



**Каменск-Уральский филиал  
ГБПОУ «СОМК»**

**ЛЕКЦИЯ №4**  
**Общая фармакология**  
(фармакокинетика)



**Фармакинетика**(от греч -pharmakon-лекарство, kineo-двигать) -раздел фармакологии о путях введения лекарственных средств, их всасывании, распределении в организме, депонировании, метаболизме и выведении веществ.

От того, каким путем вводится лекарственное средство в организм, зависит:

- скорость всасывания и наступление эффекта
- выраженность эффекта
- продолжительность действия эффекта

Все пути введения лекарственных средств делятся на 2 группы: **энтеральные** (греч. **enteron** — кишка) через пищеварительный тракт, **парэнтеральные** (**para** — около) — минуя пищеварительный тракт.

**К энтеральным путям** введения относятся: внутрь, через рот(лат.-per os) — пероральный, под язык(лат. sub lingua) — сублингвальный, через прямую кишку (греч. rectum) — ректальный, буккальный (на область десны)

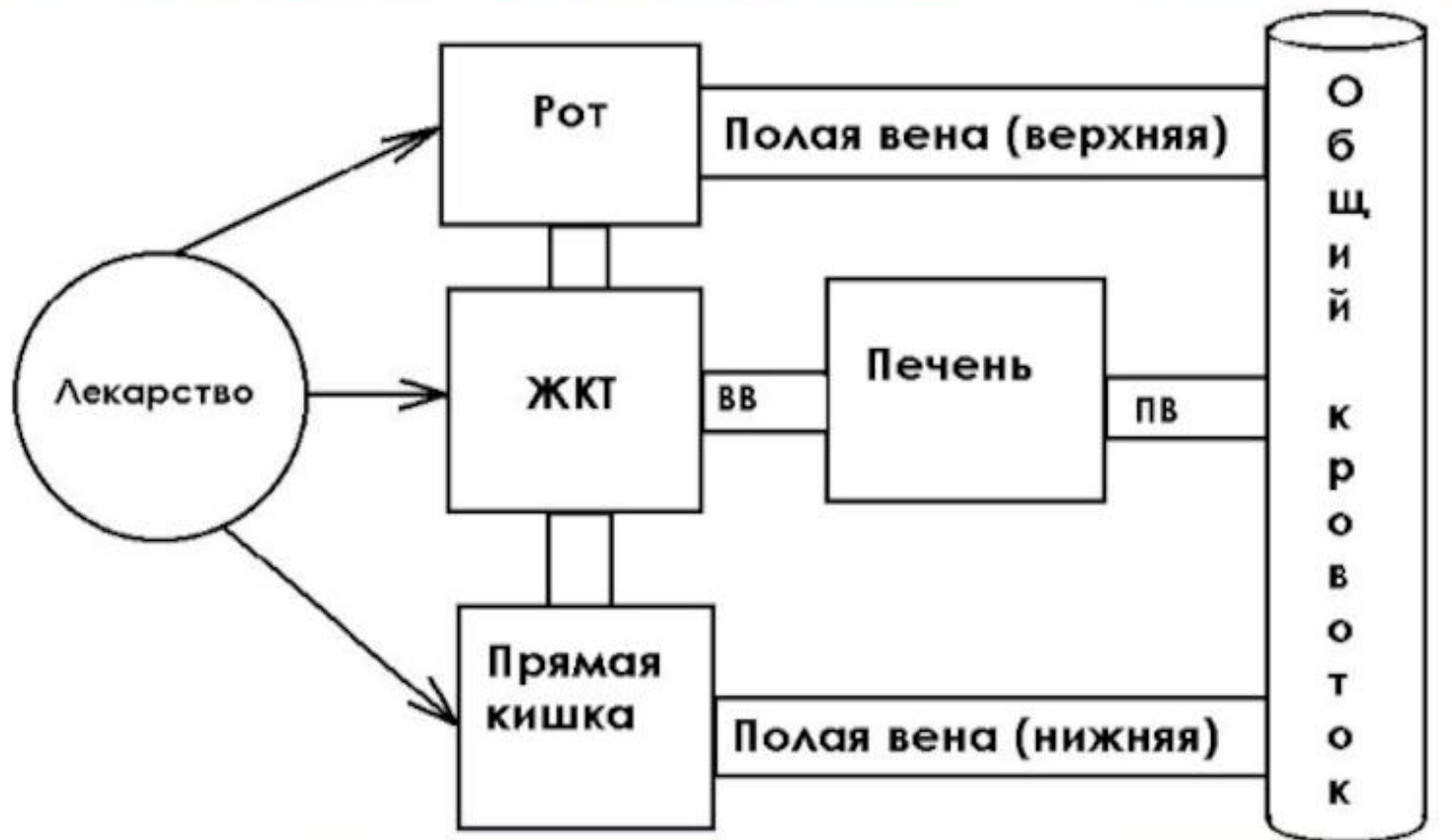
**Пероральный путь** — наиболее распространенный, удобный и простой способ. Таким путем вводят большинство лекарственных средств, но действие ЛВ развивается только через определенное время — 20-30 минут, всасывание происходит в основном в тонком кишечнике. Для оказания экстренной и скорой помощи этот путь введения непригоден.

