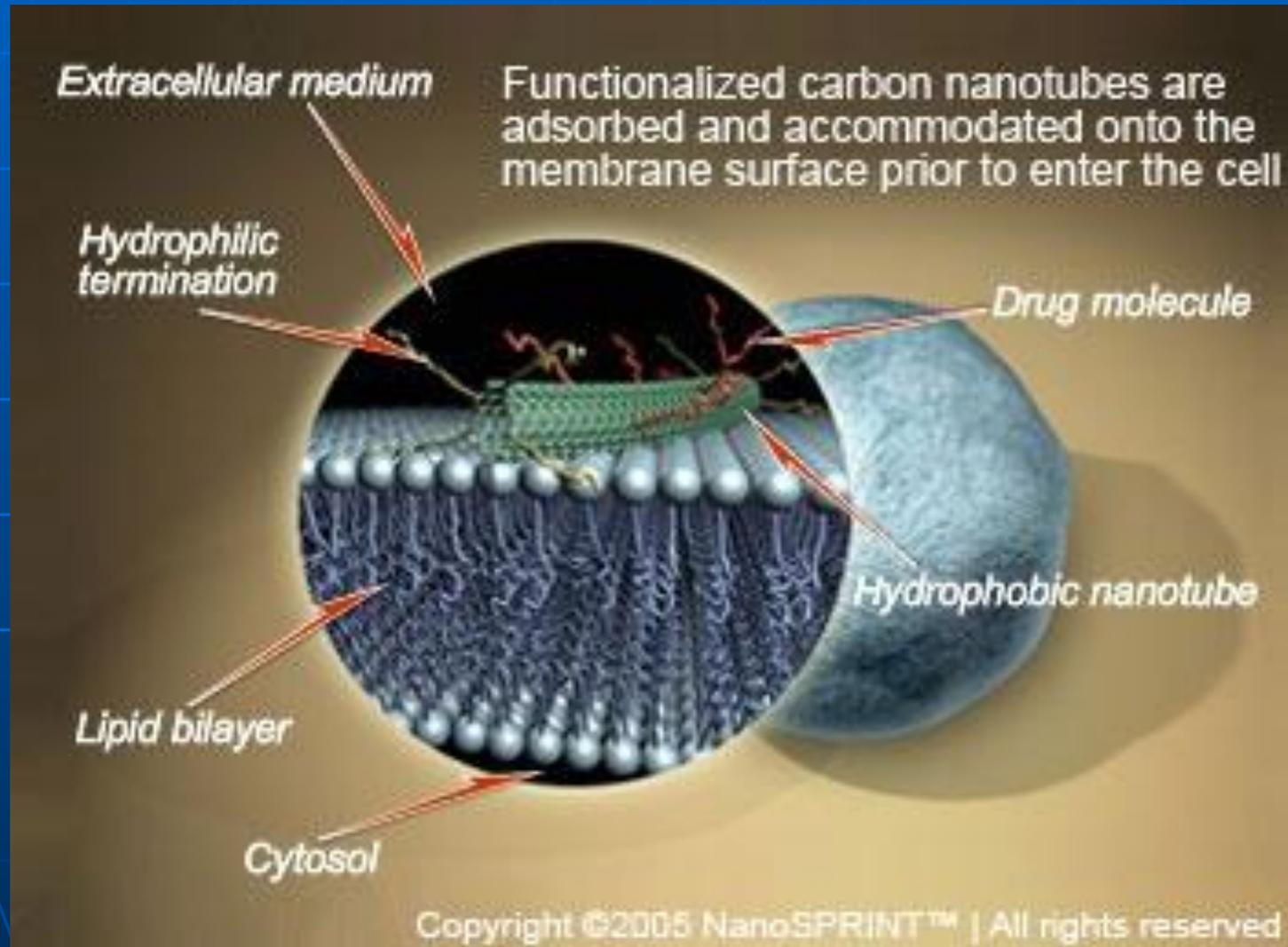
- Многоуровневая система доставки препарата
- На рисунке финальная стадия, **прибытие «нанотранспорта»**

