

ЛЕКЦИИ ПО ФАРМАКОЛОГИИ

Вводная лекция

Зав.каф. фармакологии, проф.,
д.м.н. Резников К.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.



ФАРМАКОЛОГИЯ

Ф.кинетика
Ф.динамика
Ф.химия
Техн. лек. форм
Лек. токсикол.
и т.д.

Терапия

Хирургия

Педиатрия

Инф. болезни

Стоматология

ЛОР-болезни

Акушерство

Патологическая физиология

Патологическая анатомия

Анатомия

Биология

Гистология

Физиология

Биохимия

Микробиология

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 применяются 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, наркозные 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 – самый посещаемый, сайт MEDI.RU, сайт 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

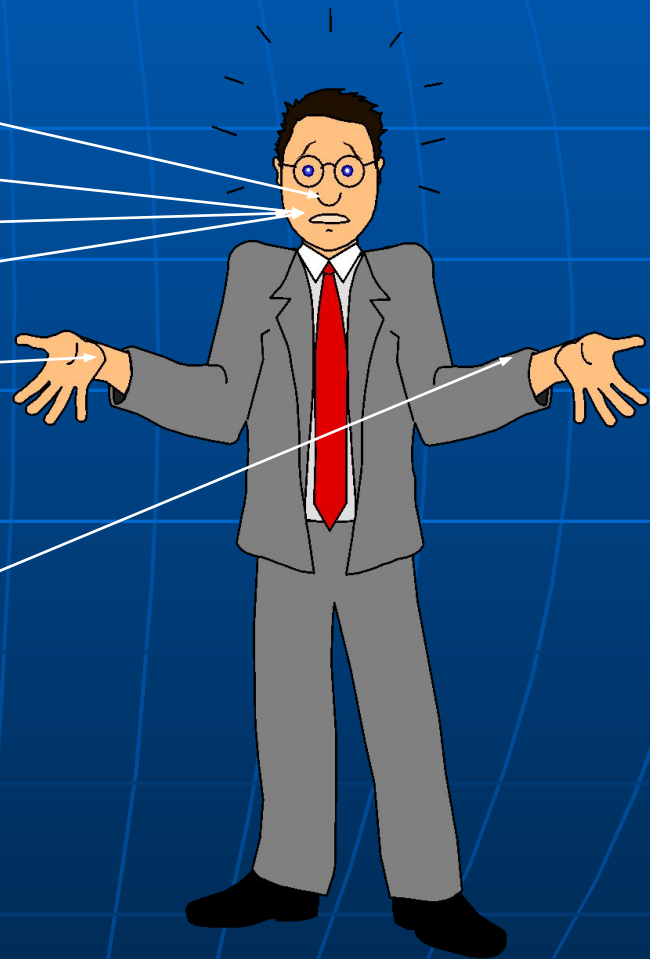
- Высвобождение из лекарственной формы
- Всасывание (адсорбция)
- Распределение
- Метаболизм
- Выведение (экскреция)

Пути введения

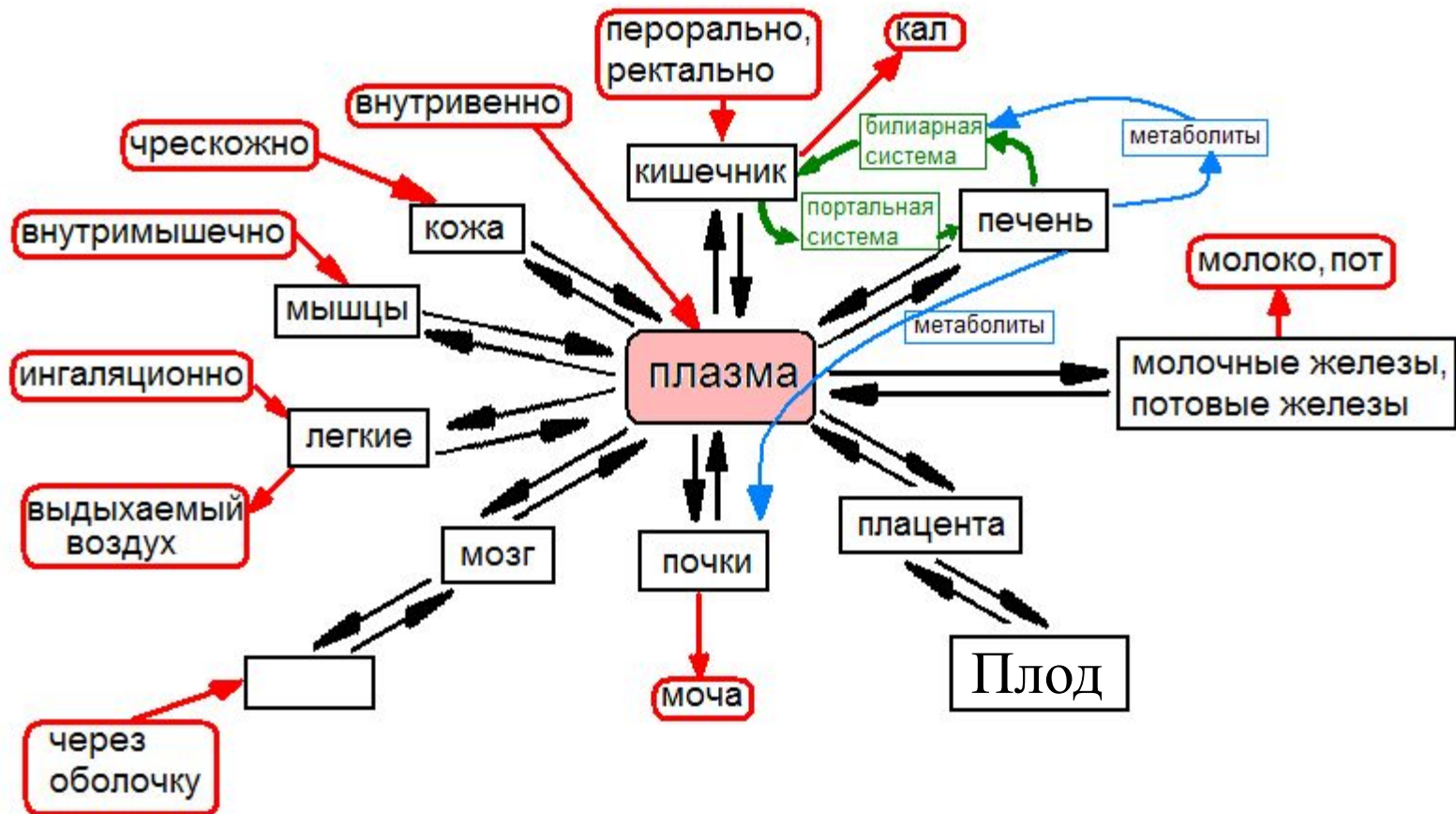
1. Энтеральный путь
2. Парентеральный путь
 - неинъекционные и
 - инъекционные