**Сублингвальный путь** введения используется для высокоактивных веществ, применяемых в малых дозах из-за небольшой всасывающей поверхности подъязычной области. Этот способ используется для оказания экстренной помощи при приступах стенокардии, гипертензии.

**Ректальный путь** введения имеет ряд преимуществ перед пероральным: всасывание происходит быстрее, лекарственное средство минует печень, фармакологический эффект выражен сильнее, чем через рот.

**Буккальный путь** введения заключается в нанесении полимерных пластинок, содержащих действующее вещество на слизистую верхней десны над клыками, вещество постепенно высвобождается и оказывает действие (пластинки с нитроглицерином при стенокардии).

# Энтеральные пути введения

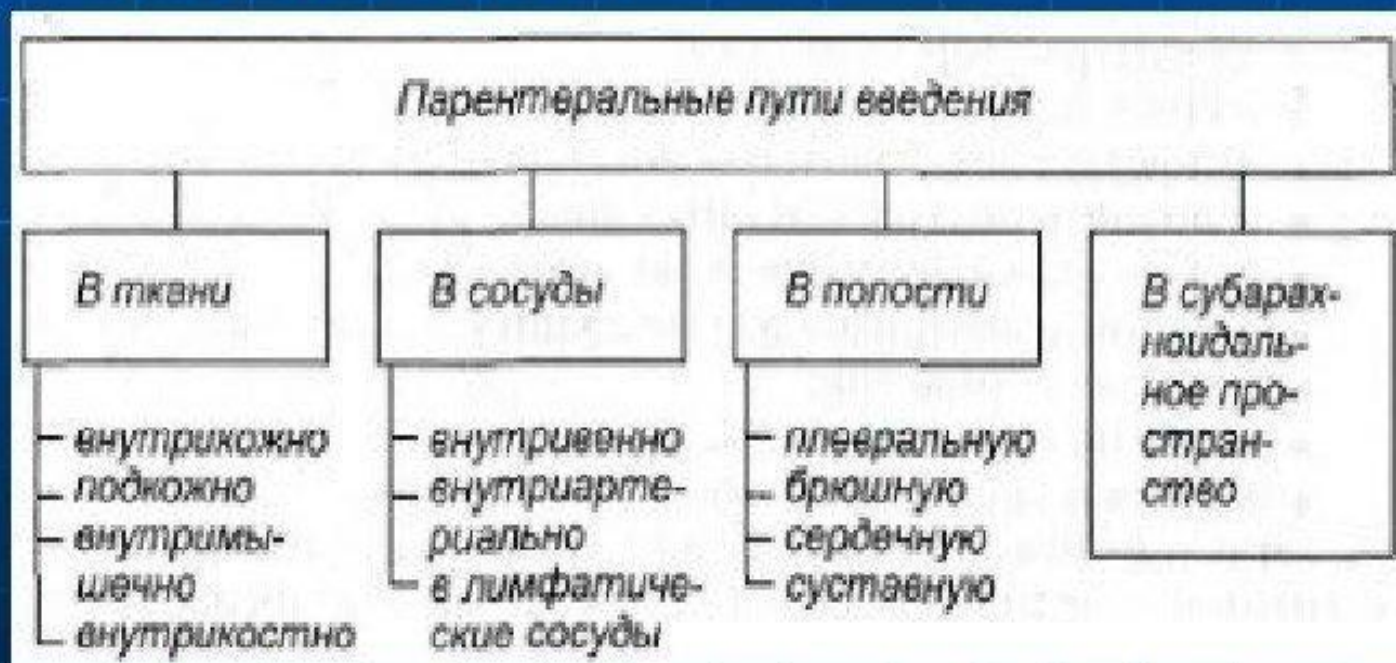


**К парэнтеральным путям** введения относятся: внутривенный, подкожный, внутримышечный, внутриартериальный, субарахноидальный, внутриплевральный, интраназальный, ингаляционный и другие пути введения. Инъекционные пути введения используются для оказания скорой и экстренной помощи, используются для лекарственных средств которые разрушаются под действием пищеварительных соков. Лекарственное средство вводится с помощью шприцев с нарушением целостности тканей, поэтому должно быть стерильно.

- **Подкожное введение:** изотонические или масляные растворы, нельзя вводить раздражающие или гипертонические растворы, нежелательно — суспензии. Эффект развивается через 5-15 минут.
- **Внутримышечное введение:** лекарственное средство вводят в мышцу ягодицы в верхний наружный квадрат, лекарственные вещества всасываются быстрее 5-7 минут, можно вводить водные, масляные растворы и суспензии, не рекомендуется вводить гипертонические и раздражающие растворы.
