

# Введение в фармакологию

Лекция №1

# Фармакология (pharmakon+logos)

Наука о взаимодействии химических соединений с живыми организмами

Изучает лекарственные средства, применяемые для лечения и профилактики заболеваний

Разрабатывает новые пути поиска эффективных лекарств

# Основные направления развития

Фармакология как клиническая медицинская наука, изучает действие на организм лекарственных веществ

- фармакокинетика
- Фармакодинамика
- Хронофармакология
- фармакогенетика

Фармация как наука изучает пути разработок новых лекарственных средств

- фармакогнозия
- Фарма.химия
- Фарм.технология
- Фарм.экономика

# Задачи фармакологии

**Повышение  
эффективности  
фармакотерапевтическо  
го действия  
лекарственных средств.**

- **Снижение  
побочных  
эффектов лек.  
средств.**

**Расширение арсенала  
лекарственных средств, в  
том числе более  
избирательного действия.**

# Пути решения задач фармакологии

Лекарственные средства разрабатываются с использованием новых технологий и новых видов сырья

Совершенствование путей введения лекарственных средств в организм

Модифицирование лекарственных форм

Совершенствование методик и схем использования лекарственных средств

# Связь с другими дисциплинами



# Основные разделы фармакологии

**Рецептура**- раздел  
лекарствоведения, о путях  
введения лекарственных  
средств в организм, различных  
лекарственных формах и  
правилах выписывания  
рецептов

**Общая фармакология**-  
изучает общие  
закономерности действия  
лекарственных веществ при  
введении их в организм

**Частная фармакология**- изучает  
особенности действия конкретных  
лекарственных веществ при  
введении их в организм с учетом  
особенностей патологии, схемы  
приема

# Направления в изучении лекарственных веществ

## **Фармакокинетика-**

установление особенностей всасывания лекарств, биотрансформации, распределения и выведения их из организма

## **Фармакотерапия-**

оценивает эффективность лекарственного лечения с помощью контролируемых терапевтических показателей

## **Фармакодинамика-**

устанавливает особенности проявления главного и побочного фармакотерапевтического действия лекарственных веществ при их отдельном или комбинированном и повторном введении

# История развития фармакологии

Эмпирический  
период

До начала XIX в.

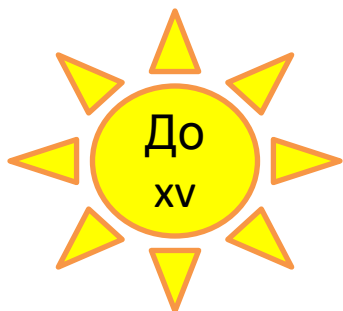
В основу разработок  
положен эмпирический  
опыт без глубоких  
научных теоретических  
изысканий  
( недостаточное  
развитие науки)

Научный  
период

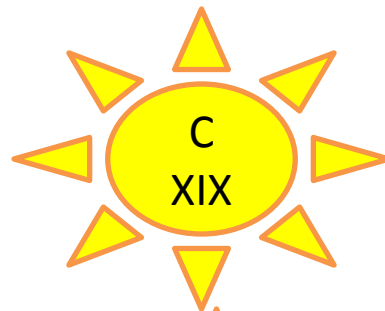
С XIX в. по настоящее  
время

В основе поиска и  
разработки лекарств  
лежат теоретические  
разработки на основе  
достижений наук

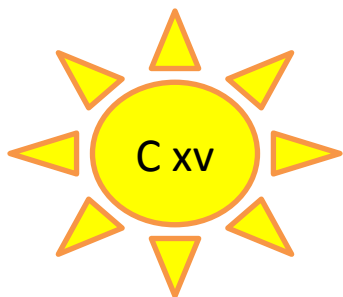
# Для получения лекарственных средств использовались



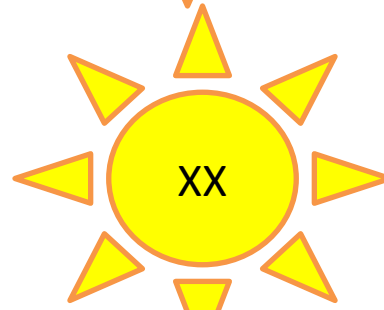
Органические  
продукты  
растительного и  
животного  
происхождения



Синтетические и  
полусинтетические  
продукты



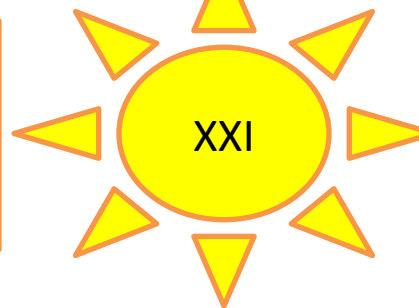
Неорганические  
продукты (ртути,  
серы, меди,  
серебра)



Продукты генной  
инженерии (ГМС)



Продукты  
микроорганизмов



Изыскание  
разработок  
персонализированных  
лекарств

# Основные этапы развития

## фармакологии

- Лекарствоведение возникло в древности: в папирусах Древнего Египта описывается опий, белена, мята, клещевина
- Швейцарский врач Парацельс использовал пары ртути для лечения сифилиса, основатель ятрохимии “Все есть яд, ничто не лишено ядовитости, и все есть лекарство-одна только доза делает вещество ядом или лекарством”