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

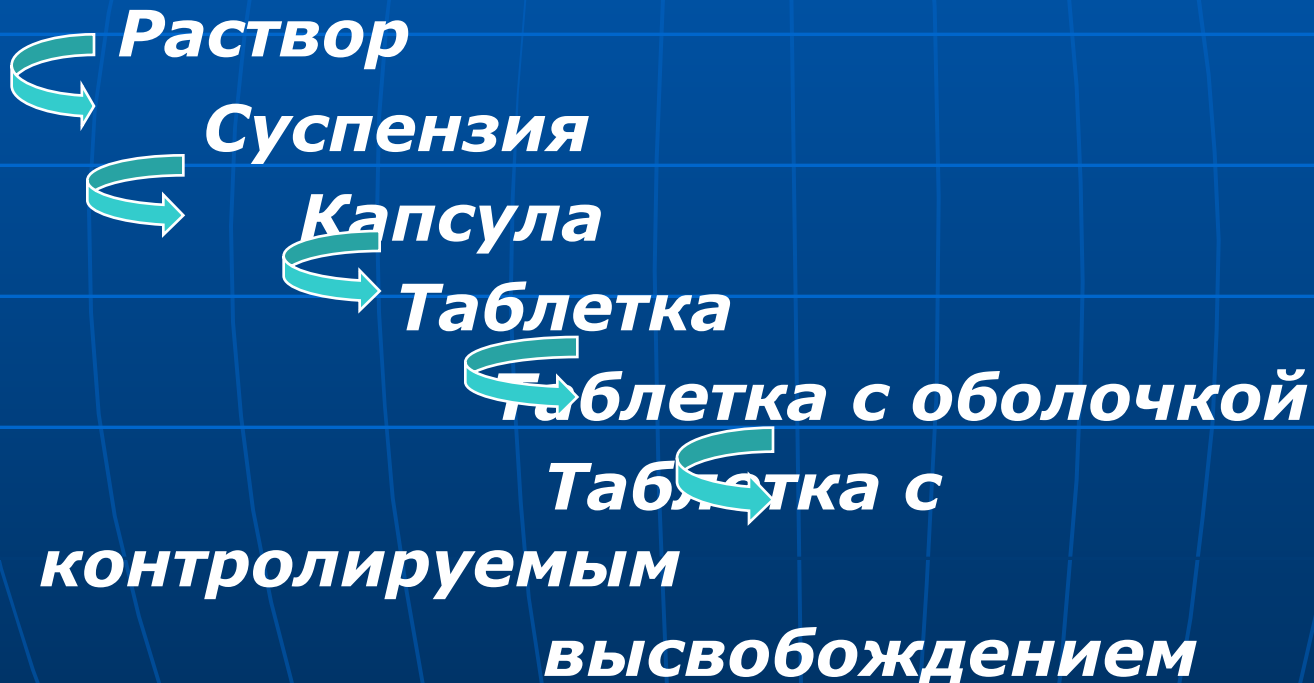


Поступление и удаление лекарственных веществ



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

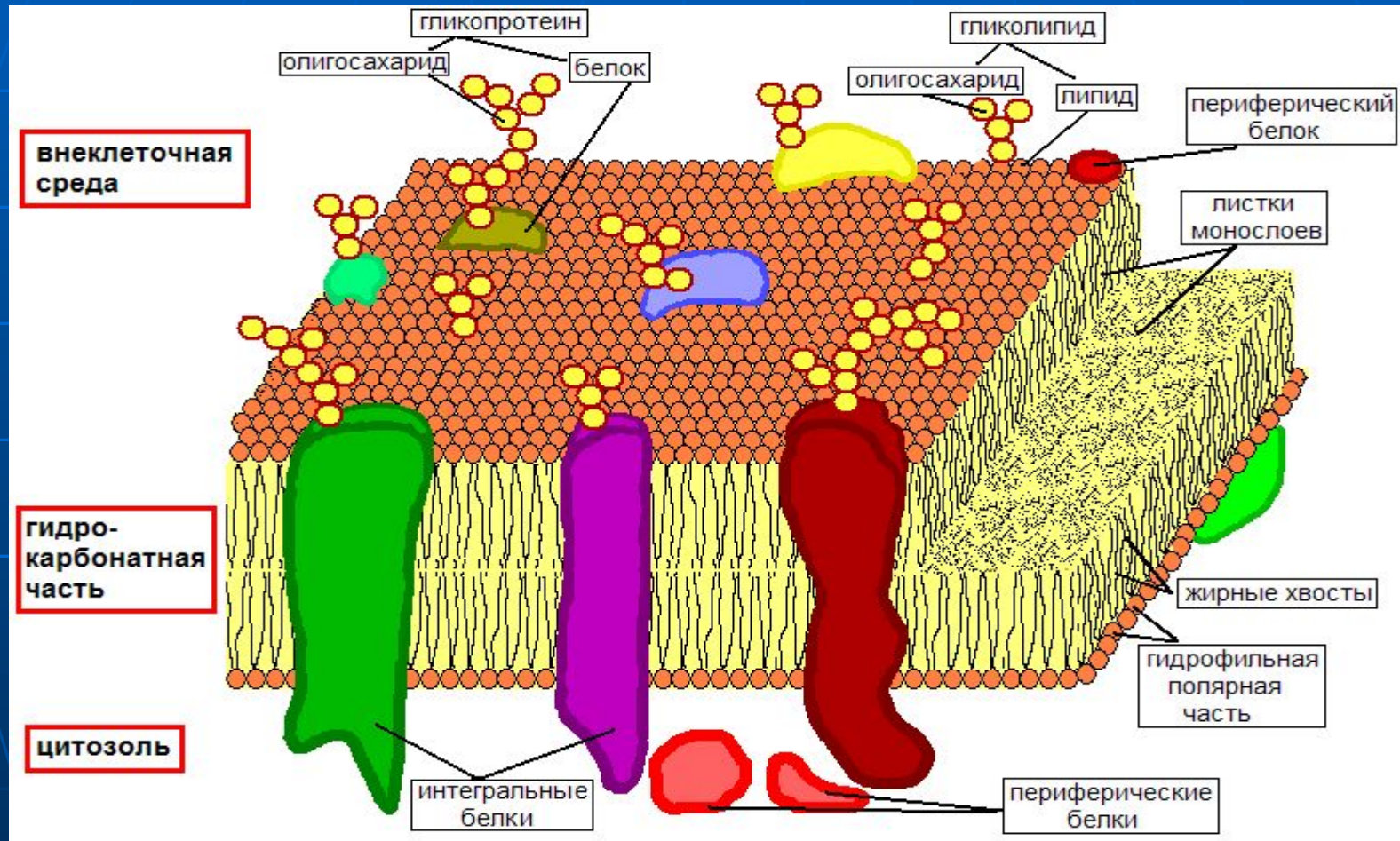
Разновидности

- 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



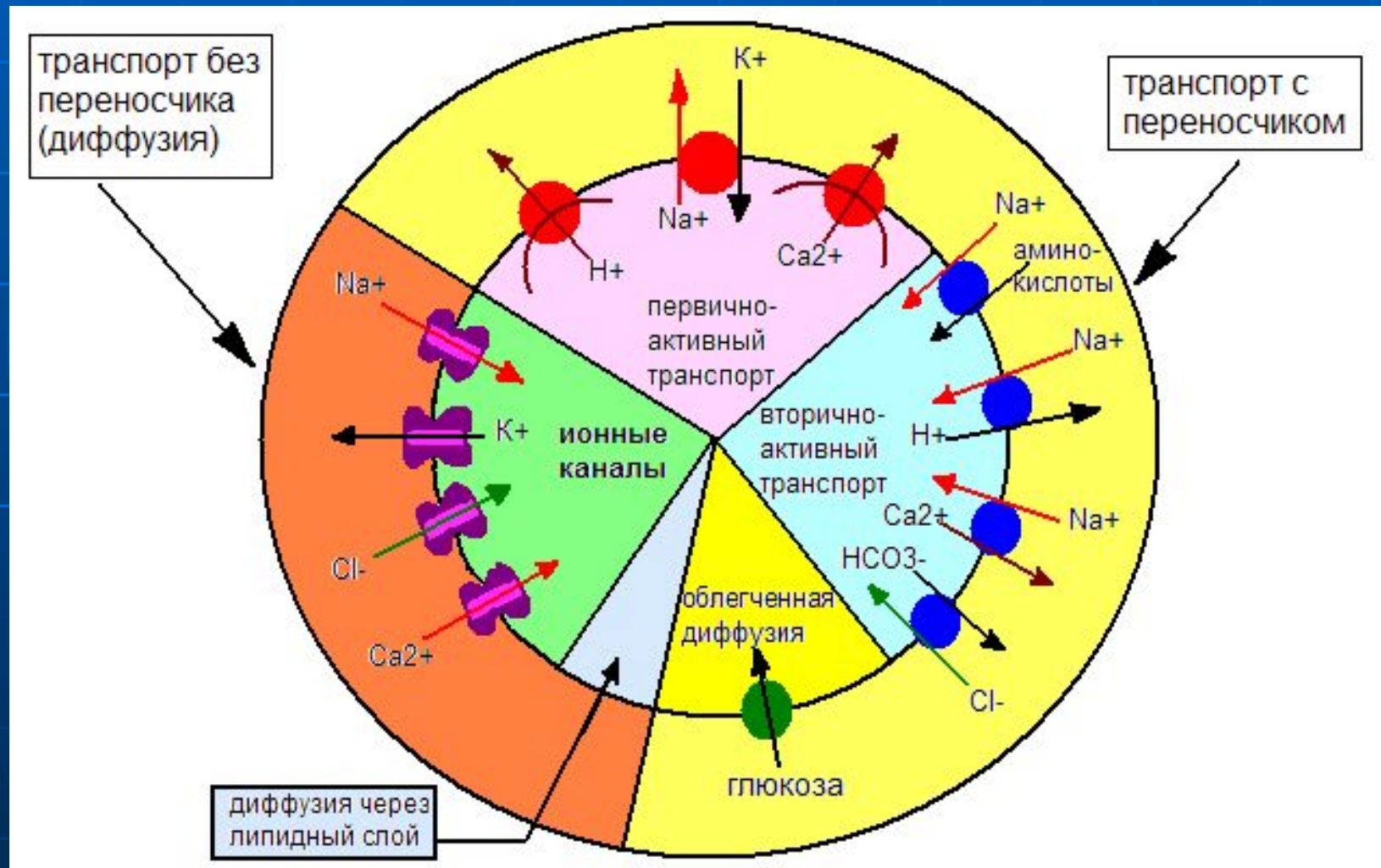
Всасывание

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 Na^+

внутриклеточная 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:

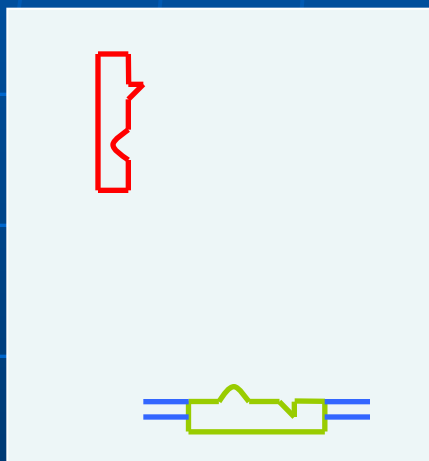
- Почки
- ЖКТ
- С молоком
- Со слюзью, слюной, потом
- С выдыхаемым воздухом

Фармакодинамика

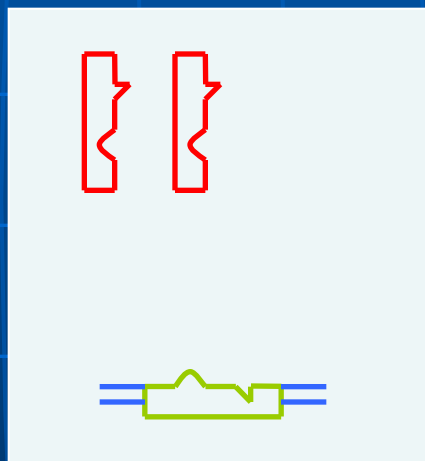
Фармакодинамика – это раздел фармакологии, изучающий механизмы взаимодействия лекарственных веществ с живыми системами, и эффекты этого взаимодействия.

Взаимодействие ЛВ с рецепторами

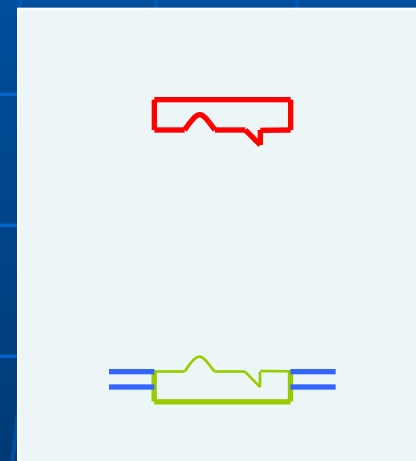
Этапы взаимодействия:



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.

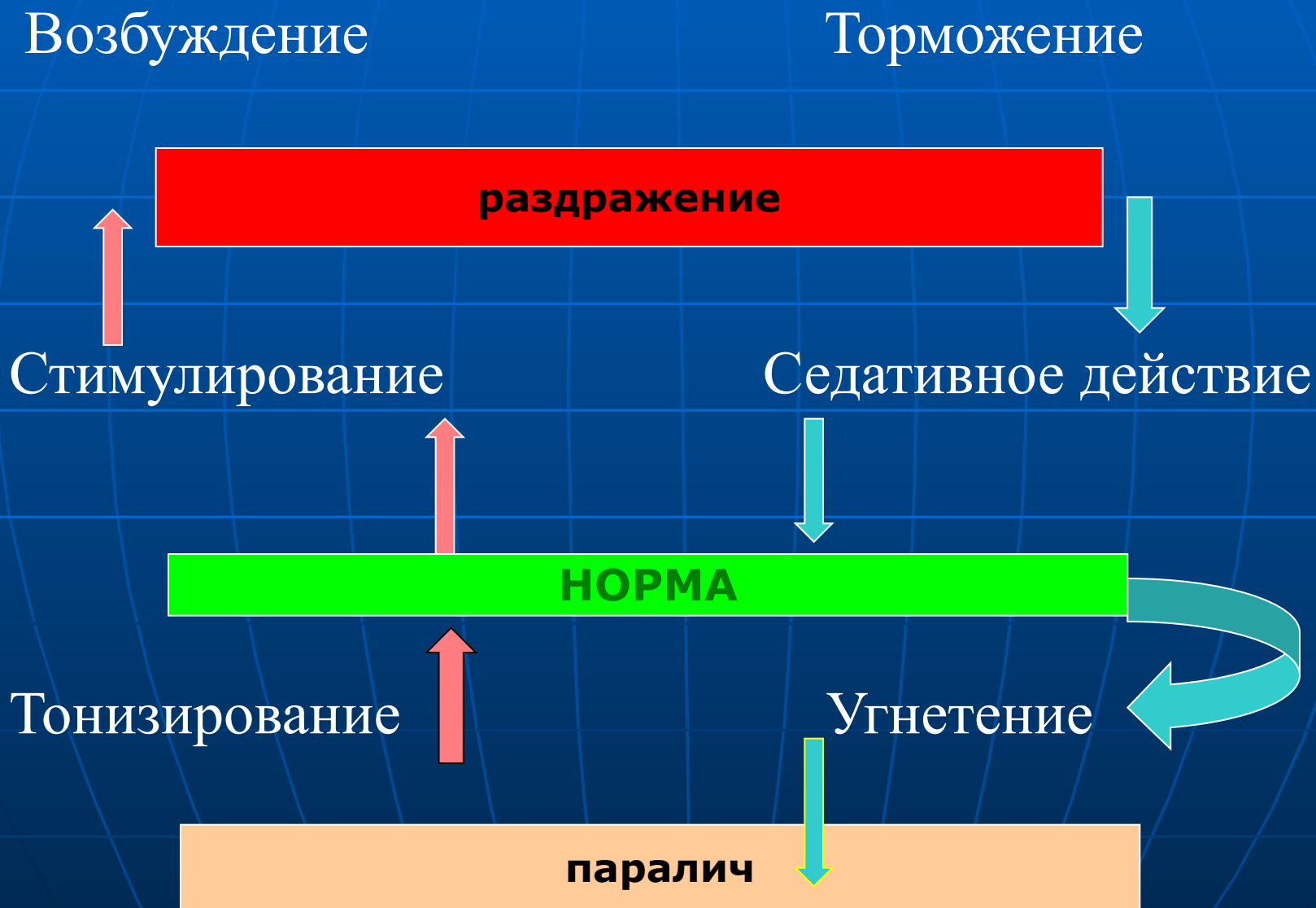
Типовые конечные эффекты:

