

Тема лекции:

Фармакодинамика

Доцент кафедры общей и клинической
фармакологии с курсом ФПК и ПК

Владимир Михайлович Концевой

Первичная фармакологическая реакция

Это начальный этап
взаимодействия
лекарственного вещества с
биологическим субстратом
организма.

Известны следующие биосубстраты
организма, которые являются
«мишенями» для действия
лекарств:

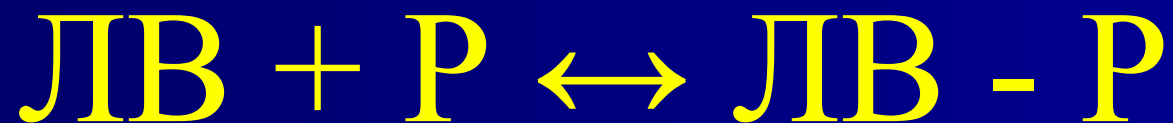
1. Рецепторы
2. Ионные каналы
3. Ферменты
4. Транспортные системы

Рецепторы — специальные белковые молекулы клеток, расположенные в мембранах или в цитоплазме, с которыми в физиологических условиях взаимодействуют эндогенные регуляторы (гормоны, медиаторы и др.)

С рецепторами обычно
взаимодействуют
лекарственные вещества,
которые по своему
химическому строению
имеют сходство с
эндогенными регуляторами.

В основе взаимодействия лекарственного вещества с рецептором лежит образование химических связей между их молекулами так, как это бывает при химическом взаимодействии веществ.

Чаще всего такое взаимодействие выражается уравнением обратимой химической реакции:



Агонисты при взаимодействии с рецептором вызывают такой же эффект, как и эндогенный регулятор, так как они обладают аффинитетом (сродство к рецептору) и внутренней активностью (способны активировать рецептор).

Антагонисты связываются с рецептором, но не активируют его, так как у них нет внутренней активности.

АГОНИСТЫ, ВЫЗЫВАЮЩИЕ
МАКСИМАЛЬНЫЙ ЭФФЕКТ,
НАЗЫВАЮТ ПОЛНЫМИ АГОНИСТАМИ.

Частичные агонисты при
взаимодействии с теми же
рецепторами не вызывают
максимального эффекта, так как
у них слабая внутренняя
активность.

По характеру взаимодействия с рецептором лекарственного вещества делят на три категории: агонисты, частичные агонисты и антагонисты

Лекарственное вещество	Аффинитет	Внутренняя активность
Агонист	+	+
Частичный агонист	+	+
Антагонист	+	-

Конкурентные антагонисты блокируют те же участки рецепторов, с которыми взаимодействуют эндогенные регуляторы или агонисты. Они устраняют эффекты агонистов в определенном диапазоне концентраций.

Неконкурентные антагонисты образуют ковалентные связи с рецептором или действуют алостерически.

Конечные эффекты лекарственных средств

Это изменение функций клеток, органов или систем организма, которые возникают в итоге взаимодействия лекарственного вещества с биологическим субстратом.

В зависимости от

характера и механизма

изменения функций

выделяют следующие

виды действия лекарств.

Тонизирующее действие

Это повышение
функции от низкого
значения до
нормального уровня.

Возбуждающее действие

Это увеличение
функции выше
нормального уровня.

Седативное действие

Снижение функции до
нормы.

Угнетающее действие

Снижение функции
ниже нормы

Парализующее действие

Полное прекращение
функции.

В зависимости от
локализации и
механизма развития
различают следующие
действия лекарств.

Местное действие

Это эффекты, которые
возникают на месте
контакта
лекарственного
вещества с тканью.

Системное действие

Оно развивается после всасывания и распределения лекарственного вещества в организме, когда оно реагирует с биологическими

Рефлекторное действие

Это рефлекторные реакции
в ответ на
стимулирование
лекарственным веществом
окончаний афферентных
нервов.

Прямое действие

Изменение функций органа,
в результате действия
лекарственного вещества
на биосубстрат этого же
органа.

Косвенное действие

Это изменение функций органа, обусловленное действием лекарственного вещества на биосубстрат другого органа.

Косвенное действие может возникнуть рефлекторно.

Например. Вдыхание паров аммиака вызывает раздражение рецепторов носа и это рефлекторно приводит к усилению дыхания.

Избирательное действие

возникает при

взаимодействии

лекарственного

вещества с

рецепторами одного

типа.

Неизбирательное
действие развивается
при взаимодействии
лекарственного
вещества с
рецепторами разных
ТИПОВ.

Обратимое действие —
функция возвращается к
исходному уровню после
диссоциации комплекса
лекарственное вещество —
рецептор.

Необратимое действие
возникает при
образовании
ковалентных связей
между лекарственным
веществом и
рецептором.

Главное действие — это эффект лекарственного вещества, который вызывают с целью лечения, профилактики или диагностики заболевания.

Все остальные эффекты, возникающие после введения лекарственного вещества, относят к побочным эффектам, которые в свою очередь делят на аллергические и неаллергические.

В основе аллергического действия лежит сенсibilизация организма лекарственным веществом, при котором развивается иммунная реакция, ведущая к повреждению органов или тканей.

При использовании лекарственных веществ необходимо тщательное наблюдение за их действием на организм человека с целью ранней профилактики и коррекции **нежелательных эффектов.**

Токсическое действие лекарственных веществ развивается при их чрезмерном введении в организм и проявляется в остром или хроническом отравлении.

С целью детоксикации используют соответствующие методы лечения (применение антагонистов, антидотов, гемодиализ, гемосорбция).

Тератогенное действие приводит к нарушению процессов эмбриогенеза и возникновению аномалий развития. Поэтому не следует применять лекарственные вещества в первые 3 месяца беременности, когда осуществляется эмбриогенез.

Эмбриотоксическое

действие — это токсическое действие, которое проявляется у эмбриона (до 12 недель беременности).

Фетотоксическое

действие проявляется у
плода (после 12 недель
беременности).

Мутагенное действие —

это изменение в генах,

вызываемое

лекарственным

веществом.

Канцерогенное

действие – способность
лекарственного вещества
вызывать развитие рака.