А - приземление

В - проникновение

С - целевая доставка к опухолевой ткани

# ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ НАНОЧАСТИЦ С КЛЕТКОЙ



- Л.в. Встроено в нанотубулы

# ПУТИ ИСПОЛЬЗОВАНИЯ НАНОЧАСТИЦ ДЛЯ СОЗДАНИЯ ЛЕКАРСТВ

- 1.ЛИПОСОМЫ (МУЛЬТИЛАМЕНАРНЫЕ ДО 10 МКМ И СОСТОЯЩИЕ ИЗ 1 ЛАМЕЛЫ -20-50 НМ (ПЛАСТИНКИ) – ПРЕПАРАТ ЦЕЛИКС.
- 2.НАНОСФЕРЫ, НА КОТОРЫХ РАПРЕДЕЛЯЕТСЯ АКТИВНОЕ ВЕЩЕСТВО – ПРЕПАРАТ ПЕГАСИС (ЛЕЧ. ГЕПАТИТА С).
- 3.НАНОКАПСУЛЫ СОСТОЯЩИЕ ИЗ ПОЛИМЕРНОЙ ОБОЛОЧКИ, ОХВАТЫВАЮЩЕЙ ПОЛОСТЬ С ЖИДКОСТЬЮ – ПРЕПАРАТ НЕЙЛАСТА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ НЕЙТРОПЕНИИ.
- 4.АКТИВНЫЕ НАНОКРИСТАЛЛЫ (200-600 НМ) В ВИДЕ СУСПЕНЗИИ.
- 5.ДЕНДРИМЕРЫ (ДЕРЕВО) РАЗВЕРТВЛЁННЫЕ ДО РАЗМЕРОВ МЕЛКИХ ПРОТЕИНОВ, НА НИХ РАСПОЛАГАЕТСЯ ДЕЙСТВУЮЩЕЕ ВЕЩЕСТВО, ПРИМЕР – ВИВИГЕЛЬ, ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ СПИДА.

# НОВЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ

- ПРЕДНАЗНАЧЕНЫ ДЛЯ  
КОНТРОЛИРУЕМОЙ ДОСТАВКИ  
ЛЕКАРСТВЕННОГО ВЕЩЕСТВА В  
ОПРЕДЕЛЁННЫЕ УЧАСТКИ  
ОРГАНИЗМА С ЦЕЛЬЮ УПРАВЛЕНИЯ  
ТЕРАПЕВТИЧЕСКИМ ЭФФЕКТОМ

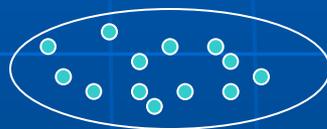
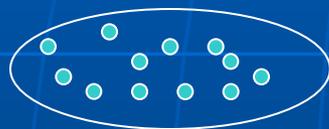
# ЗАДАЧИ СОЗДАНИЯ НОВЫХ СИСТЕМ И СРЕДСТВ ДОСТАВКИ ЛЕКАРСТВ

- 1.ПОВЫШЕНИЕ БИОДОСТУПНОСТИ,
- 2.УВЕЛИЧЕНИЕ ДЛИТЕЛЬНОСТИ ДЕЙСТВИЯ,
- 3.ЦЕЛЕНАПРАВЛЕННАЯ ДОСТАВКА К ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЙ МИШЕНИ.

# ВИДЫ ПЕРОРАЛЬНЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ С МОДИФИЦИРОВАННЫМ ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ

- 1. УЛУЧШАЮЩИЕ РАСТВОРИМОСТЬ, ВСАСЫВАНИЕ, ПОВЫШАЮЩИЕ БИОДОСТУПНОСТЬ,
- 2. С КОНТРОЛИРУЕМЫМ ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ Л. В.,
- 3. С ПУЛЬСИРУЮЩИМ ИЛИ ОТСРОЧЕННЫМ ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ Л. В.,
- 4. С ЦЕЛЕНАПРАВЛЕННЫМ ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ Л. В. В РАЗНЫХ ОТДЕЛАХ ЖКТ.