- эмперически созданные элексиры, экстракты (Гален)
- Фармакология как наука сформировалась в XIX в , когда появились экспериментальные методы исследования : появление новых средств (эфир для наркоза (Мортон), фенол (Листер)
- XX век- эпоха целенаправленного научного синтеза, развитие биотехнологий:
- пенициллин (Флеминг), сульфаниламиды (Домагк)
- Вклад: Пирогов, И.П. Павлов, С.П. Боткин, Н.П.Кравков, Д.А. Харкевич, В.Г. Кукес
- Виноградов

# Особенности современного этапа развития фармакологии

- Развитие новых направлений в науке о лекарствах
- ( фармакология гериатрическая, педиатрическая, фармакогенетика, хронофармакология)
- Синтез препаратов избирательного действия
- Создание пролонгированных лекарств с запрограммированным высвобождением
- Модификация лекарственных форм
- Увеличение количества зарегистрированных и разрешенных к применению лекарств
- Появление большого количества синонимов

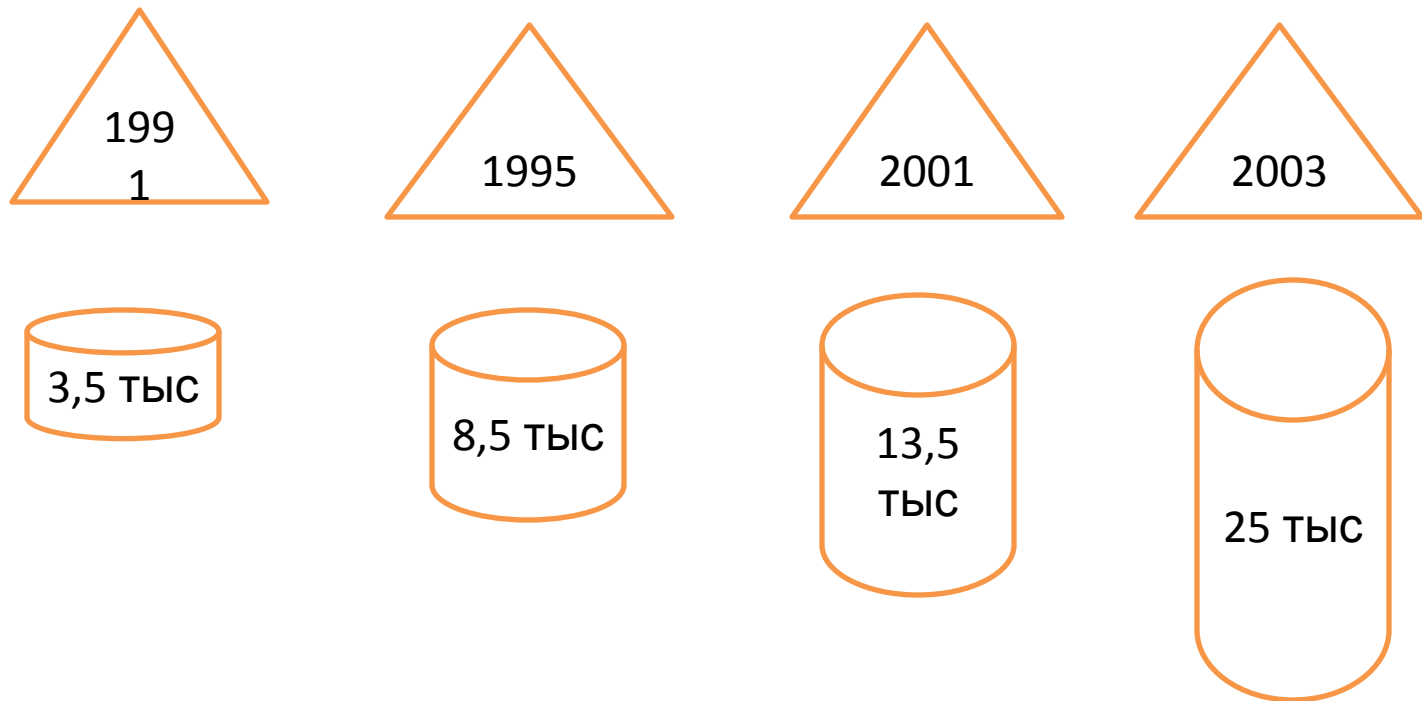
- Появление большого количества БАД ов – биологически активных добавок, которые не проходят клинические испытания. Они не входят в Реестр лекарственных средств РФ
- Реализация контрафактных препаратов. По определению ВОЗ, фальсифицированными лекарствами являются продукты, преднамеренно и противоправно снабженный этикеткой, неверно указывающей по истинность происхождения и даты или изготовления. Контрафакт составлял:
 

|      |      |
|------|------|
| 5%   | 20%  |
| 1995 | 2004 |

ФЗ № 61 от 12.04.10

« Об обращении лекарственных средств»

# Динамика роста применяемых в клинической практике лекарств



Ежегодно в России один и тот же препарат регистрируется под

10-15 торговыми названиями, что затрудняет правильный обоснованный выбор препарата, создает путаницу, увеличивает число лекарственных осложнений