- **Внутривенное введение:** водные растворы, в том числе раздражающие и гипертонические, лекарственное средство в вену вводят медленно, в течение нескольких минут, при капельном введении — до нескольких часов, предварительно разбавив их изотоническим раствором натрия хлорида или раствором глюкозы, чтобы не создавать в крови сразу большие концентрации вводимого вещества, которые могут быть опасны для сердца и ЦНС. Нельзя вводить внутривенно масляные растворы и суспензии во избежании эмболий.
- **Ингаляционный путь введения:** для введения путем вдыхания газообразных, летучих жидких веществ и мельчайших порошков. Вводят некоторые вещества для наркоза, аэрозоли для экстренной помощи при бронхиальной астме, стенокардии.
- **Субарахноидальный путь введения:** лекарственное средство вводится под оболочку спинного мозга, используется в случае плохой проницаемости веществ через гематоэнцефалический барьер (антибиотики для лечения менингита).
- **Внутриартериальный путь введения:** лекарственное средство вводят в артерию снабжающую кровью данный орган .

# Парентеральный путь введения

- введение лекарственных веществ в обход пищеварительного тракта (инъекционно)

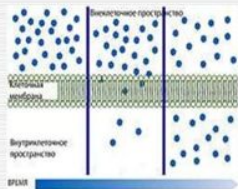


**Всасывание лекарственного вещества** - (лат. adsorbeo-всасываю) — **абсорбция** — преодоление барьеров, разделяющих место введения ЛС и кровяное русло. Полнота всасывания зависит: от лекарственной формы, степени измельченности, рН среды, активности ферментов, растворимости и т. д.

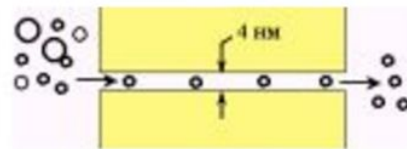
Для каждого ЛВ определяется специальный показатель — **биодоступность** (характеризует скорость и степень всасывания лекарственного средства с места введения и накопления в крови в терапевтической концентрации, выражается в %). Проникновение лекарственного вещества в клетки и ткани организма сопряжено с переносом его в жидких средах и поступлением из крови через различные клеточные барьеры.

## Пассивная диффузия

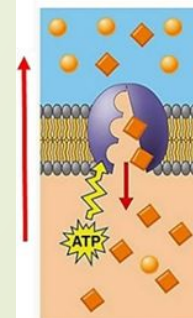
перемещение молекул вещества из пространства с высокой концентрацией в область, где концентрация веществ низкая или отсутствует.