# РАЗЛИЧНЫЕ ВИДЫ МАТРИКСОВ ЛЕКАРСТВ



Гелеобразующий

нерастворимый

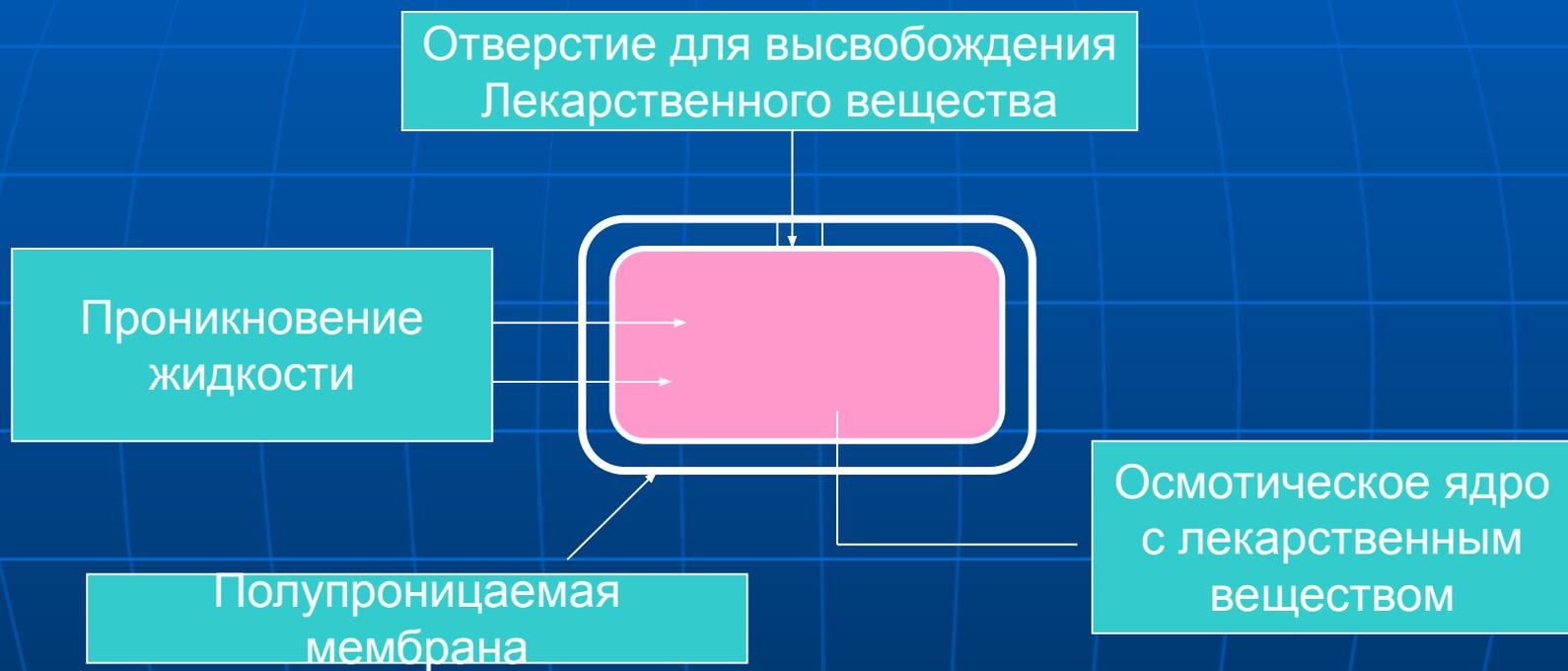
растворимый

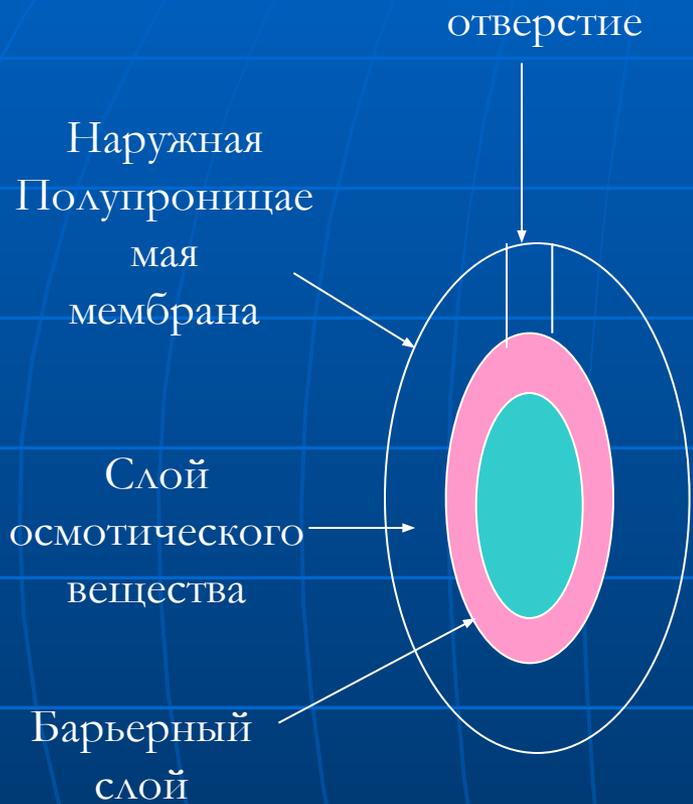
матрицы

# ТЕХНОЛОГИИ МОДИФИЦИРОВАННОГО ВЫСВОБОЖДЕНИЯ Л.В.

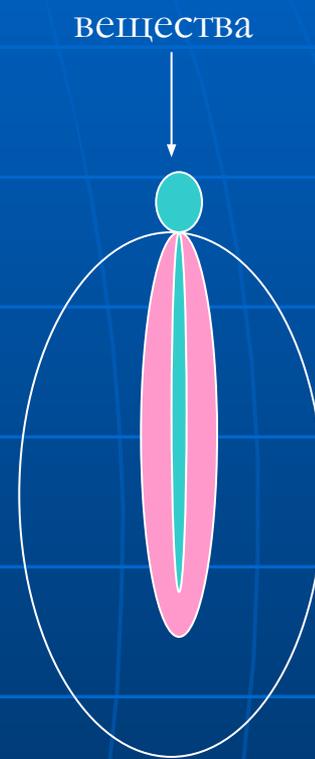
- 1.МАТРИКСНЫЕ ТАБЛЕТКИ,
- 2.ОСМОТИЧЕСКИЕ СИСТЕМЫ,
- 3.РЕЗЕРВУАРНЫЕ СИСТЕМЫ С  
ДОЗИРУЮЩИМИ ОБОЛОЧКАМИ,
- 4.МНОЖЕСТВЕННЫЕ  
МИКРОГРАНУЛЫ (ПИЛЛЕТЫ),