# Динамика темпов разработки новых лекарственных препаратов

XVII-XVIII

XIX

XX

В настоящее  
время

Более 50 в год

# Нобелевские премии присужденные за разработку лекарственных средств

1908

Эрлих  
применение  
сальварсана в  
лечении  
сифилиса

1938

Домарк  
открытие  
красного  
стрептоцида

1945

Флеминг  
открытие  
пенициллина

1952

Ваксман  
открытие  
стрептомицина

1953

Кребс открытие цикла  
лимонной кислоты  
Липман открытие  
кофермента А и его  
значение

1982

Бергстрем-  
открытие  
простагландинов и  
близких  
биоактивных  
веществ

1988

Блек- открытие  
важных  
принципов  
лекарственной  
терапии

# Классификации лекарственных препаратов

- **Классификация по алфавиту.**

В основу этой классификации положен принцип размещения наименований лекарственных средств в алфавитном порядке (на русском и латинском языках).

- **Химическая классификация.**

В основе ее лежит химическая структура лекарственных веществ. Например, производные имидазола: бендазол, клотримазол, метронидазол; производные фенотиазина: хлорпромазин, этапипразин; производные метилксантина: кофеин, теофиллин, теобромин. Близкие по химической структуре лекарственные вещества могут оказывать на организм разные эффекты.

- **Фармакологическая классификация.**

Она является комбинированной. Согласно этой классификации лекарственные средства делятся на разряды — большие блоки, соответствующие системе организма, на которую действует лекарственное средство, например лекарственные средства, действующие на сердечнососудистую систему, центральную нервную систему и т.д. Разряды подразделяются на классы. Класс определяет характер фармакологического действия лекарственного средства.

Например, разряд «Лекарственные средства, действующие на сердечнососудистую систему» подразделяется на классы: «Антиаритмические средства», «Кардиотонические средства», «Антигипертензивные (гипотензивные) средства» и др. Классы делятся на группы.

Например, класс «Антиаритмические средства» делится на 4 группы: блокаторы натриевых каналов, препараты, замедляющие реполяризацию, бетаадреноблокаторы, блокаторы кальциевых каналов.

Группы делятся на подгруппы. Например, группа бетаадреноблокаторов делится на неселективные и селективные. Таким образом, фармакологическая

- **Фармакотерапевтическая классификация.**

В ее основу положены заболевания, при которых применяются конкретные лекарственные средства. Например, «Средства для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки», «Средства для лечения бронхиальной астмы». В фармакотерапевтические группы лекарственных средств могут входить препараты, относящиеся к разным разрядам, классам и группам. Фармакотерапевтической классификацией широко пользуются врачи.

- **Классификация CAS (Chemical Abstracts Service).**

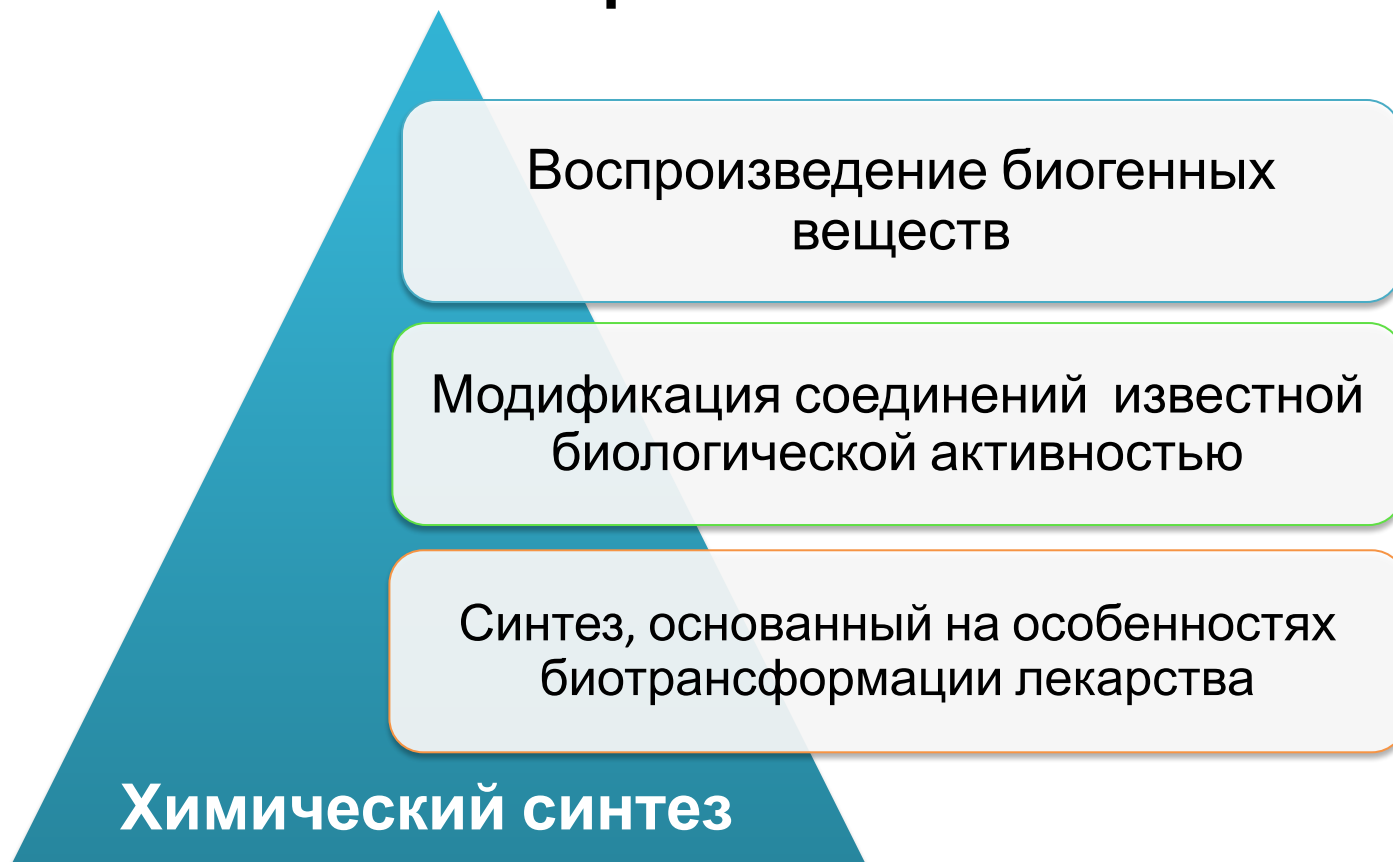
Представляет собой однозначный идентификатор химических субстанций, где определенной химической структуре присвоен регистрационный номер. Например, номер CAS азитромицина 83905015. Регистрационный номер лекарственных веществ включен в фармацевтические и медицинские справочники всего мира.