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

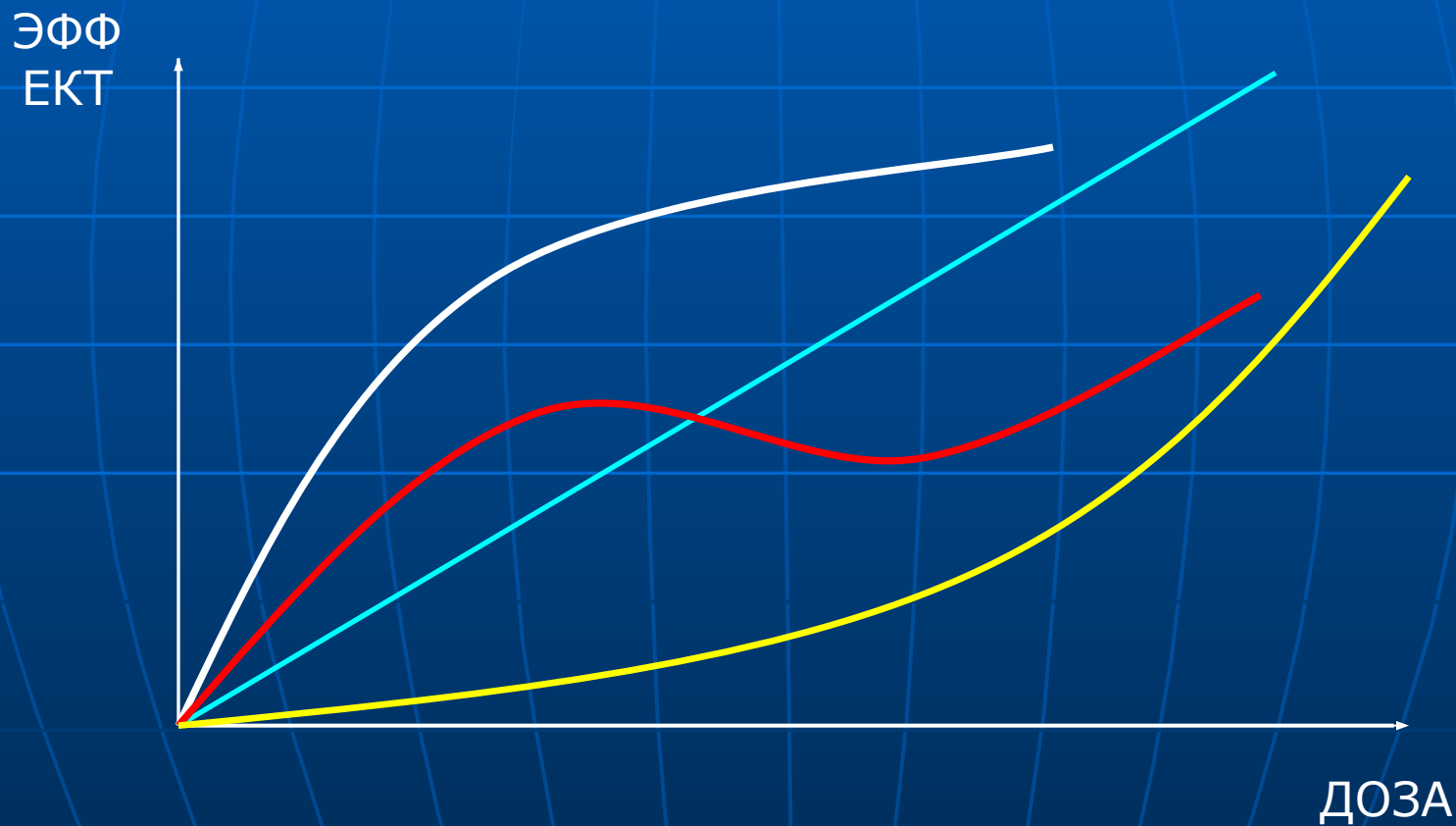
Влияние окружающей среды

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

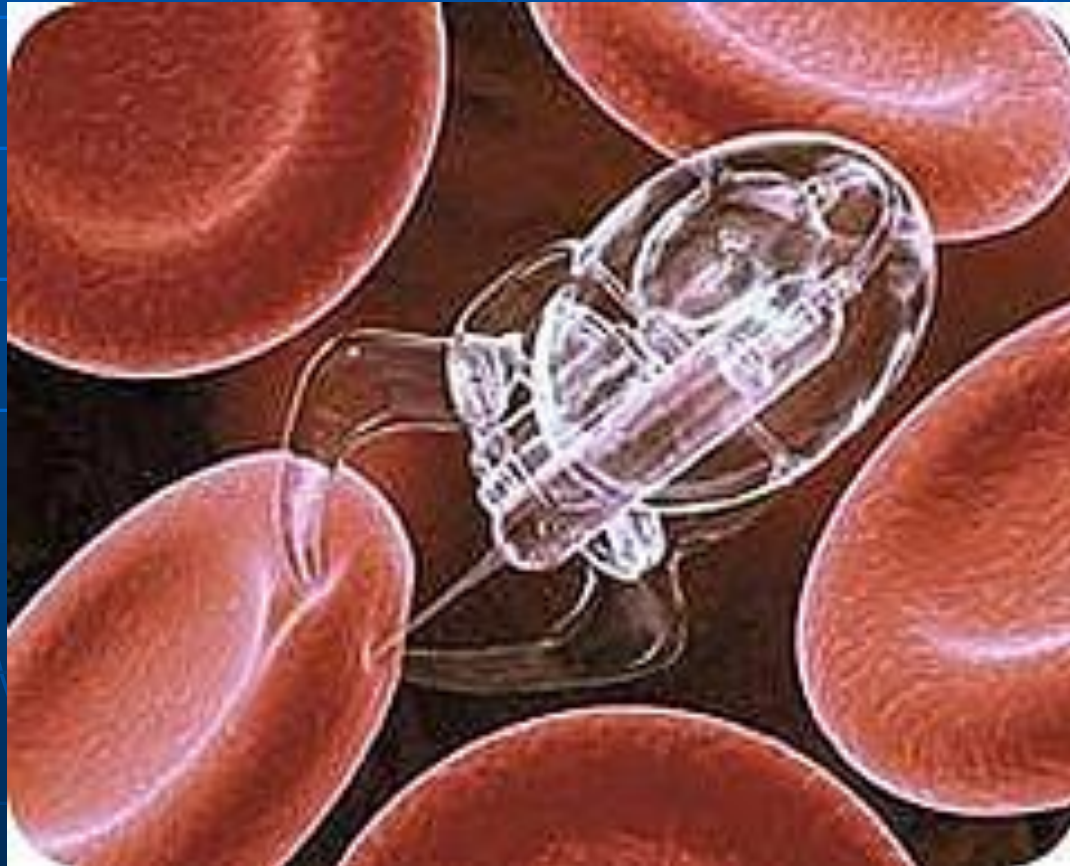
Зависимость от дозы:

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

Характер зависимости эффекта от дозы препарата

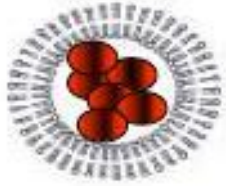


НАНОТЕХНОЛОГИИ

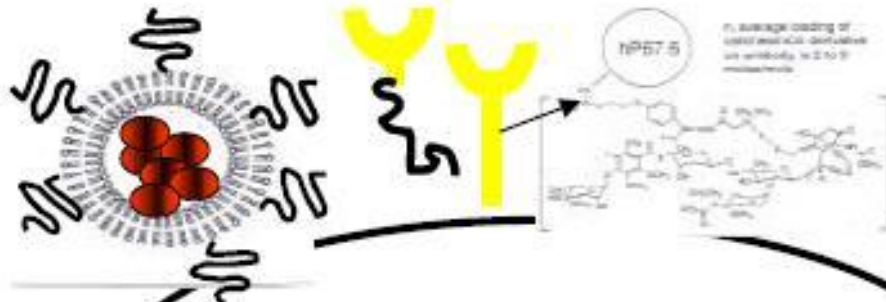


Many "Nanomedicines" are already in routine clinical use

Liposomes
Bangham, Gregoriadis



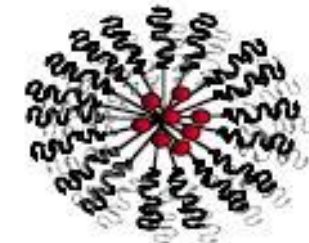
Antibodies and their Conjugates
Celltech-UCB