# СХЕМА СТРОЕНИЯ ТАБЛЕТКИ ОСМОТИЧЕСКОГО ДЕЙСТВИЯ

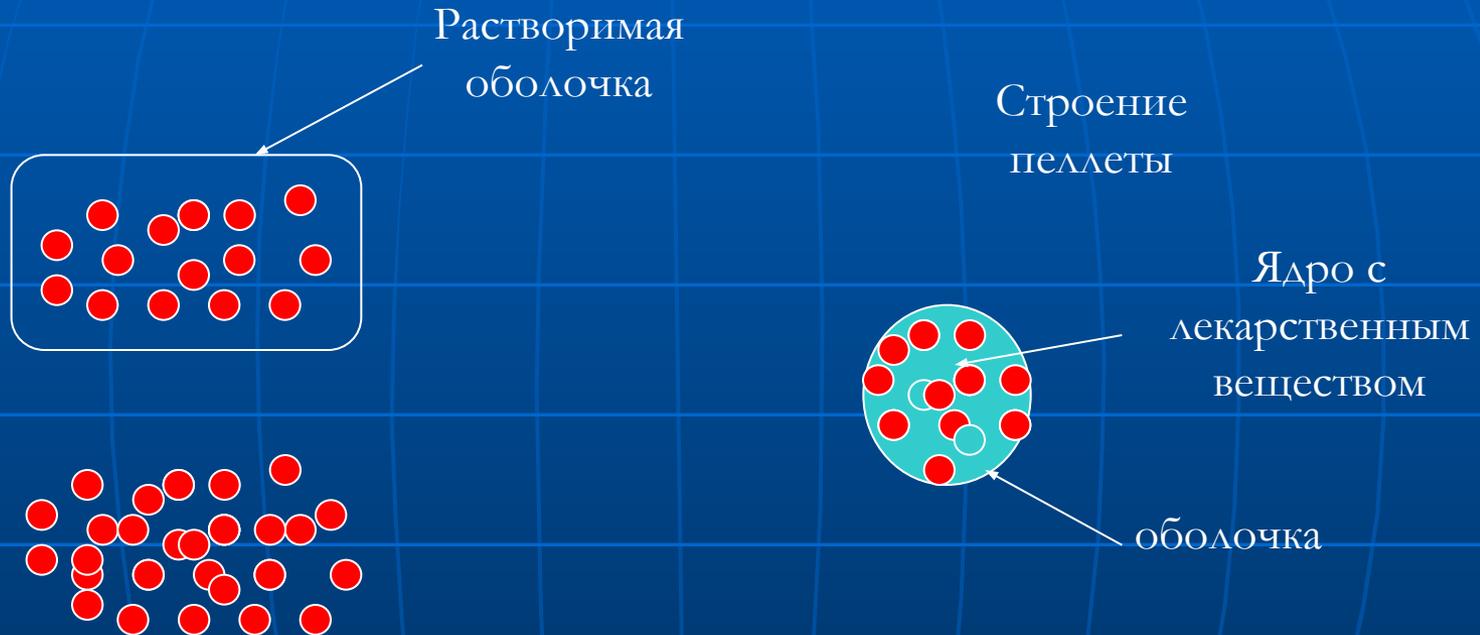




Высвобождение  
Лекарственного  
вещества



# СТРОЕНИЕ ТАБЛЕТКИ С СИСТЕМОЙ МНОЖЕСТВЕННЫХ ПЕЛЛЕТ

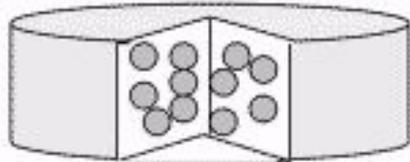


- МЕТОПРОЛОЛ, НИФЕДИПИН, ВЕРАПАМИЛ, ДИЛТИАЗЕМ И ДР.



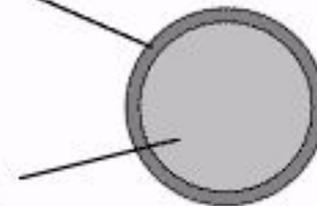
# МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ПЕРОРАЛЬНОЙ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ С ПУЛЬСИРУЮЩИМ ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ

**Таблетка метопролола  
CR/XL**



Полимерная  
мембрана

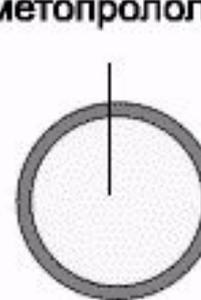
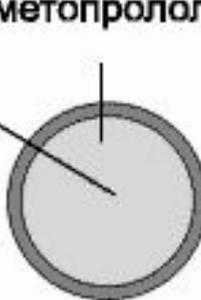
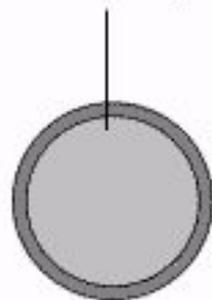
Твердый  
метопролол  
сукцинат