# Изыскание новых лекарственных средств

Источники лекарств:

- Растения
- Животные
- Микроорганизмы и грибы
- Минералы
- Нефть и газ
- Продукты моря

# Основные направления поиска новых лекарственных средств и их совершенствование



# Основные направления поиска новых лекарственных средств.

Получение и  
извлечение  
препаратов из  
сырья

животного  
растительного  
минерального  
продукты  
жизнедеятельност  
и грибов и  
микроорганизмов

Клеточная и генная  
инженерия

Экспрессия  
генов,  
ответственных за  
жизненно важные  
процессы в  
организме, в  
бактериальные  
клетки

# Направления поиска новых лекарств

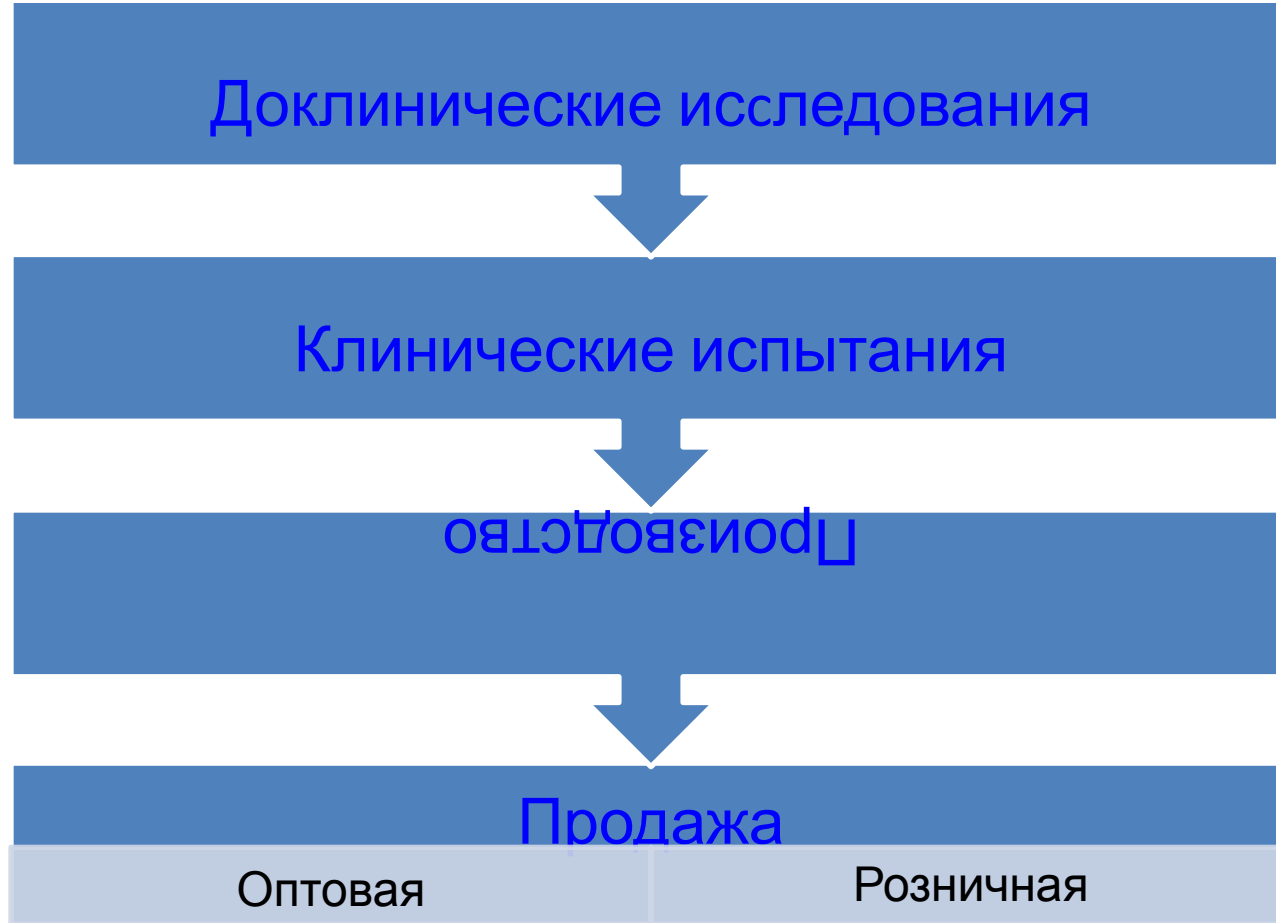
- Получение препаратов из лекарственного сырья (растения и животные) Новогаленовые препараты
- Выделение лекарственных веществ, являющихся продуктами жизнедеятельности грибов и микроорганизмов.
- Биотехнология(клеточная и генная инженерия)  
Рекомбинантные препараты: интерфероны, инсулины
- Химический синтез аналогов,
- получение новой химической структуры,
- изменение технологических процессов (очистка, растворимость)(ампициллин-амоксациллин)
- Исследование свойств препаратов (декарис, дибазол, аспирин)