2. **Фильтрация** - проникновение лекарственных веществ через водные поры и через МЕЖКЛЕТОЧНЫЕ ПРОМЕЖУТКИ (2 нм) в стенке кровеносных сосудов и в мембранах клеток.



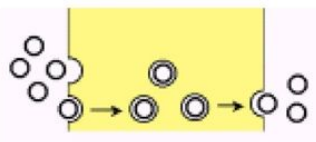
## Активный транспорт



**Активный транспорт** – это перенос веществ через мембрану, который:

- ❖ совершается против градиента концентрации (т.е. с компартмента с большой концентрации в компартмент с меньшей концентрацией)
- ❖ при участии специальных белков - **транспортеров**
- ❖ требует затрат энергии АТФ, образующейся в процессе дыхания
- ❖ имеет более низкую скорость и насыщаемость.

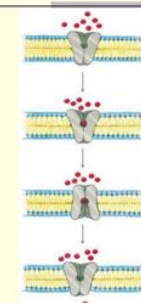
4. **Пиноцитоз** (от греч. *pinō* – пью). Частицы веществ, содержащие крупные молекулы или агрегаты молекул, соприкасаются с наружной поверхностью мембраны, затем окружаются ею с образованием пузырька, погружающегося внутрь клетки. Путем пиноцитоза осуществляется транспорт в клетку макромолекул.



## Облегченная диффузия

транспорт веществ с помощью специальных транспортных белков, каждый из которых отвечает за транспорт определенных молекул или групп родственных молекул.

- Они взаимодействуют с молекулой переносимого вещества и каким-либо способом перемещают ее сквозь мембрану.
- Таким образом в клетку транспортируются сахара, аминокислоты, нуклеотиды и многие другие полярные молекулы.



## Распределение лекарственных веществ в организме, депонирование

Равномерность или неравномерность распределения определяется чувствительностью органов и тканей к веществам, а также их способностью проникать через биологические барьеры.

**Гематоэнцефалический барьер** — препятствует проникновению лекарственных веществ из крови в ЦНС.

**Гематоофтальмологический барьер** — препятствует проникновению веществ из крови в ткани глаза.

**Плацентарный барьер** - препятствует проникновению лекарственных веществ из организма матери в организм плода.

Особыми барьерами являются **кожа и клеточные мембраны**.

Стенка кровеносного сосуда имеет характер пористой мембраны, где гидрофильные соединения проникают через поры мембраны путем фильтрации, липофильные — непосредственно путем простой диффузии.



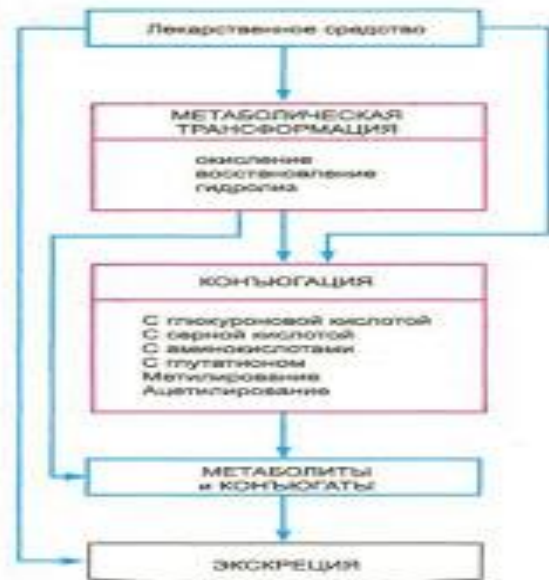
**Метаболизм лекарственных веществ** - ЛВ подвергаются в организме различным химическим превращениям (**биотрансформации**).

Выделяют 2 вида биотрансформации:

**-метаболическая трансформация-** превращение веществ за счет окисления, восстановления и гидролиза;

**-конъюгация-** биосинтетический процесс, сопровождающийся присоединением к лекарственному веществу или его метаболитам ряда химических группировок; Эти процессы ведут за собой инактивацию или разрушение ЛВ (дезоксикацию), образование менее активных соединений. Главная роль в биотрансформации принадлежит — печени, поэтому функция печени барьерная и обезвреживающая.