Твердый  
метопролол

Насыщенный  
раствор  
метопролола

Ненасыщенный  
раствор  
метопролола

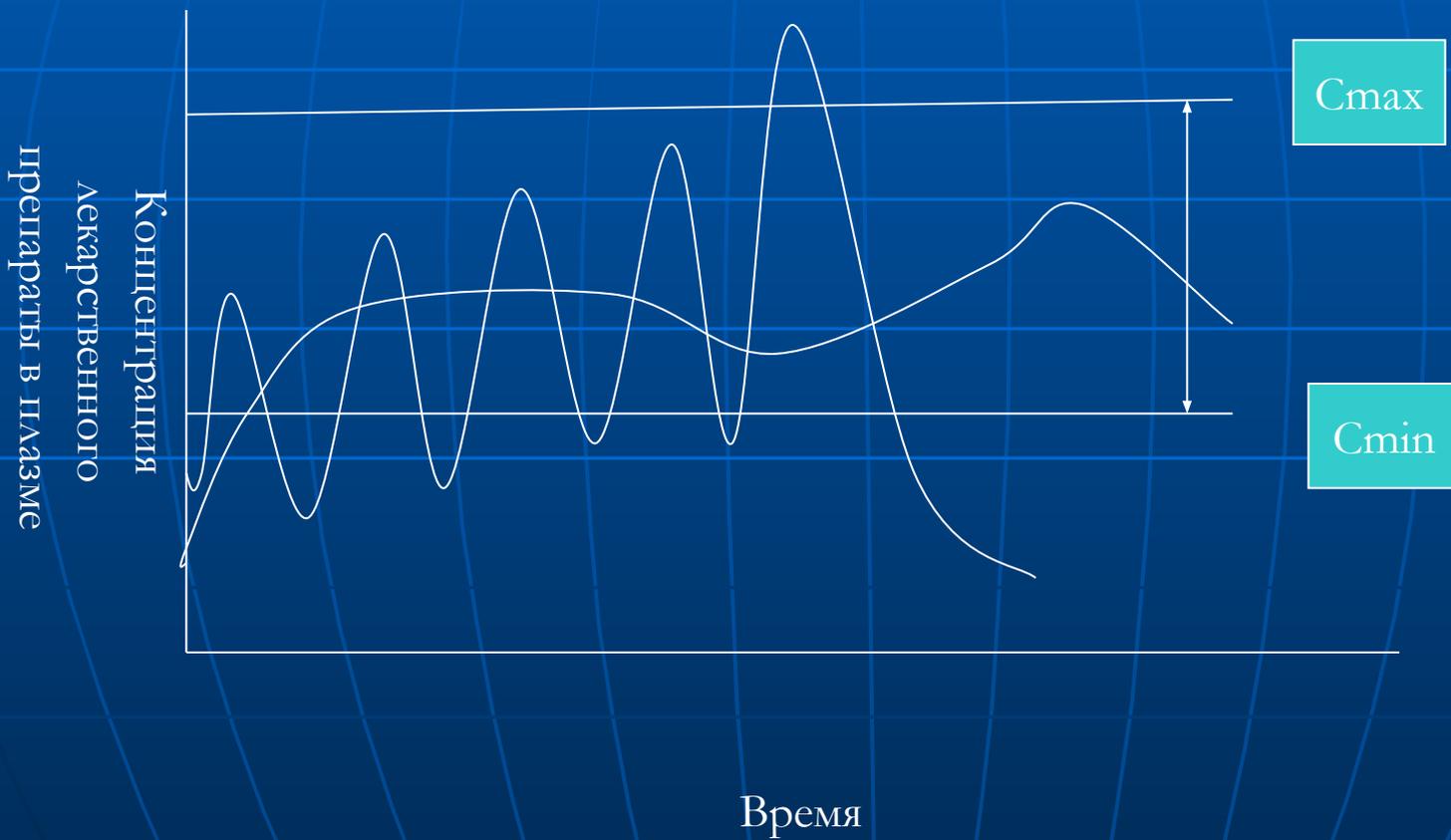


**Фаза 1**

**Фаза 2**

**Фаза 3**

- **КОНТРОЛИРУЕМОЕ ВЫСВОБОЖДЕНИЕ  
МЕТОПРОЛОЛА**



# ИНТРАНАЗАЛЬНАЯ ДОСТАВКА ЛЕКАРСТВ

- ЭТО СПЕЦИФИЧЕСКИЙ СПОСОБ  
ВВЕДЕНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ  
ПРЕПАРАТОВ ПУТЁМ ИХ РАСПЫЛЕНИЯ В  
НОСОВОЙ ПОЛОСТИ

# ПРЕИМУЩЕСТВА ИНТРАНАЗАЛЬНОЙ ДОСТАВКИ ЛЕКАРСТВ

- 1. НАЛИЧИЕ ЦЕНТРАЛЬНОГО ДЕЙСТВИЯ
- 2. ВЫСОКАЯ БИОДОСТУПНОСТЬ
- 3. ОТСУТСТВИЕ ПЕРВОГО ЭФФЕКТА ПРОХОЖДЕНИЯ ЧЕРЕЗ ПЕЧЕНЬ
- 4. УДОБСТВО И ЛЁГКОСТЬ ПРИМЕНЕНИЯ
- 5. БЫСТРОТА РАЗВИТИЯ СИСТЕМНОГО ЭФФЕКТА