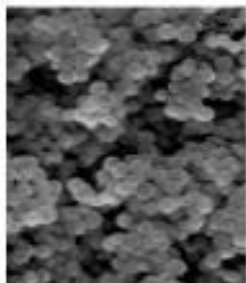
Viruses as viral vectors for gene therapy
Seymour



polymer micelles



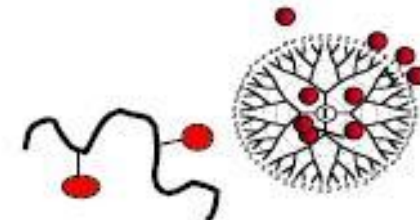
Nanoparticles
Florence, Daves, Illum



Polymer-protein conjugates



Unimolecular Polymeric Drugs and Conjugates
Duncan



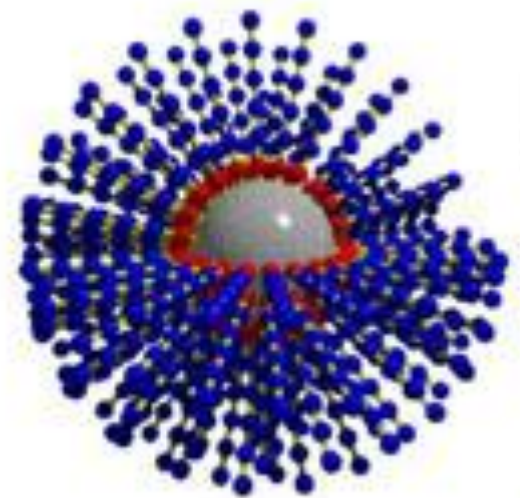
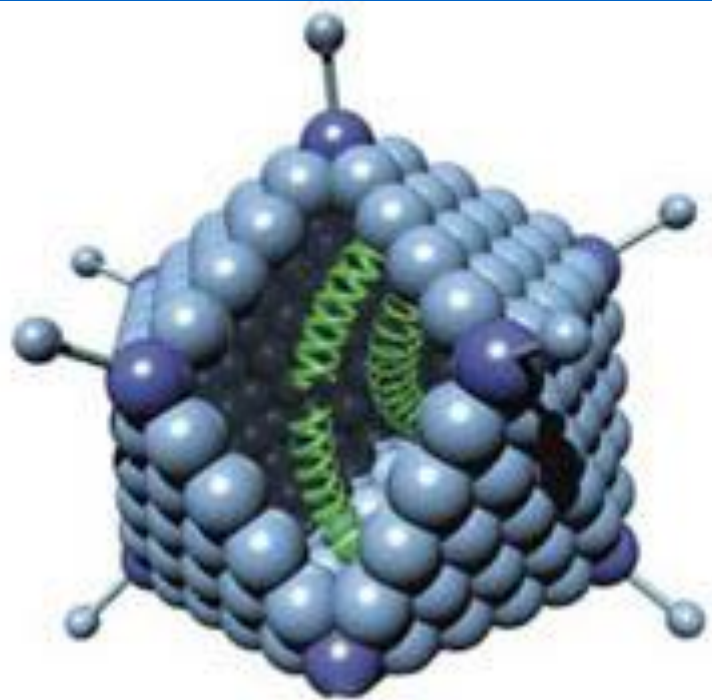
Nanomedicines

НАНОТЕХНОЛОГИИ В ФАРМАКОЛОГИИ

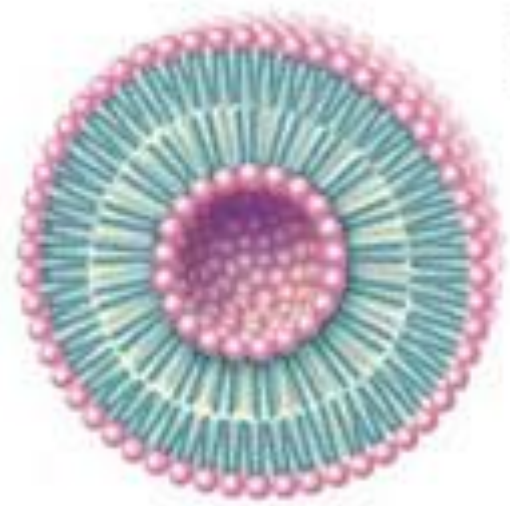
- НАНОТЕХНОЛОГИИ ОПЕРИРУЮТ С ОБЪЕКТАМИ НАНОМЕТРИЧЕСКОГО РАЗМЕРА (ОТ ГРЕЧ. NANNOS –» КАРЛИК») НАЗЫВАЮТСЯ НАНОТЕХНОЛОГИЯМИ. ЭТИ ОБЪЕКТЫ ИСЧИСЛЯЮТСЯ МИЛЛИАРДНЫМИ ДОЛЯМИ МЕТРА
- 10^{-9} .

ОБЛАСТИ ПРИМЕНЕНИЯ НАНОТЕХНОЛОГИЙ

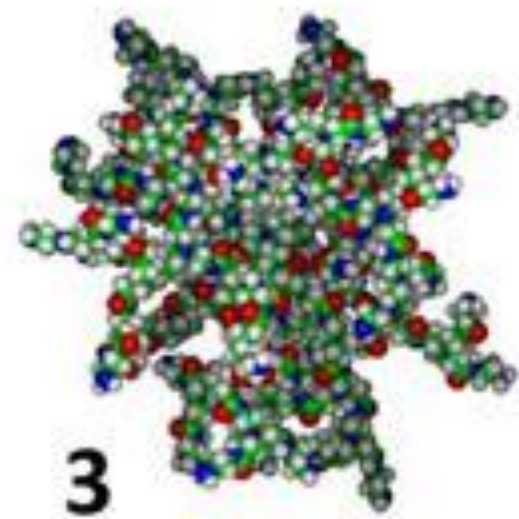
- 1. АНАЛИТИЧЕСКИЕ
НАНОТЕХНОЛОГИИ ДЛЯ
ДИАГНОСТИКИ.
- 2. НАНОТЕХНОЛОГИИ ДЛЯ
ТРАНСПОРТА ЛЕКАРСТВ.
- 3. НАНОМАТЕРИАЛЫ.
- 4. НАНОРОБОТЫ В МЕДИЦИНЕ.



2



1



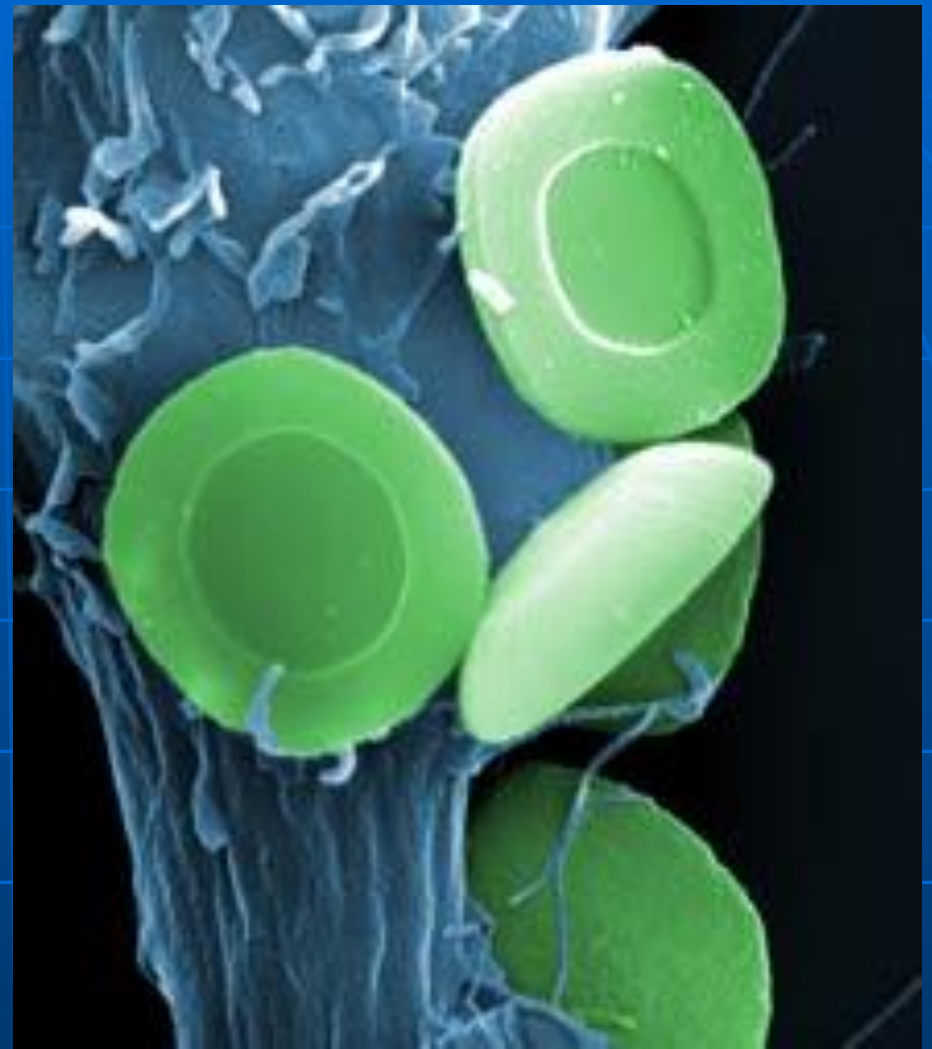
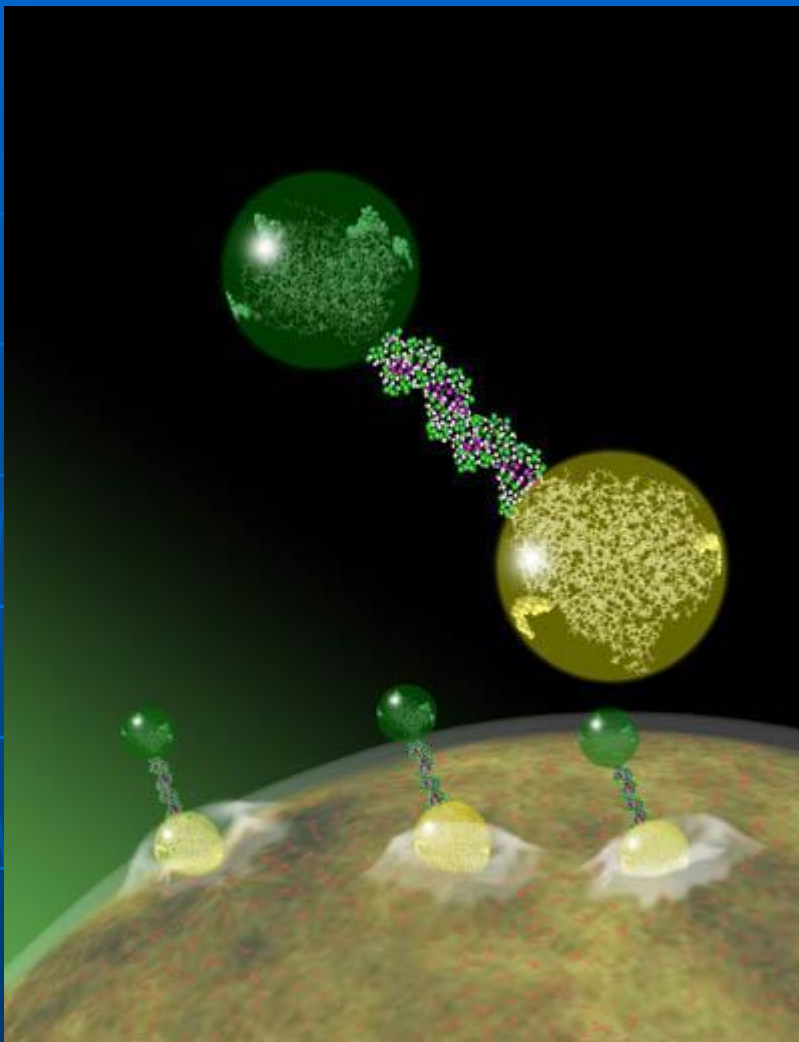
3