# Процесс создания препарата

**Создание нового препарата** – это сложный, длительный и дорогостоящий процесс. Иногда может пройти более 10 лет прежде, чем лекарство проделает путь от лаборатории до аптечной полки.

Согласно данным, лишь **одно из 1000 тестируемых соединений** доходит до стадии клинических испытаний и лишь **одно из пяти прошедших испытания** получает официальное одобрение и поступает в продажу.

# Этап жизненного цикла лекарственного средства



# Этапы создания новых препаратов

## 1. Открытие препарата

## 2. Доклинические исследования

а) лабораторные опыты (in vitro)

б) опыты на животных

## 3. Клинические исследования (in vivo)

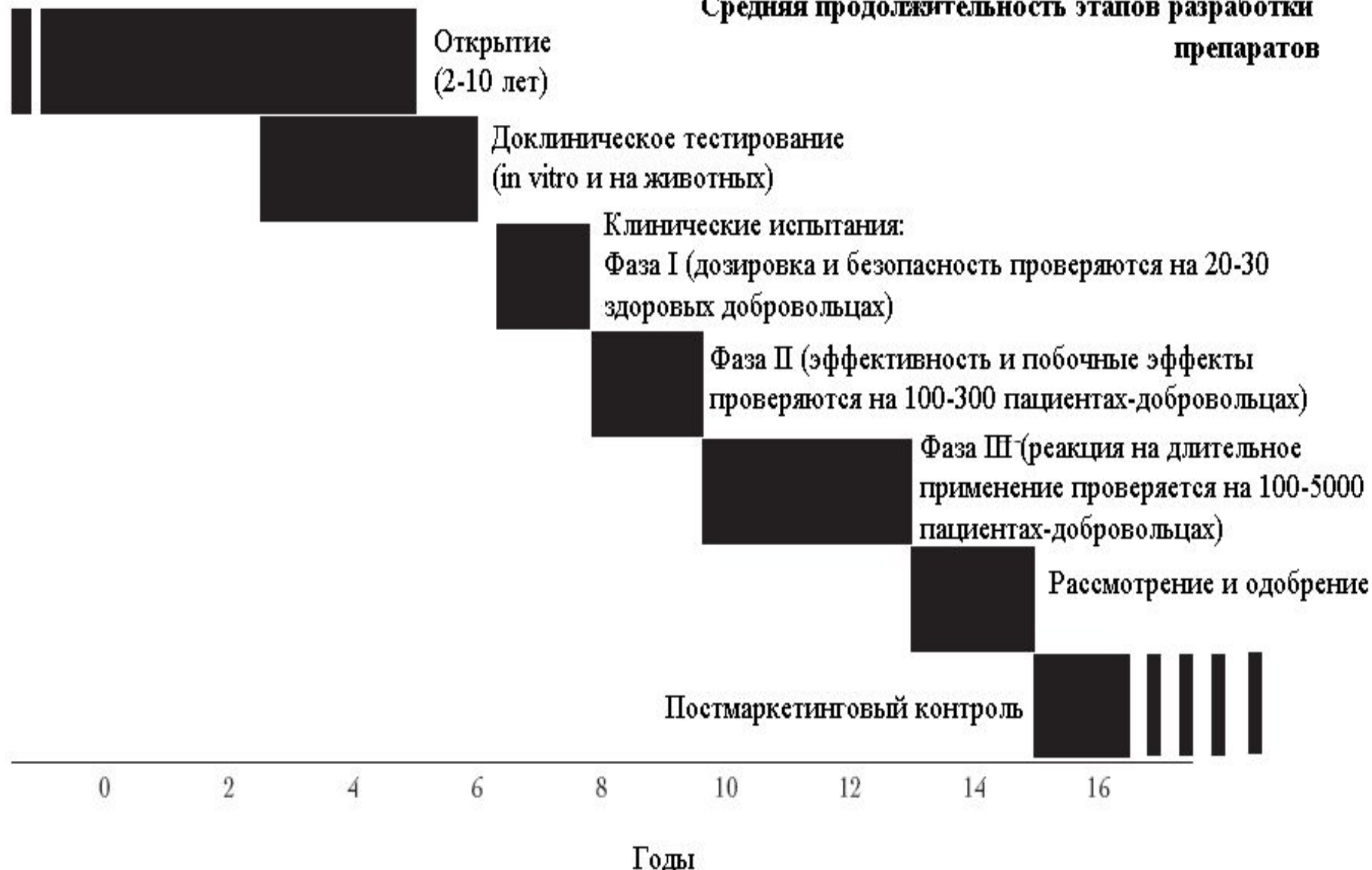
**1 этап** (первое применение препарата у человека, оценка токсичности и безопасности, определение параметров фармакокинетики)