# НЕКОТОРЫЕ ПРЕПАРАТЫ ДЛЯ ИНТРАНАЗАЛЬНОГО ПРИМЕНЕНИЯ

- 1.СТАДОЛ (БУТОРФАНОЛ)
- 2.ИМИГРАН (СУМАТРИПТАН)
- 3.АДИУРЕТИН СД (ДЕСМОПРЕССИН)
- 4.ОКСИТОЦИН (ОКСИТОЦИН)
- 5.БЕКОНАЗЕ (БЕКЛОМЕТАЗОН)
- 6.МИАКАЛЬЦИК (КАЛЬЦИТОНИН)
- 7.ПОЛИОКСИДАНИЙ (ПОЛИОКСИДОНИЙ) И ДР.

# ТРАНСДЕРМАЛЬНЫЕ ТЕРАПЕВТИЧЕСКИЕ СИСТЕМЫ

- ЭТО СПЕЦИАЛЬНАЯ СЛОЖНАЯ  
ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА,  
ПРЕДНАЗНАЧЕННАЯ ДЛЯ ВВЕДЕНИЯ  
ЛЕКАРСТВ ЧЕРЕЗ КОЖУ БЕЗ  
ИНЪЕКЦИЙ.

# СТРОЕНИЕ КОЖИ

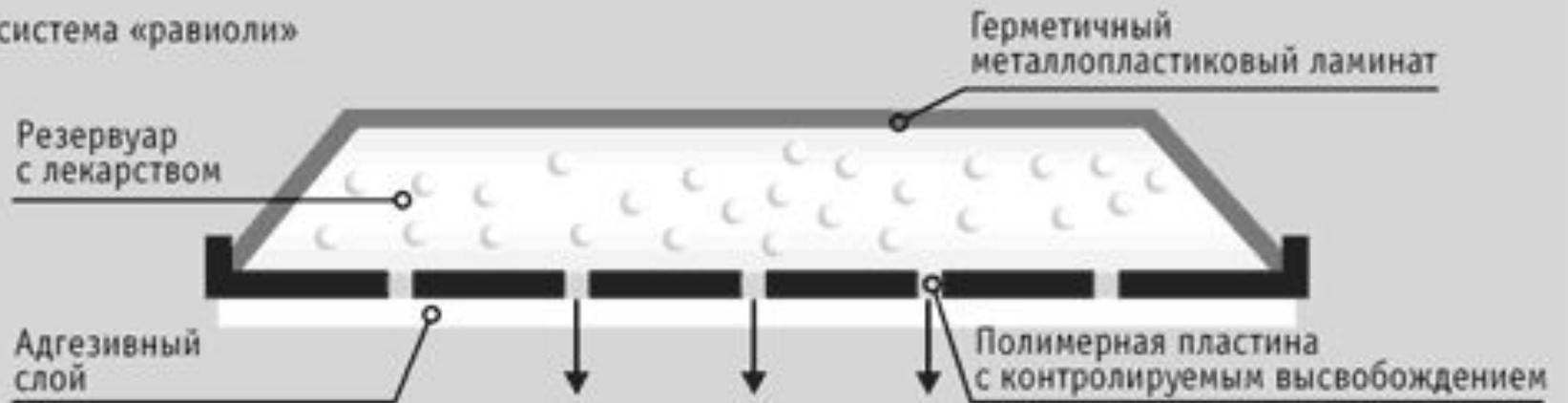


- ТРУДНОПРОХОДИМА ДЛЯ ЛЕКАРСТВ

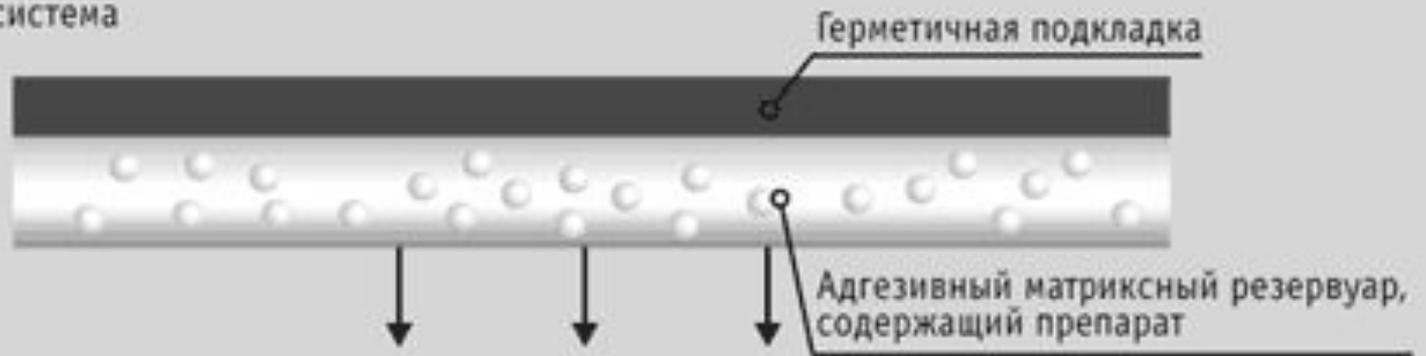
# СТРУКТУРА ТТС

- 1. ОСНОВНАЯ МЕМБРАНА, ПРЕДОТВРАЩАЮЩАЯ ВЫСВОБОЖДЕНИЕ ЛВ,
- 2. ЛЕКАРСТВЕННЫЙ РЕЗЕРВУАР,
- 3. МЕМБРАНА ОБЕСПЕЧИВАЮЩАЯ ОПТИМАЛЬНУЮ СКОРОСТЬ ВЫСВОБОЖДЕНИЯ ЛВ,
- 4. КЛЕЙ,
- 5. ЗАЩИТНАЯ ПЛЁНКА ДЛЯ ХРАНЕНИЯ СИСТЕМЫ.

а) система «равиоли»