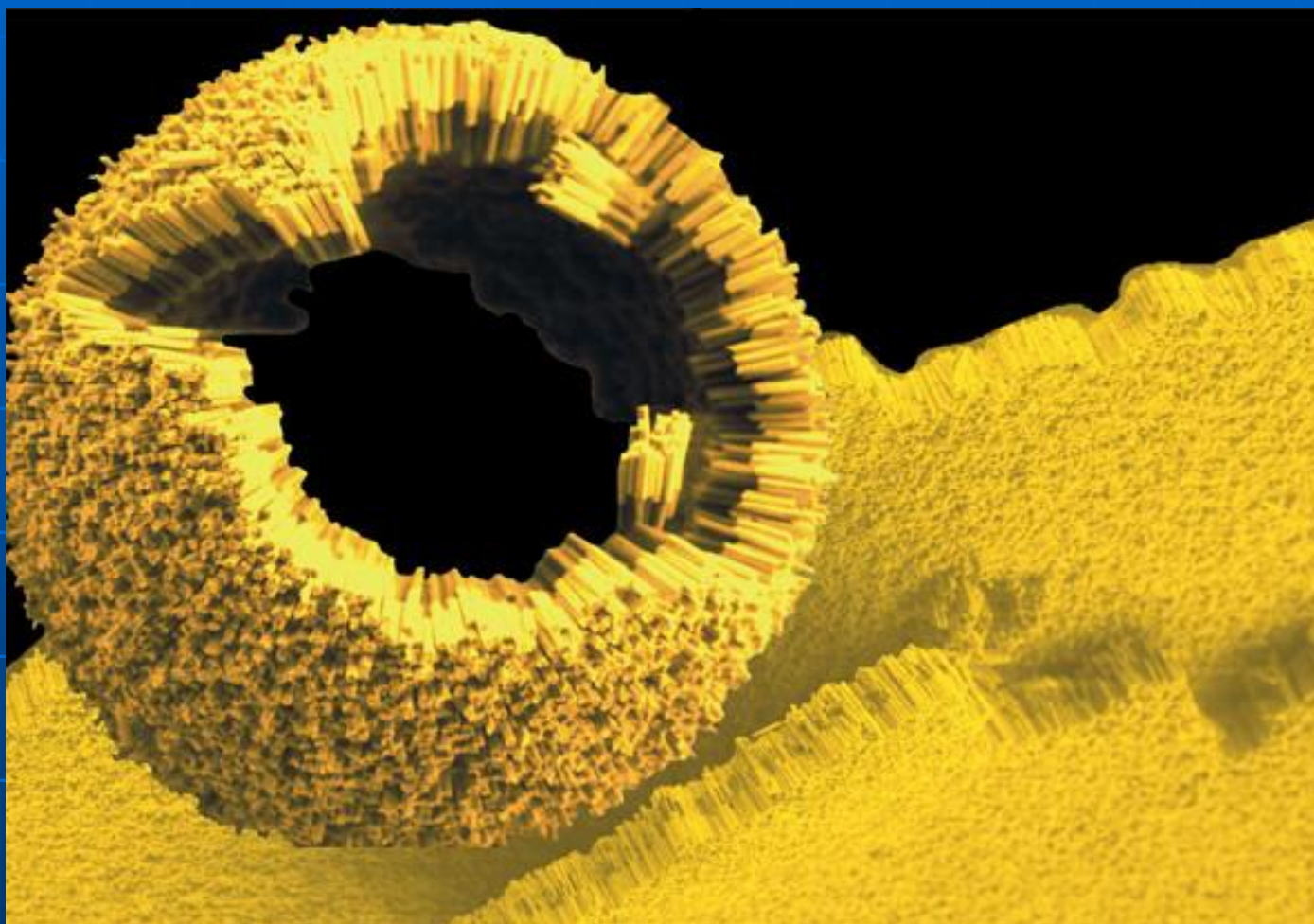
4

ТРАНСПОРТНЫЕ СВОЙСТВА НАНОЧАСТИЦ

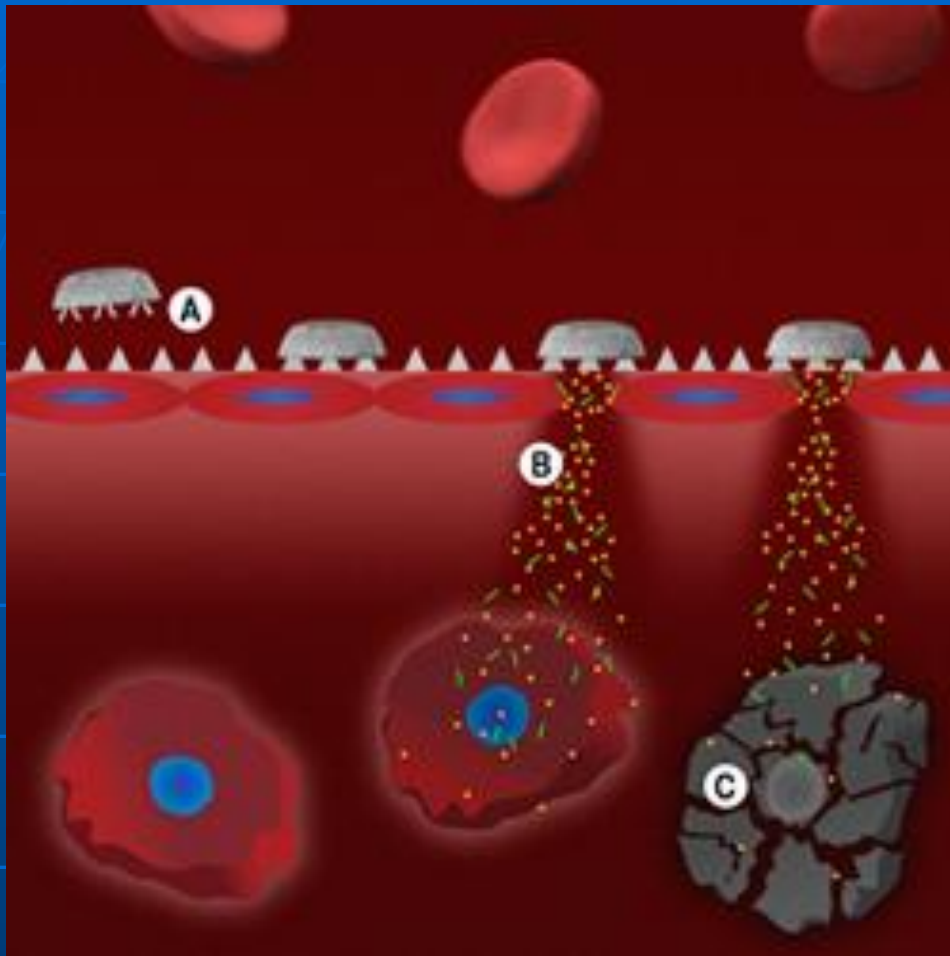
- 1. НЕОРГАНИЧЕСКИЕ НАНОЧАСТИЦЫ (ЗОЛОТЫЕ, СИЛИКАТНЫЕ, МАГНИТНЫЕ И ДР.).
- 2. ОРГАНИЧЕСКИЕ (НА ОСНОВЕ ПОЛИСАХАРИДОВ, ПОЛИАКРИЛАТОВ И ДР.).
- 3. ЛИПОСОМЫ И ПОЛИМЕРНЫЕ НАНОЧАСТИЦЫ.
- 4. ПОЛИМЕРНЫЕ МИЦЕЛЛЫ..
- 5. АКТИВНЫЕ НАНОКРИСТАЛЛЫ.



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



«золотой» полимер – потенциальный
носитель лекарственных препаратов



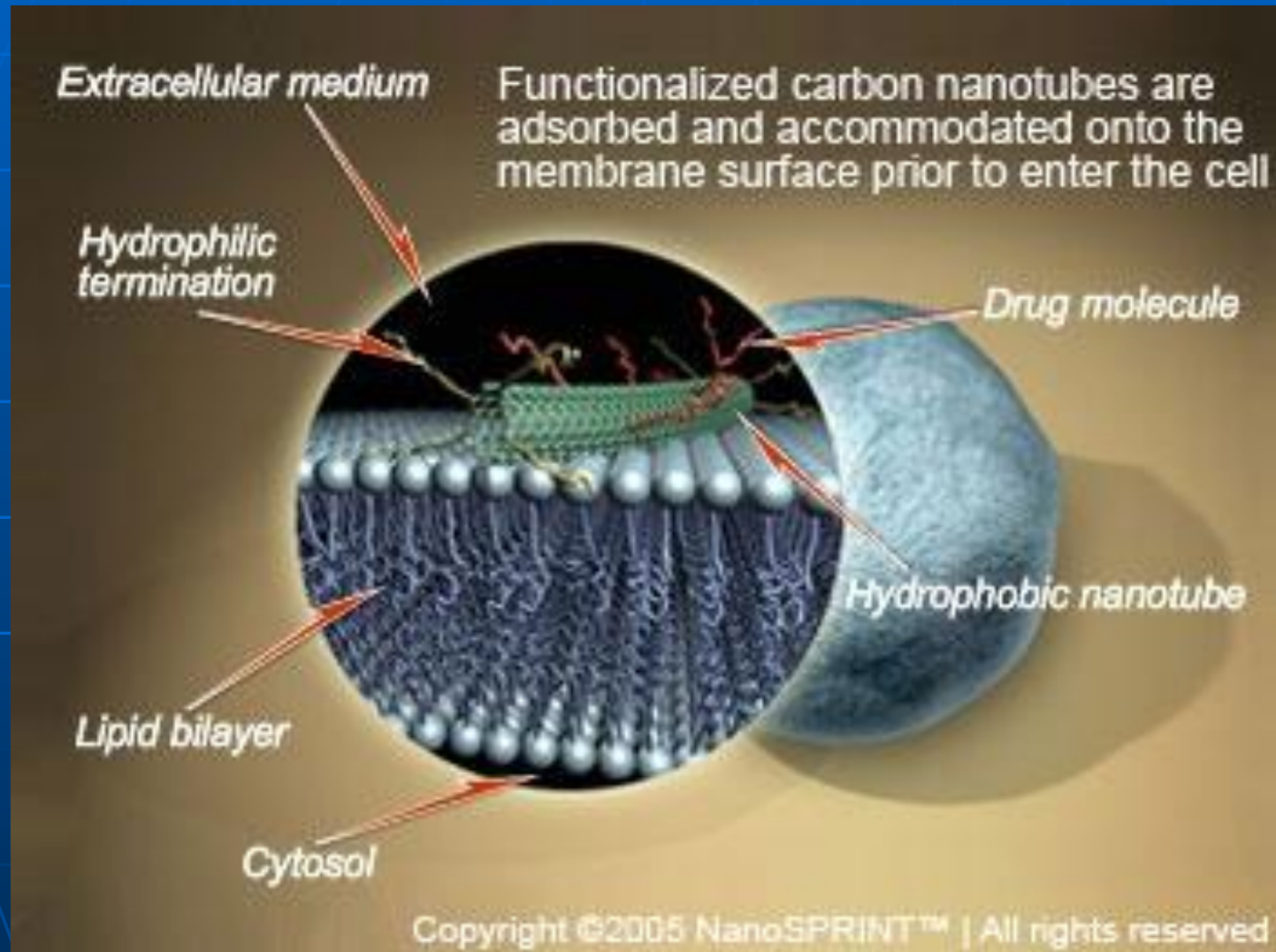
- Многоуровневая система доставки препарата
- На рисунке финальная стадия, **прибытие «нанотранспорта»**