**2 этап** (установление эффективности, определение оптимальных режимов дозирования, оценка безопасности)

**3 этап** (подтверждение данных об эффективности и безопасности, сравнительные исследования со стандартными препаратами)

**4 этап** (дальнейшее изучение эффективности для оптимизации применения препарата, долгосрочные исследования безопасности, оценки редких нежелательных лекарственных реакций)

## Средняя продолжительность этапов разработки препаратов



# Открытие препарата

**Большинство новых препаратов** начинают свой путь в государственных и университетских лабораториях или в лабораториях фармацевтических компаний.

Благодаря тому, что все чаще **экспериментальные соединения (агенты) моделируются на компьютере**, они лучше отвечают специфическим структурным и функциональным требованиям.

**Соединения, представляющиеся перспективными,** в дальнейшем проходят всестороннее тестирование.

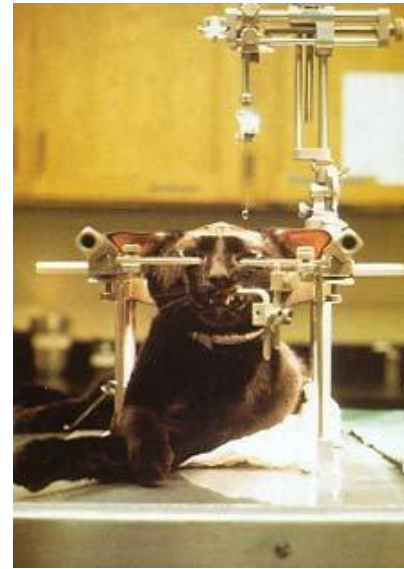
# Этапы исследований

- 1 этап доклинический
- В химической лаборатории создается химическое соединение с определенными фармакологическими свойствами
- Биологической лаборатории испытывают на животных. Скрининг-отсев
- Результаты исследования направляются в Фармакологический комитет

**Лабораторное**  
**тестирование** не  
может неопровержимо  
доказать, что  
соединение  
безопасно, но может  
дать важную  
**информацию о его**  
**воздействии на**  
**клетки.**

Большинство таких испытаний по сути являются **токсикологическими исследованиями** или исследованиями по принципу ADME – **всасывание, распределение, метаболизм, выделение.**

При их проведении изучают всасывание препарата, механизмы расщепления в организме, токсичность и активность продуктов распада (метаболитов), а также скорость выведения самого препарата и его метаболитов из организма.



# Доклинические испытания



Выбор доз на оценке концентраций лек. средств и метаболитов в организме



Эксперименты на трансгенных животных и *in vitro*



Оценка эффективности и безопасности с использованием биомаркеров заболеваний



Компьютерная имитация экспериментов на животных и клинических испытаний



На основании доклинических испытаний эффективности и безопасности изучают действие препарата в различных дозах у здоровых добровольцев



Эффективность и безопасность в сравнительном плане (плацебо) у ограниченного контингента пациентов с заболеванием (для лечения которого предназначен препарат, определяют диапазон терапевтических доз



Сравнительное исследование в установленных дозах и лекарственных формах у большого количества больных, разного возраста, сопутствующими заболеваниями.



Принимают решение о регистрации



Решение дополнительных вопросов по  
применению препарата, расширение  
показаний, накопление опыта  
использования



Пострегистрационный надзор: сбор и  
анализ побочных эффектов

- **2 этап клинический**
- Проводится в клинике на добровольцах. Используется «слепой контроль» «Плацебо» (имитатор лекарства) для объективной оценки действия препарата.
- При проведении испытания соблюдаются этические аспекты.
- Результаты клинических испытаний направляются в Фармакологический комитет, который совместно с Фармакопейным комитетом разрешает производство и использование препарата в определенной форме и дозировке, разрабатывают инструкцию по применению и хранению, присваивают наименование.

# Общая рецептура

Лекция №2

# План

- Основные понятия рецептуры:  
лекарственное вещество, средство,  
форма
- Рецепт. Правила выписывания и отпуска  
лекарственных средств
- Краткая характеристика лекарственных  
форм

# Аптека

- Учреждение здравоохранения, осуществляет приготовление и отпуск, хранение, расфасовку лекарств и товаров медицинского назначения и выполняет санитарно-просветительную работу.