б) матричная система



## ■ ВИДЫ ТТС

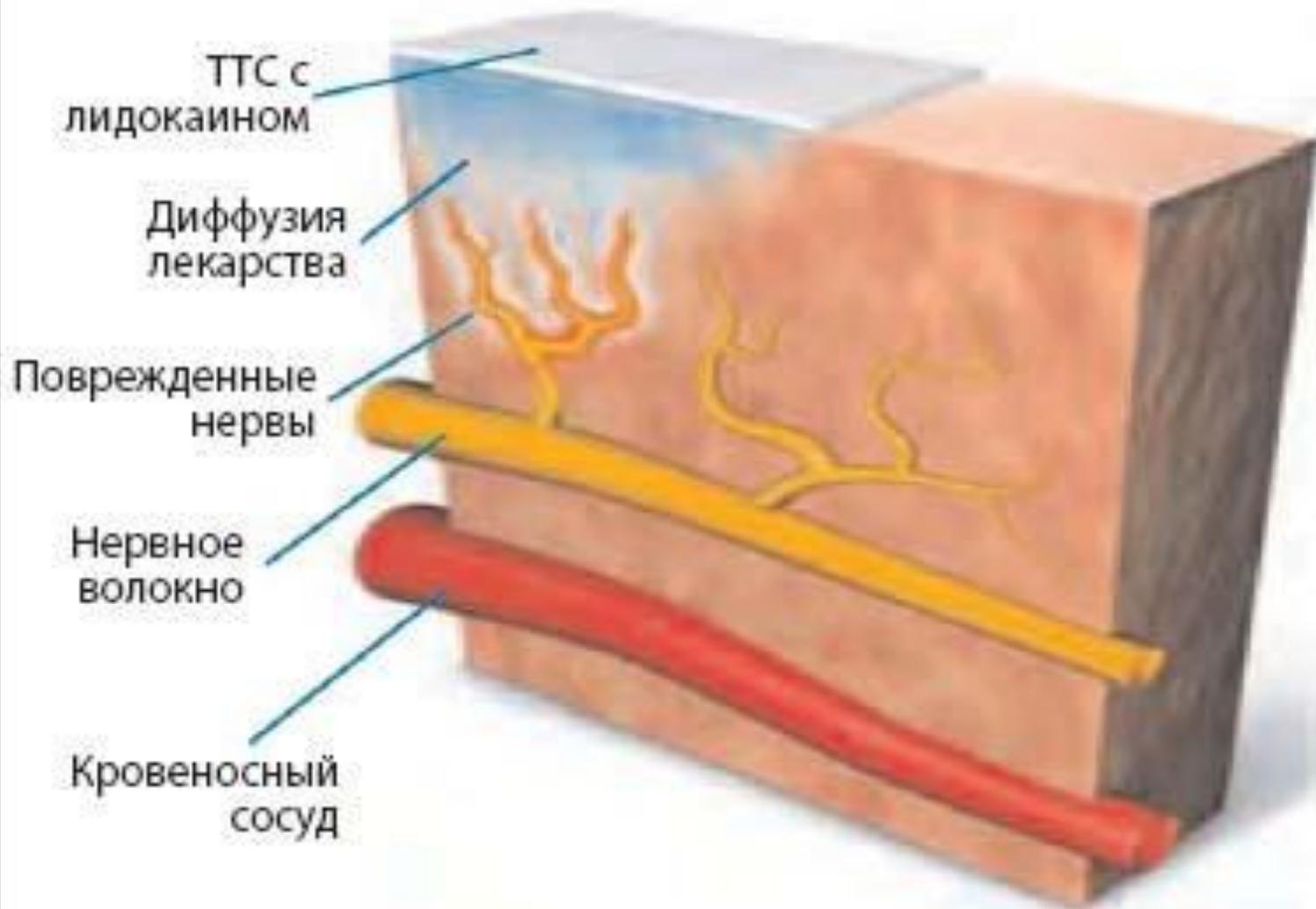
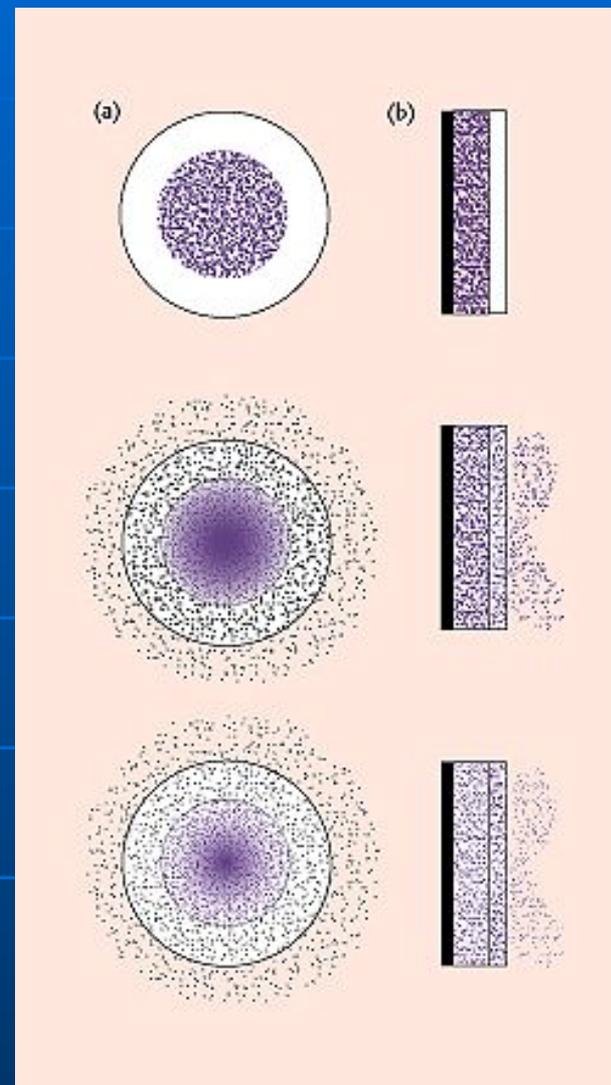
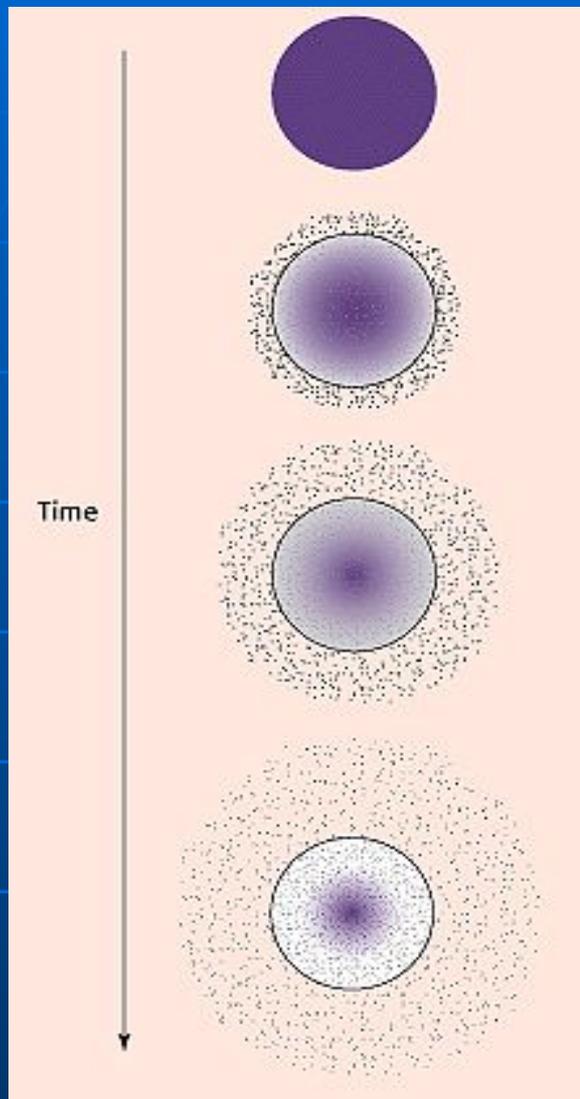


Рис. 1. Действие ТТС с 5% лидокаином при постгерпетической невралгии



Высвобождения лекарственного вещества из

- традиционной матрицы,
- модифицированного препарата для приема внутрь и
- трансдермальной формы

# СОВРЕМЕННЫЕ ТТС

- 1.НИКОТИНЕЛ (НИКОТИН),
- 2.НИТРО-ДУР (НИТРОГЛИЦЕРИН),
- 3.ДЕПОНИТ (НИТРОГЛИЦЕРИН),
- 4.ДЮРОГЕЗИК (ФЕНТАНИЛ),
- 5.КЛИМАРА (ЭСТРАДИЛ),
- 6.ТРАНСДЕРМ СКОП (СКОПОЛАМИН),
- 7.ТЕСТОДЕРМ (ТЕСТОСТЕРОН)