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

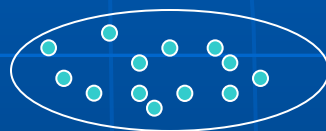
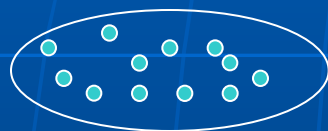
ЗАДАЧИ СОЗДАНИЯ НОВЫХ СИСТЕМ И СРЕДСТВ ДОСТАВКИ ЛЕКАРСТВ

- 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

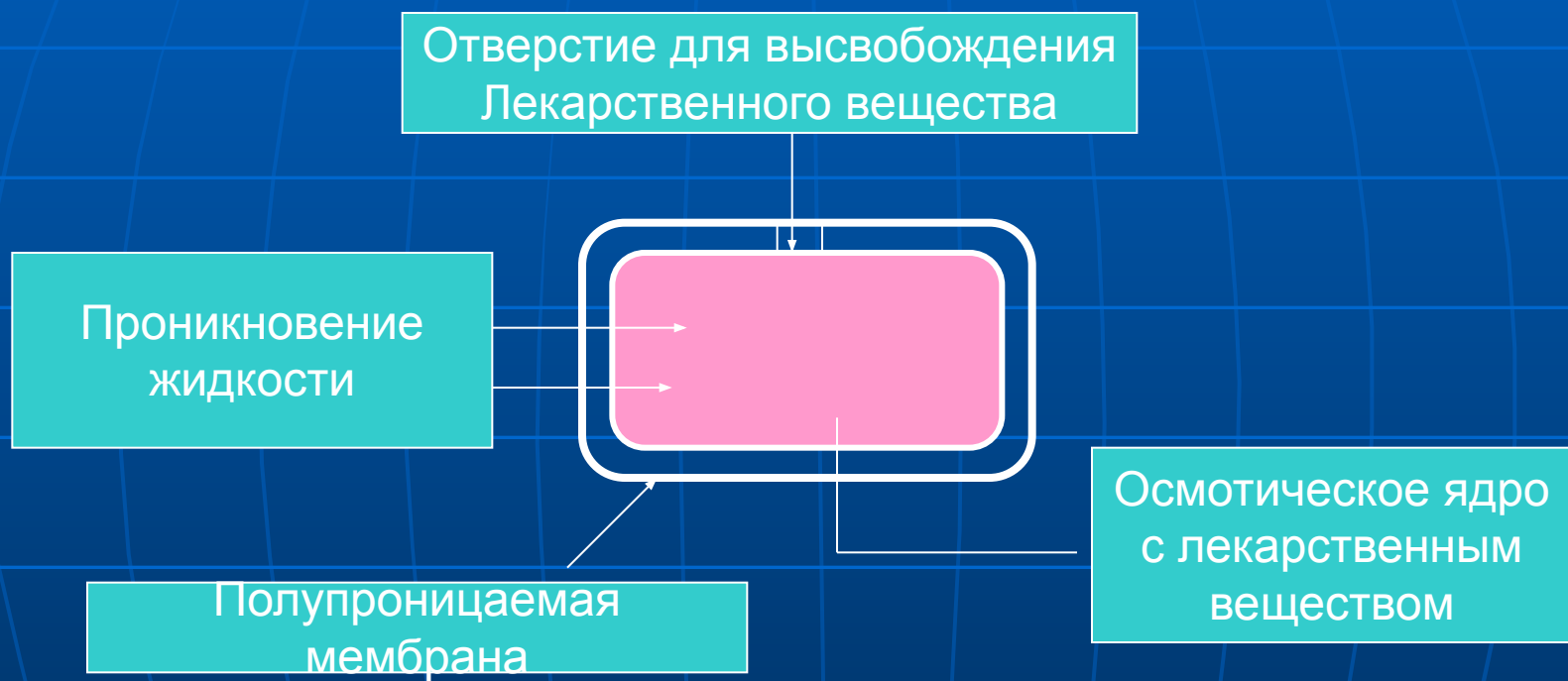
растворимый

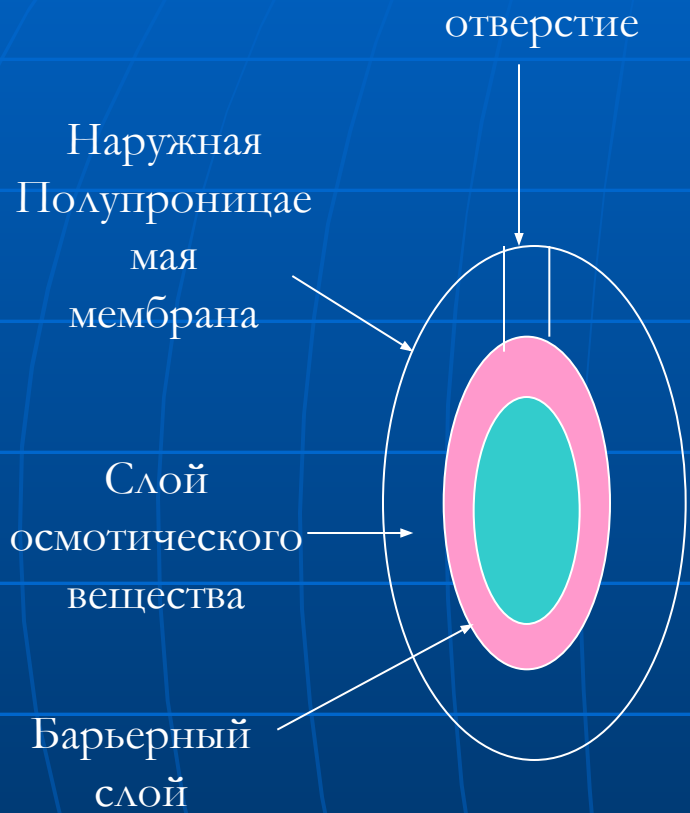
матрикс

ТЕХНОЛОГИИ МОДИФИЦИРОВАННОГО ВЫСВОБОЖДЕНИЯ Л.В.

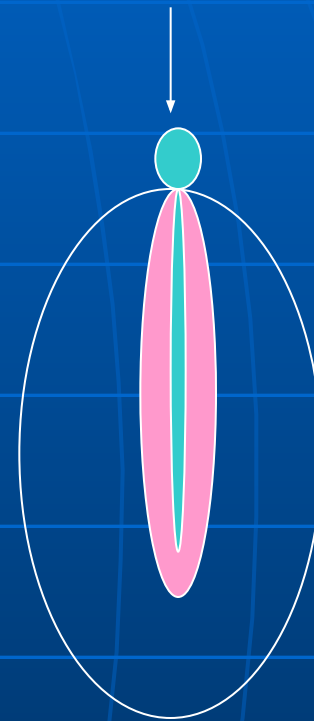
- 1.МАТРИКСНЫЕ ТАБЛЕТКИ,
- 2.ОСМОТИЧЕСКИЕ СИСТЕМЫ,
- 3.РЕЗЕРВУАРНЫЕ СИСТЕМЫ С
ДОЗИРУЮЩИМИ ОБОЛОЧКАМИ,
- 4.МНОЖЕСТВЕННЫЕ
МИКРОГРАНУЛЫ (ПИЛЛЕТЫ),

СХЕМА СТРОЕНИЯ ТАБЛЕТКИ ОСМОТИЧЕСКОГО ДЕЙСТВИЯ





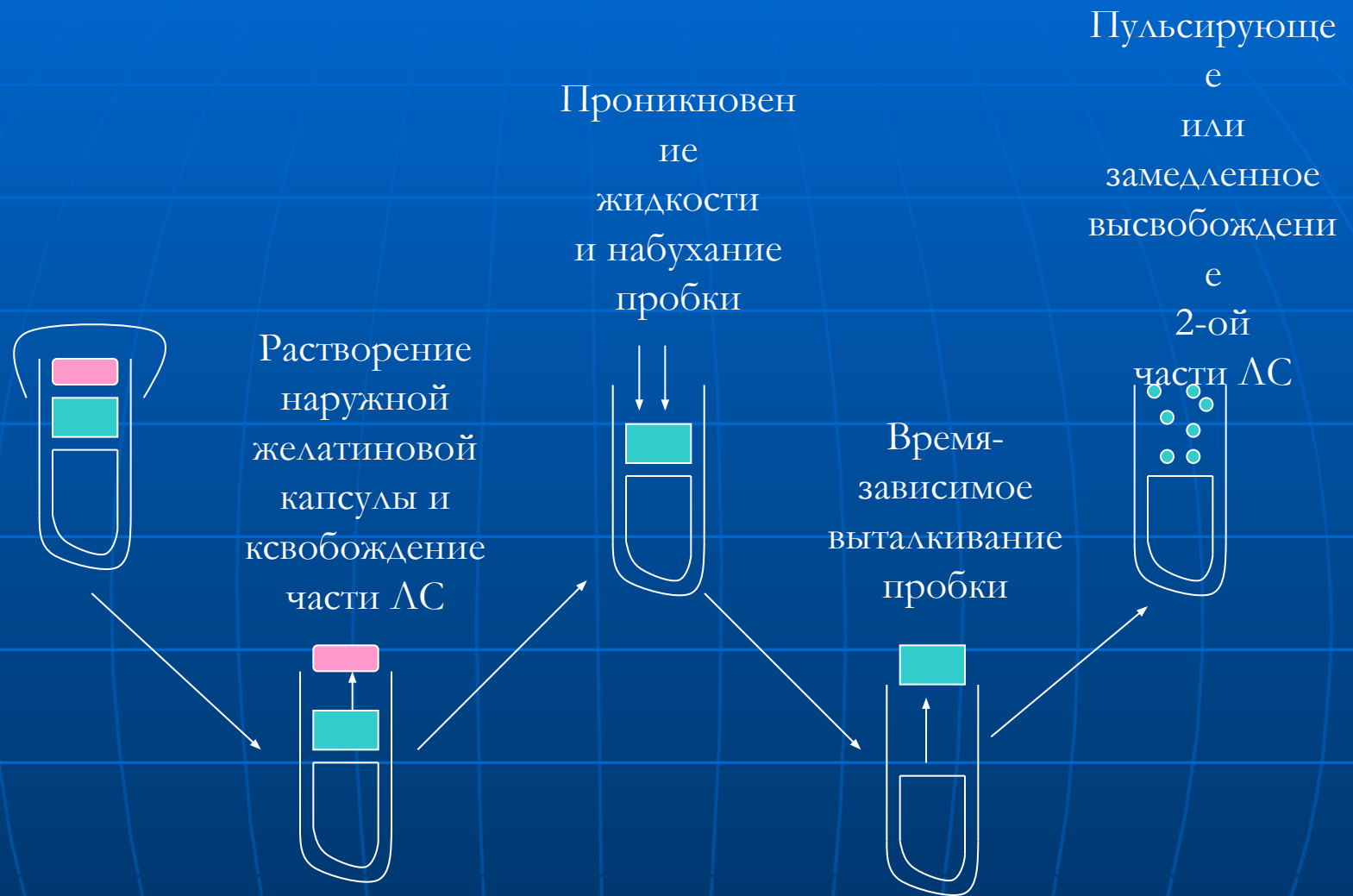
Высвобождение
Лекарственного
вещества



СТРОЕНИЕ ТАБЛЕТКИ С СИСТЕМОЙ МНОЖЕСТВЕННЫХ ПЕЛЛЕТ

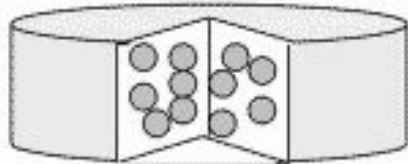


- МЕТОПРОЛОЛ, НИФЕДИПИН, ВЕРАПАМИЛ, ДИЛТИАЗЕМ И ДР.