## БИОТРАНСФОРМАЦИЯ (МЕТАБОЛИЗМ) ЛЕКАРСТВЕННОГО ВЕЩЕСТВА В ОРГАНИЗМЕ



Реакции I типа (несинтетические):

- окисление
  - восстановление
  - гидролиз
- } микросомы печени

Реакции II типа (синтетические, конъюгации)

- глюкуронизация – микросомы печени
- аминоконъюгация
- ацетилирование
- сульфоконъюгация
- метилирование



## Выделение лекарственных веществ из организма (экскреция)

ЛВ через определенное время выводятся из организма в неизменном виде или в виде метаболитов.

Гидрофильные(растворимые в воде) вещества выделяются *почками*.

Липофильные (растворимые в жирах) лекарственные вещества и их метаболиты выводятся через печень в составе желчи, поступая в *кишечник*.

Лекарственные вещества могут выводиться через *потовые и сальные* и железы(йод, бром),

Летучие лекарственные вещества выделяются через *легкие*.

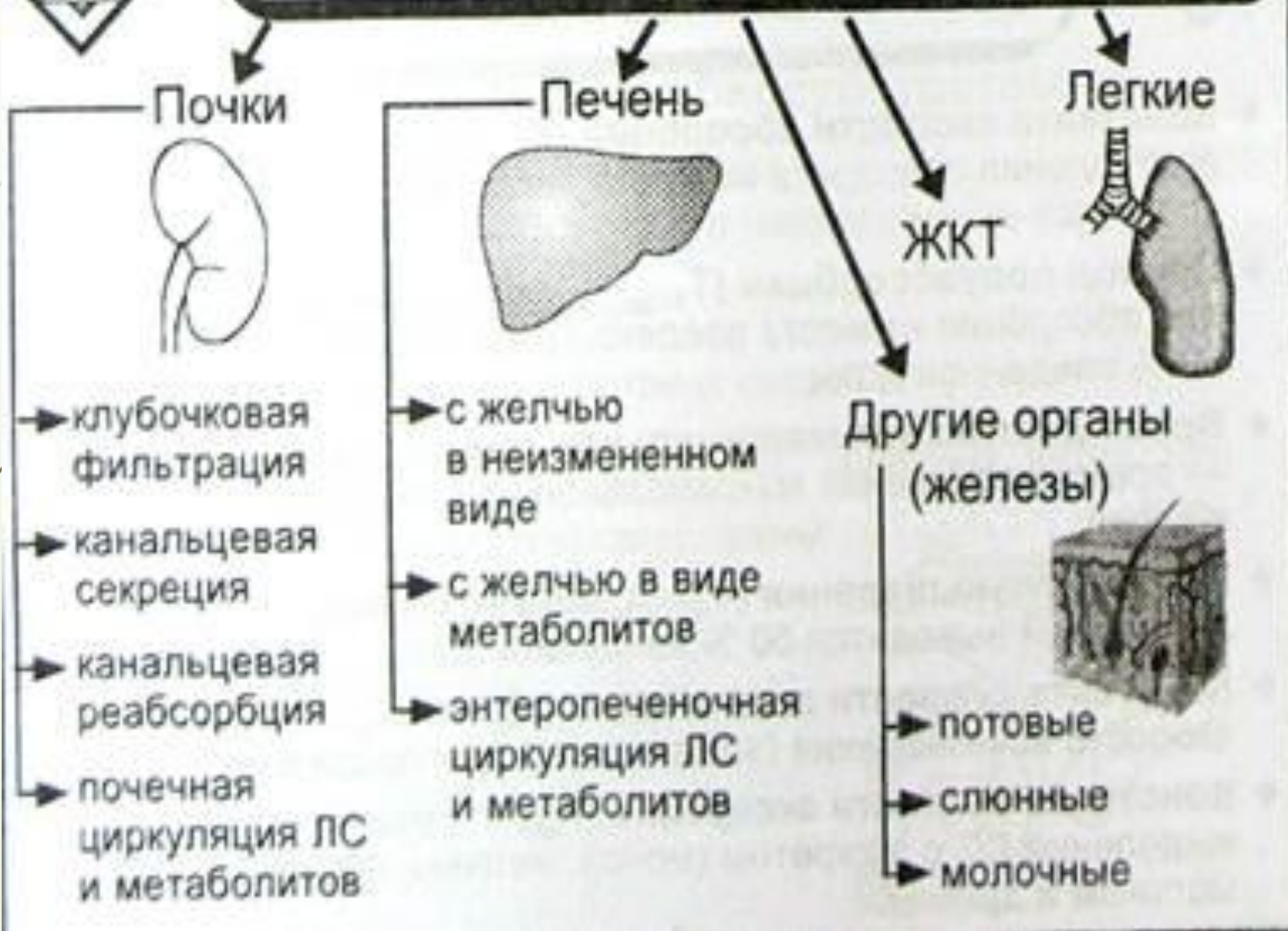
*Молочные железы* выделяют с молоком различные соединения (снотворные, антибиотики)

