

С.Д.АСФЕНДИЯРОВ АТЫНДАҒЫ
ҚАЗАҚ ҰЛТТЫҚ МЕДИЦИНА
УНИВЕРСИТЕТІ



КАЗАХСКИЙ НАЦИОНАЛЬНЫЙ
МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ ИМЕНИ
С.Д.АСФЕНДИЯРОВА

Фармакокинетика туралы түсінік

**Орындаған: Бегалы Б
Байжанова М
Топ: ЖМ13-005**

Алматы 2018

Клиническая фармакокинетика — второй важнейший раздел клинической фармакологии, оперирует данными, полученными только с участием человека. Этот раздел изучает с количественной и качественной стороны совокупность всех процессов прохождения и превращения лекарственного средства в здоровом и больном организме и выявляет закономерности между концентрацией лекарственного средства и наблюдаемыми эффектами.

К основным фармакокинетическим процессам относятся:

- Пути поступления
- Распределение
- биотрансформации
- выведения лекарственных средств из организма больного.

- ▶ **Характеристика путей введения**
- ▶ **ПВ определяет:**
- ▶ **1. скорость нарастания концентрации вещества и эффекта.**
- ▶ **2. длительность действия препаратов.**
- ▶ **3. скорость инактивации препаратов.**
- ▶ **4. возможность создания действующей концентрации вещества в определенных органах и тканях.**
- ▶ **5. возможность появления и выраженность побочных эффектов.**
- ▶ **6. эффективную дозу ЛС.**
- ▶ **7. качественную сторону эффекта.**

- ▶ **Все пути введения ЛС делятся на:**
- ▶ **1. Энтеральные (через ЖКТ).**
- ▶ **2. Парентеральные (минуя ЖКТ).**

▶ Парентеральные пути введения

- ▶ 1. Внутривенный
- ▶ 2. Внутримышечный
- ▶ 3. Подкожный
- ▶ 4. Трансдермальный
- ▶ 5. Внутриартериальный
- ▶ 6. Интратернальный
- ▶ 7. Внутривентрикулярный
- ▶ 8. Под оболочки мозга и др.

Механизмы всасывания

- 1. Пассивная диффузия без энергозатрат
- 2. Фильтрация через водные каналы в пропускающем эпителии
- 3. Активный транспорт против градиента концентрации с участием ферментов-переносчиков и энергозатрат
- 4. Пиноцитоз и фагоцитоз

Факторы влияющие на всасывание

- ❖ Характеристики пациента
- ❖ Форма и характеристики ЛС
- ❖ Присутствие в ЖКТ других веществ
- ❖ Фармакокинетические характеристики ЛС

Факторы и параметры всасывания

- 1 Жирорастворимость
- 2.Нейтральность, ионизация,
- 3.Роль рН лекарств и ее учет
- 4.Биодоступность - % попадания в кр.
- *А. Роль фармацевтических характ.*
- *Б. Роль функции кишечника*
- *В. Роль пресистемного метаболизма
и состояния печени*
- *С. Соотношение доз внутрь в/в в/м*

Распределение – это процесс проникновения ЛС через гистогематические барьеры из системного кровотока в ткани и органы к месту локализации действия.

Распределение ЛС в организме

**Универсальная особенность - неравномерность
распределения**

Отсеки распределения:

1. Внеклеточное пространство
2. Клетки
3. Жировая ткань
4. Костная ткань

Лиганды:

- рецепторы
- белки крови
- белки тканей
- полисахариды межклеточной ткани
- нуклеопротеиды

Два этапа биотрансформации

- Несинтетическое превращение – **метаболическая трансформация** (окисление, восстановление, гидролиз). Метаболиты могут в отдельных случаях обладать более высокой активностью (пролекарства).
- Синтетическое превращение (**конъюгация**) (с остатками глюкуроновой кислоты, глутатиона, глицина, сульфаты; ацетильные и метильные группы).

Выделение ЛВ из организма

Основными органами выделения ЛС являются печень и почки. ЛВ выделяются с молоком, потовой, слезной жидкостью, калом.

С мочой выделяются низкомолекулярные водорастворимые (гидрофильные) вещества, которые циркулируют в крови и не связаны с белками крови. Они легко проходят через почечный фильтр и практически не реабсорбируются в канальцах. Кроме того, ЛВ секретируются в мочу эпителием проксимальных канальцев.

Липофильные вещества проникают в мочу путем диффузии. Они могут реабсорбироваться в почечных канальцах и снова поступать в кровь.

Интенсивность реабсорбции слабых кислот и оснований зависит от рН мочи. При повышении рН мочи уменьшается реабсорбция кислот, при снижении – оснований.

ЛС, поступающие в кишечник с желчью, могут всасываться в кишечнике, проникая в кровь (энтерогапатическая циркуляция).

- ▶ Биотрансформацию и экскрецию объединяет **элиминация**.
- ▶ **Скорость элиминации** – показатель, определяющий, какая часть вещества элиминируется из организма за единицу времени.
- ▶ **Период полуэлиминации** – время, за которое концентрация вещества в плазме крови снижается на 50%.
- ▶ **Клиренс** – фармакокинетический параметр, который характеризует скорость освобождения организма от ЛВ.