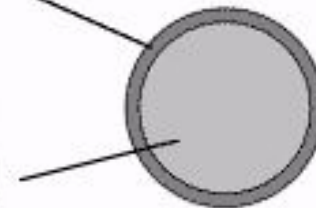
МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ПЕРОРАЛЬНОЙ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ С ПУЛЬСИРУЮЩИМ ВЫСВОБОЖДЕНИЕМ

**Таблетка метопролола
CR/XL**



Полимерная
мембрана

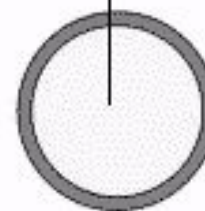
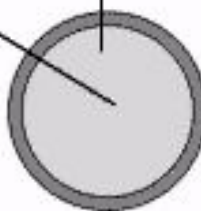
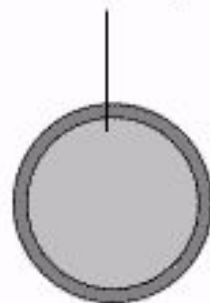
Твердый
метопролол
сукцинат



Твердый
метопролол

Насыщенный
раствор
метопролола

Ненасыщенный
раствор
метопролола

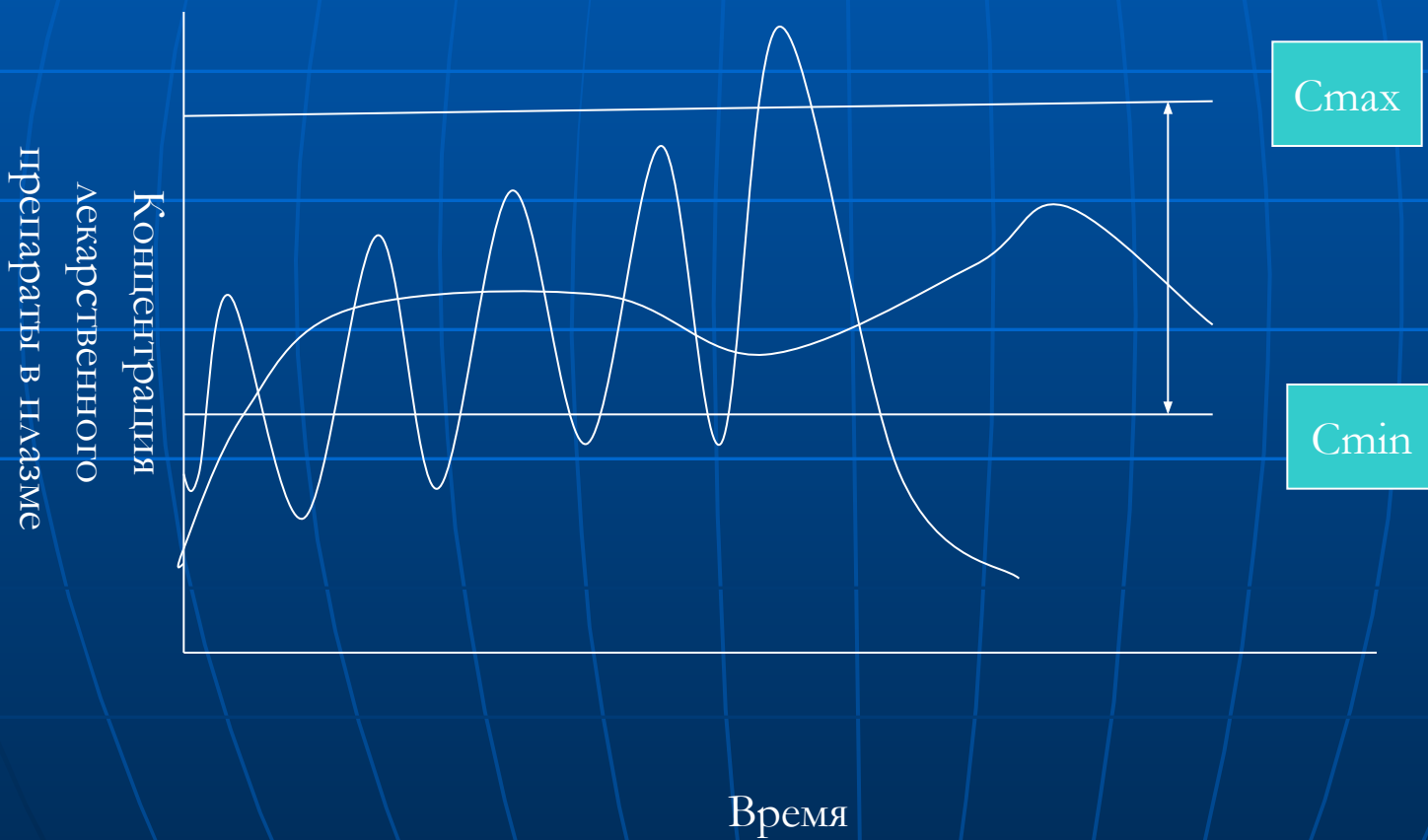


Фаза 1

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