Процесс освобождения организма от лекарственного вещества в результате инактивации и выведения обозначается термином — *элиминация*.

- ***Константа скорости экскреции*** — скорость выведения лекарственного средства с мочой и другими путями.
- ***Общий клиренс*** — объем плазмы крови, очищаемый от лекарственного средства за единицу времени за счет выведения почками, печенью или другими путями.
- ***Период полувыведения*** — время в течение которого концентрация лекарственного средства в плазме уменьшается наполовину от ее начальной величины.



# ПУТИ ВЫВЕДЕНИЯ ЛЕКАРСТВ



# Пути выведения

| Путь выведения | Механизм выведения                                    | Лекарственные средства   |
|----------------|---|--|
| С мочой        | Клубочковая фильтрация, активная канальцевая секреция | Большинство лекарственных средств в не связанном с белками форме   |
| С желчью       | Активный транспорт, пассивная диффузия, пиноцитоз     | Дигитоксин, пенициллины, тетрациклины, стрептомицин, хинин, стрихнин, четвертичные аммониевые соединения |
| Через кишечник | Пассивная диффузия, желчная секреция без реабсорбции  | Доксициклин, ионизированные органические кислоты   |
| Со слюной      | Пассивная диффузия, активный транспорт                | Пенициллины, сульфаниламиды, салицилаты, бенз-одиазепины, тиамин, этанол                                 |
| Через легкие   | Пассивная диффузия                                    | Средства для ингаляционного наркоза, иодиды, камфора, этанол, эфирные масла                              |
| С потом        | Пассивная диффузия                                    | Некоторые сульфаниламиды, тиамин   |
| С молоком      | Пассивная диффузия, активный транспорт                | Антикоагулянты, антибиотики, тиреостатики, литий, карбамазепин   |

## Виды фармакотерапии

- **Этиотропная терапия** (др.-греч. αἰτία — причина и τρόπος — направление) — идеальный вид фармакотерапии, направлен на устранение причины болезни (лечение противомикробными средствами инфекционных больных), применение антидотов при лечении больных с отравлениями токсическими веществами);
- **Патогенетическая терапия** — направлена на устранение или подавление механизмов развития болезни (антигипертензивные средства, сердечные гликозиды, антиаритмические, противовоспалительные, психотропные и многие другие лекарственные препараты оказывают терапевтическое действие путём подавления соответствующих механизмов развития заболевания);
- **Симптоматическая терапия** — направлена на устранение или ограничение отдельных проявлений болезни (обезболивающие препараты, противокашлевые средства);
- **Заместительная терапия** — используется при дефиците естественных биогенных веществ ( ферментные препараты, гормональные лекарственные средства, препараты витаминов (витамин Д, например, при рахите, препараты заместительной терапии, не устраняя причины заболевания, могут обеспечивать нормальное существование организма в течение многих лет);
- **Профилактическая терапия** — проводится с целью предупреждения заболеваний (противовирусные средства , дезинфицирующие препараты, противотуберкулезных препаратов, примером проведения профилактической терапии является использование вакцин);

**Спасибо за внимание!**