# Фармакопея (pharmakon+ poieo)

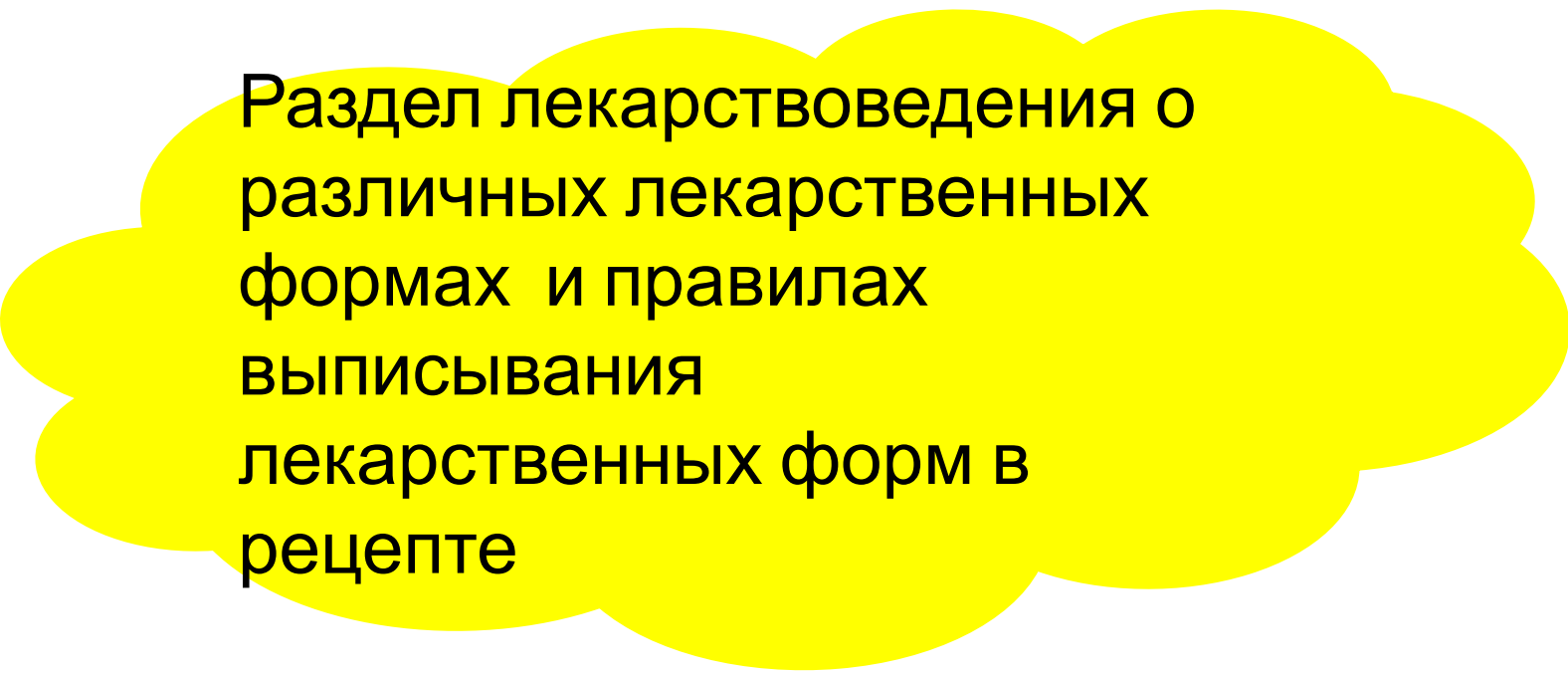
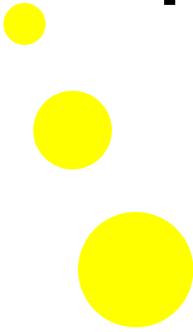
- Свод стандартов и норм, определяющих
- качество лекарственных средств
- Издаётся под руководством фармакопейного
- комитета
- Имеет силу закона. Требования обязательны
- для всех предприятий , изготавливающих или применяющих лекарственные средства
- В фармакопее приведены характеристики свойств лекарственных веществ, способы определения качества, методы количественного определения лекарственных веществ, таблицы высших доз для всех возрастных категорий больных и животных, способы изготовления лекарственных форм, условия хранения и отпуска, справочные таблицы

# Хранение лекарственных средств

- Хранение лекарств по физико-химическим свойствам ( влияние температуры, влаги, света приказ № 377)
- В зависимости от применения (наружные, внутренние, для инъекций)
- По токсикологическим свойствам ( список А и список Б, наркотические средства список ПККН)
- Соблюдение сроков хранения

- **Список А-** (venena) отнесены ядовитые лекарственные средства, применение и хранение которых в связи с высокой токсичностью должно производиться с особой осторожностью. Хранят в сейфе
- **Список Б-** (heroica) отнесены сильнодействующие лекарственные средства применение и хранение производиться с предосторожностью в связи с возможными осложнениями при их применении без медицинского контроля. Хранение в запирающих шкафах.