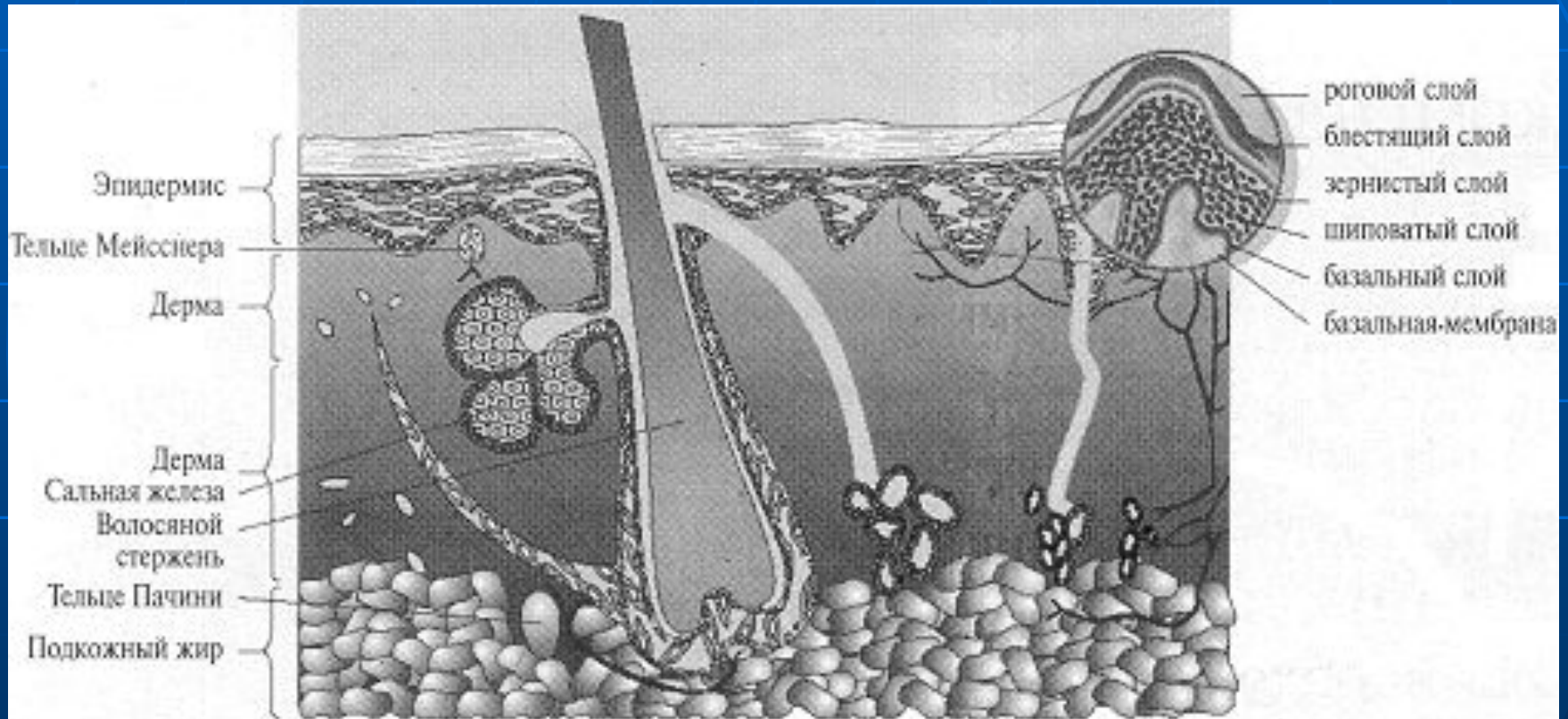
НЕКОТОРЫЕ ПРЕПАРАТЫ ДЛЯ ИНТРАНАЗАЛЬНОГО ПРИМЕНЕНИЯ

- 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

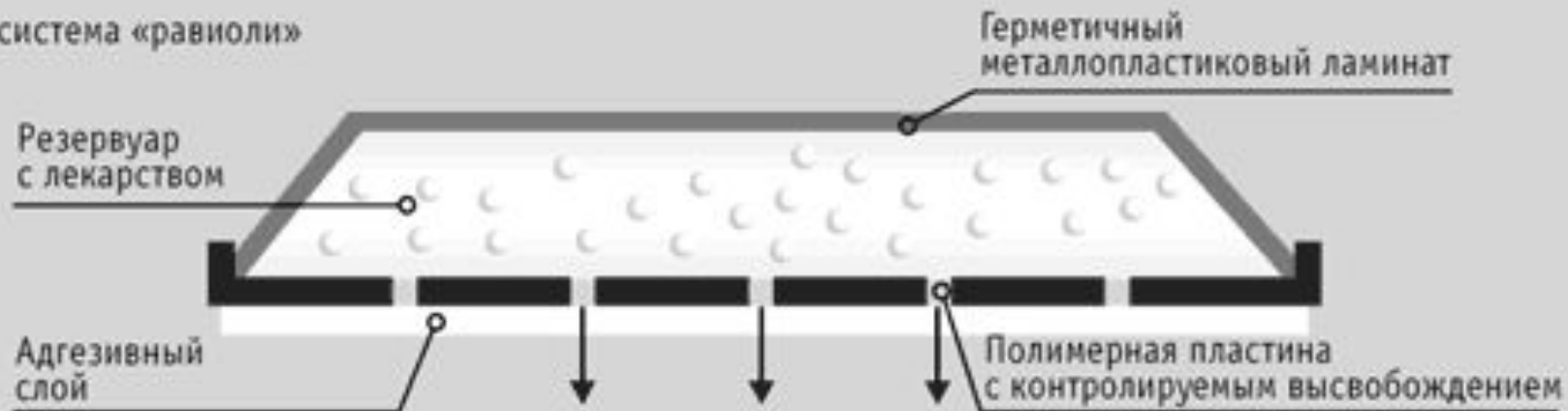


- ТРУДНОПРОХОДИМА ДЛЯ ЛЕКАРСТВ

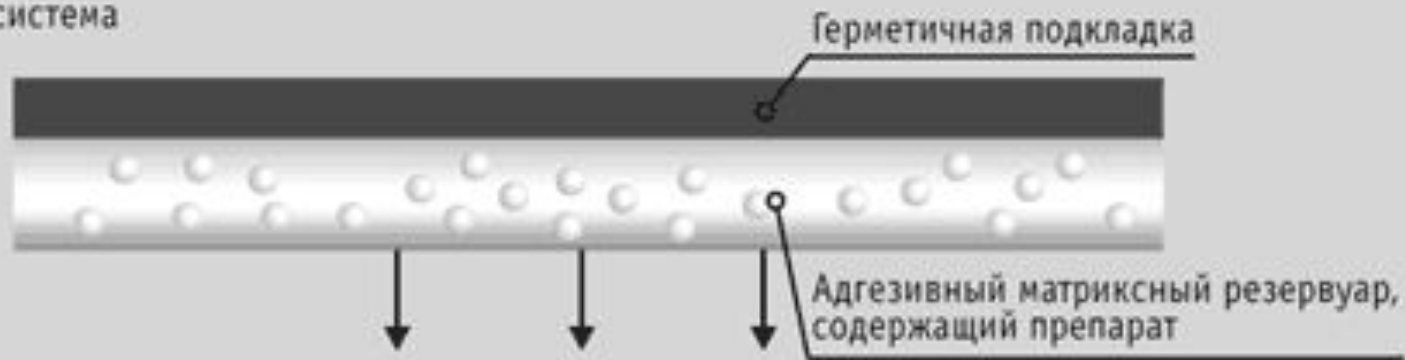
СТРУКТУРА ТТС

- 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

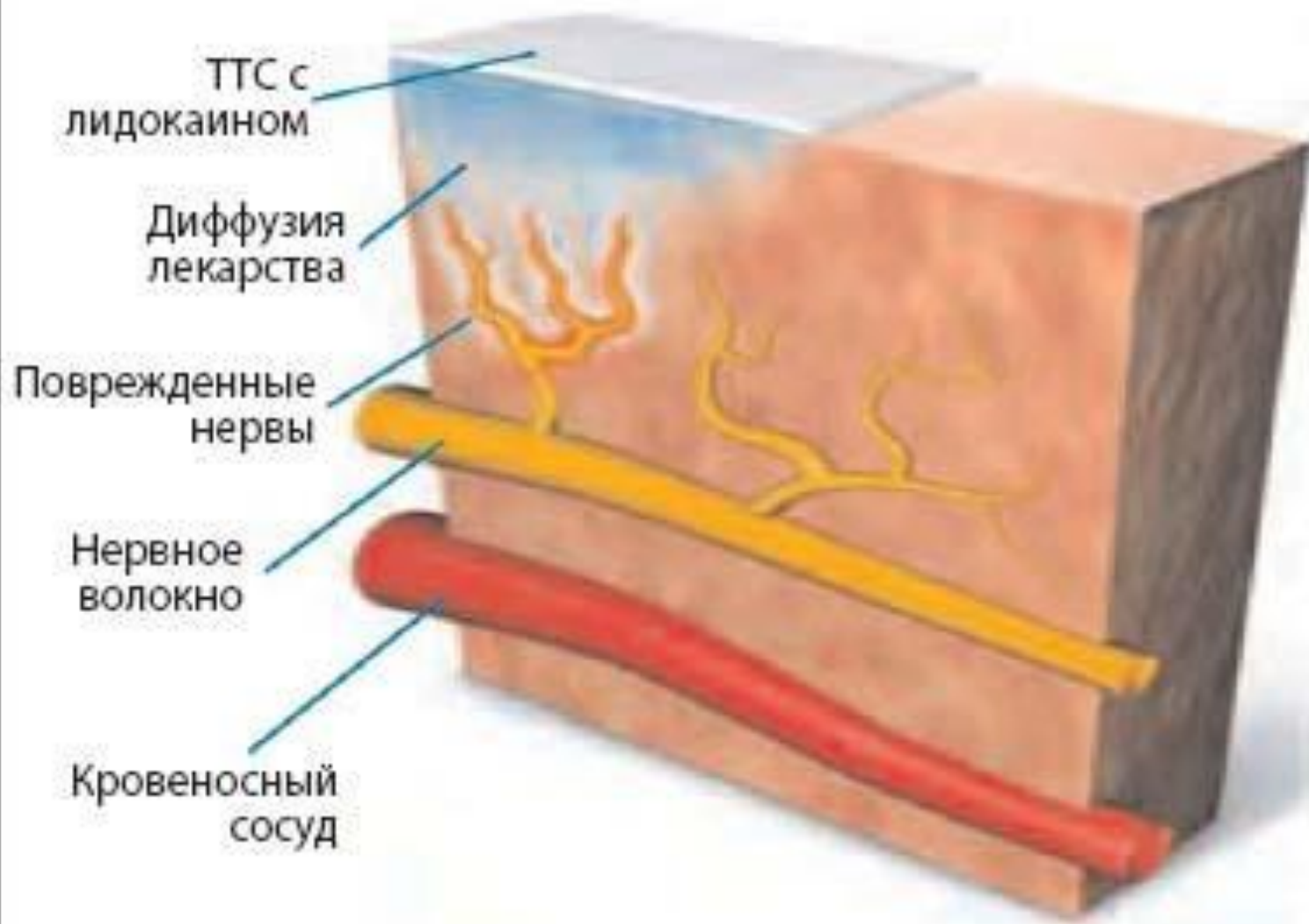
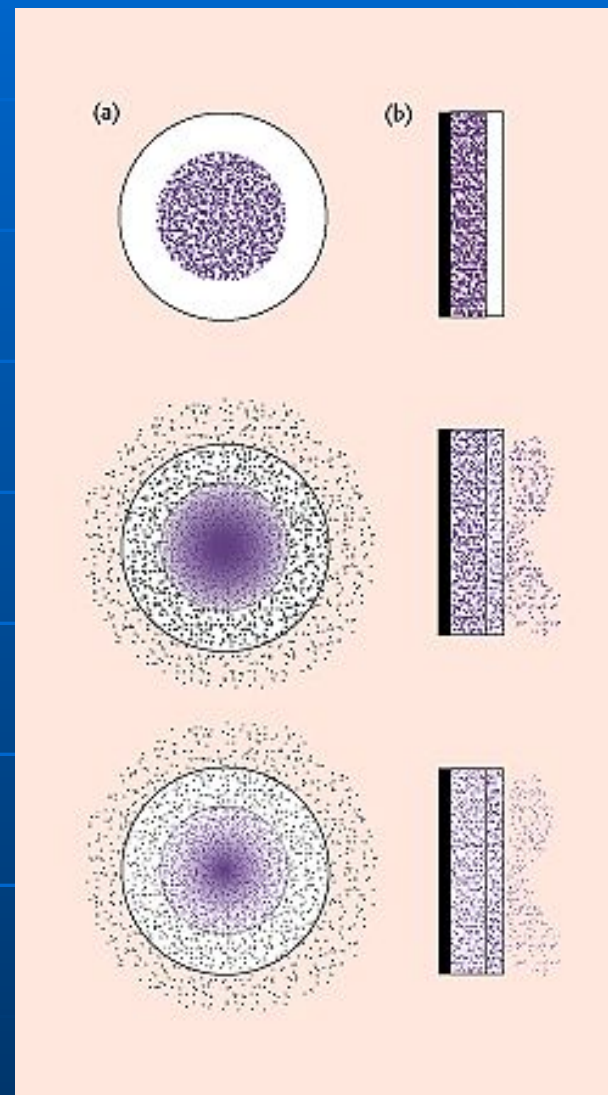
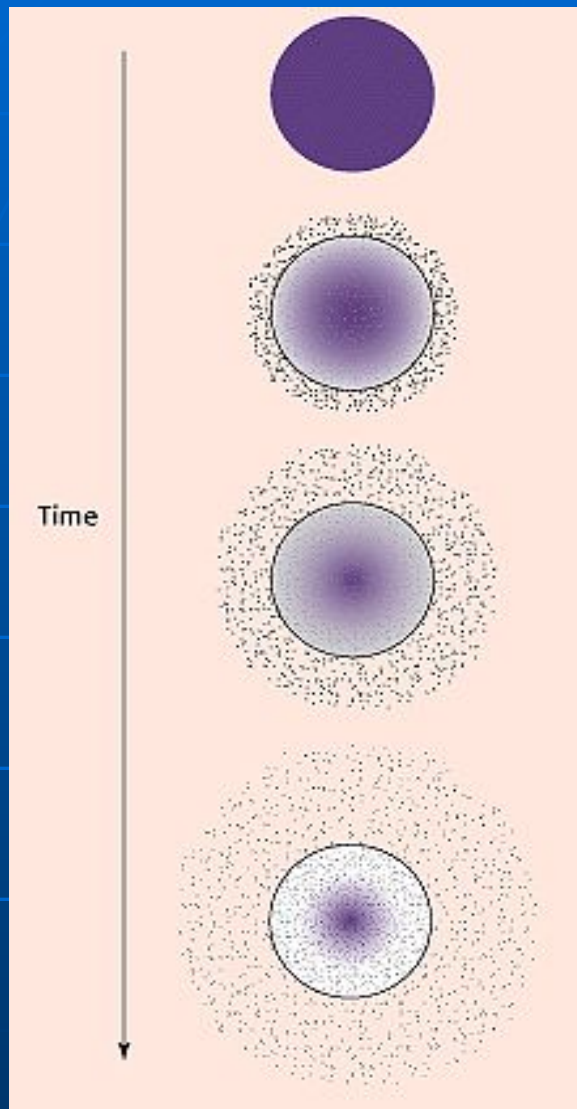


Рис. 1. Действие ТТС с 5% лидокаином при постгерпетической невралгии



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)