# Рецептура



Раздел фармакологии о  
различных лекарственных  
формах и правилах  
выписывания  
лекарственных форм в  
рецепте

# Основные понятия рецептуры

## Лекарственное сырьё

- часть растений или органы животных, продукты минерального и бактериального происхождения, химические соединения используемые для приготовления лекарственных средств

## Лекарственное вещество

- - индивидуальное соединение, которое самостоятельно или в композиции с другими соединениями составляет базисную часть лекарства

## Лекарственное средство

- одно или несколько лекарственных веществ применяемых для лечения и профилактики заболеваний

## Лекарственная форма

- удобное для применения форма лекарственного средства для получения необходимого лечебного эффекта

## Лекарственный препарат

- лекарственное средство в определенной лекарственной форме

# Расположите правильно соответствие



# Лекарственное средство может

- **1) Химическое название** отражающее: **иметь три основных названия:**  
состав и структуру лекарственного вещества. Химические названия редко употребляются в практическом здравоохранении, но часто приводятся в аннотациях на лекарственные препараты и содержатся в специальных справочных изданиях, например: 1,3 диметилксантин,  
5этил5фенилбарбитуровая кислота и т.

# Международное непатентованное название

- (МНН, International Nonproprietary Name, INN). Это название лекарственного вещества, рекомендованное Всемирной Организацией Здравоохранения (ВОЗ), принятое для использования во всем мире в учебной и научной литературе с целью удобства идентификации препарата по принадлежности к определенной фармакологической группе и для того, чтобы избежать предвзятости и ошибок. Синонимом МНН является термин генеринеское, или дженерическое название. Иногда МНН отражает химическое строение лекарственного вещества, например: ацетилсалициловая кислота, ацетаминофен.

# Патентованное коммерческое название

- (Brand name). Оно присваивается фармацевтическими фирмами, производящими данный конкретный оригинальный лекарственный препарат и является их коммерческой собственностью (торговой маркой), охраняемой патентом. Например, торговое название ацетилсалициловой кислоты — аспирин, фуросемида — лазикс, диклофенака вольтарен. Торговые названия используются фирмами производителями для маркетинговых целей, для продвижения и конкуренции лекарственных препаратов на рынке.

# Препараты дженерики и СИНОНИМЫ

- Когда у фирмы разработчика заканчивается срок действия патента, то другие компании могут производить данное лекарственное средство и продавать его под международным названием. Такие препараты называют воспроизведенными лекарственными средствами, или **дженерическими препаратами**. Препараты дженерики обычно дешевле оригинальных, так как затраты на их разработку и клинические испытания не включены в цену.
- Одно и то же лекарственное вещество может содержаться в одинаковых дозах в препаратах одной лекарственной формы, имеющих разные торговые названия (**препараты синонимы**). Поэтому провизор может предложить пациенту заменить один препарат (при отсутствии его в аптеке) другим **препаратом синонимом**.

# прописи

## официнальные



Утвержденные прописи готовых лекарственных средств (изготовленных на фарм. Предприятиях или заготовка в аптеке)

## магистральные



Составляются по усмотрению врача (состав, дозировка), изготавливают в аптеке после получения рецепта (экстемпорально)

# Виды рецептурных прописей

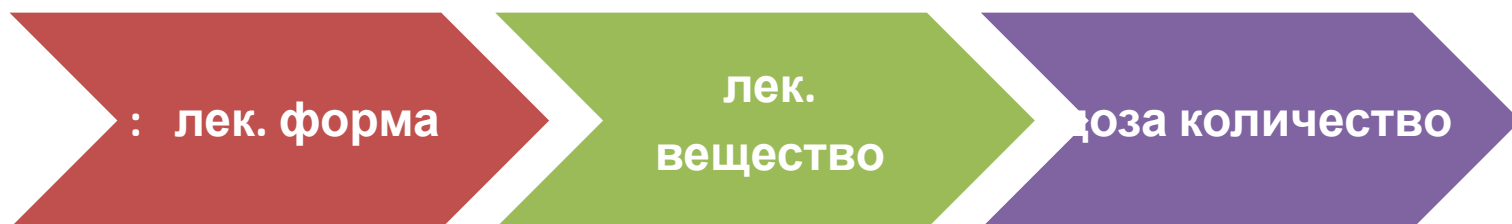
сокращенная

Используется при  
выписывании готовых  
лекарственных средств  
промышленного  
изготовления и не  
предполагает перечень  
входящих ингредиентов

развернутая

Перечисляются все  
входящие ингредиенты и  
лекарственные  
вещества в  
определенном порядке с  
указанием  
лекарственной формы

# Шаблоны прописи



Рр: Лек.вещество доза

Лек.вещество доза

Вспомогательное вещество (основа) доза

M.(f лек.форма) D (t.d N) S:

# Порядок составления развернутой прописи

Основное лекарственное вещество

доза

Вспомогательное лекарственное вещество

доза

Корригент ( коррекция вкуса и запаха)

доза

Вещество , придающее форму, консистенцию

доза

Приготовление Лекарственной формы

Способ применения

# Развернутая пропись

- Выписать 50 грамм пасты, содержащую 5% анестезина
- Rp: Anaesthesini 2,5
- Zinci oxydi 7,5
- Vasellini ad 50,0
- M.f. past.
- D.S.

# Порядок оформления сокращенной прописи рецепта



# Сокращенная форма записи

- Возьми 40 грамм цинковой пасты
- Rp: Past. Zinci 40,0
- D.S:
- Возьми 200 мл 5% стерильного раствора глюкозы
- Rp: Sol. Glucosi 5% 200ml
- Steril.
- D.S: