

Пути введения лекарственных средств. Фармакокинетика.







Фармакокинетика



- Фармакокинетика — раздел общей фармакологии, изучающий процессы всасывания, распределения, метаболизма и выведения ЛС



Пути введения лекарственных средств в организм

Выбор способа введения диктуется:

- Состоянием больного: острота болезни (в случаях, угрожающих жизни больного, вводятся быстродействующие вещества).
- Свойствами лекарств (растворимость, скорость развития эффекта, продолжительность действия лекарств).
- Профессиональной подготовкой врача.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

Резорбтивное
(через кровь)

- ❖ Энтеральный
(через пищеварительный тракт)
- ❖ Парентеральный
(минуя пищеварительный тракт)

Местное

❖ **Наружный**

НАРУЖНЫЙ ПУТЬ

□ **Нанесение на кожу, раны –**
Присыпки, мази, растворы для
примочек, промывания.



□ **Введение лекарственных**
средств в нос - закапывание
капель, введение мази



□ **Введение капель в ухо**



□ **Введение лекарственных**
средств в глаз –
закапывание капель,
закладывание мази





Резорбтивное действие

Энтеральные пути введения



- пероральный (через рот);
- сублингвальный (под язык);
- буккальный («приклеивание» к слизистой щеки, десны);
- дуоденальный (в двенадцатиперстную кишку);
- ректальный (в прямую кишку).

Парентеральные пути введения



- подкожный;
- внутрикожный;
- внутримышечный;
- внутривенный;
- внутриартериальный;
- внутрикостный;
- субарахноидальный;
- трансдермальный;
- ингаляционный.



Энтеральный путь

Через рот (*per os*)

Преимущества

Недостатки

- ❖ Удобство и простота применения;
- ❖ Возможность самостоятельного применения лекарственного средства;

- ❖ Раздражение ЖКТ;
- ❖ Невозможность использования при рвоте и бессознательном состоянии;
- ❖ Медленное и неполное всасывание из-за действия желудочного сока;
- ❖ Частичная инактивация печенью;



Сублингвальный путь

д
е
и
му
щ
ес
тв
а

н
е
д
о
ст
а
т
к
и

- ❖ Действие препарата легко прервать, выплюнув таблетку;
- ❖ Не разрушается желудочным соком;
- ❖ Всасывание происходит минуя печень;
- ❖ Быстрое наступление эффекта;

- ❖ Возможность использования ограниченного числа препаратов;
- ❖ При частом использовании раздражение слизистой полости рта;





Энтеральный путь

Через прямую кишку (*per rectum*)

пр
еи
му
щ
ес
тв
а

н
е
д
о
ст
а
т
к
и

- ❖ Хорошее и полное всасывание;
- ❖ Возможность использования при рвоте;
- ❖ Исключен неприятный вкус и запах лекарств;

- ❖ Отрицательное психологическое воздействие;
- ❖ При частом использовании возможно раздражение слизистых оболочек;



ИНГАЛЯЦИОННЫЙ ПУТЬ

пре
и
му
щ
ес
тв
а

- ◆ Действие лекарства непосредственно в месте патологического процесса;
- ◆ Попадание в очаг поражения, минуя печень, в неизменном виде;

е
д
о
ст
а
т
к
и

- ◆ При местном воспалении плохое проникновение лекарства в очаг поражения;
- ◆ Возможность раздражения слизистых оболочек дыхательных путей лекарственными веществами;



ПАРЕНТЕРАЛЬНЫЙ ПУТЬ

преимущества

- ♦ Быстрота действия;
- ♦ Большая точность дозировки;
- ♦ Исключается влияние пищеварительных ферментов на лекарственные средства;
- ♦ Исключается барьерная роль печени;
- ♦ Незаменим при оказании экстренной помощи;

Н
д
о
с
т
а
т
к
и

- ♦ Строгое соблюдение асептики и антисептики;
- ♦ Использование специальных приборов, инструментов;
- ♦ Строгое соблюдение универсальных мер профилактики ВБИ;
- ♦ Риск постинъекционных осложнений;
- ♦ Невозможность быстро прекратить негативное действие лекарственного средства;
- ♦ Качество работы медицинского персонала;



Фармакокинетика

- От греч. *Pharmakon* - лекарство, *kinetikos* -движущий) - раздел фармакологии, изучающий процессы
 - всасывания, (**адсорбция**)
 - распределения,
 - метаболизма, (**биотрансформация**)
 - выделения лекарственных средств. (**экскреция**)



Всасывание

Процесс движения лекарственного вещества из места введения в системный кровоток

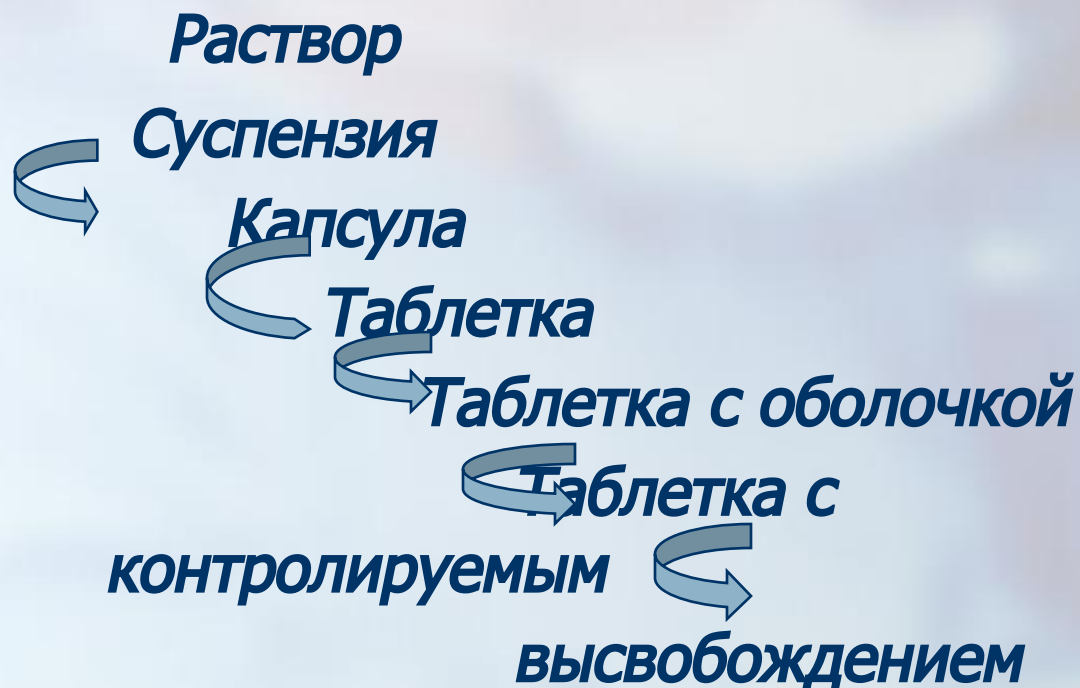
Механизмы:

- Пассивная диффузия
- Активный транспорт
- Фильтрация через поры
- Пиноцитоз



Высвобождение из лекарственной формы

■ Скорость





ЛС, которые принимают внутрь во время еды

- Гипотиазид
- Гризеофульвин
- Пропроналол
- Метопролол
- Цефуроксим аксетил



Препараты, которые принимают внутри за 1 час до еды

- Разрушаются
при $\downarrow$ pH

Ампициллин

Эритромицин

- Связываются с
пищей pH

Тетрациклин

Эритромицин

Фузидин

Сульфаниламиды

Каптоприл

Препараты Fe



ЛС, которые принимают внутрь после еды

- НПВС (курсовой прием)
- Глюкокортикоиды
- Резерпин, раунатин
- Теофиллин, аминофиллин
- Препараты калия



Распределение препаратов в организме

- 1 Зависит от кровотока:

Быстрое поступление в органы с хорошим кровоснабжением (сердце, печень, мышцы)

- 2 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

- Стенка капилляров
- Мембраны клеток
- Гематоэнцефалический
- Плацентарный
- Гематоофтальмический
- Капсула предстательной железы

II. Свойства препарата

- растворимость в жирах

III. Доза препарата



Метаболизм

Метаболизм - процесс химического изменения ЛС в организме

Реакции I типа (несинтетические):

- | | | |
|------------------------|---|-----------|
| - окисление | } | микросомы |
| - восстановление | | печени |
| - гидролиз | | |
| - комбинация процессов | | |



Метаболизм

- **Реакции II типа (синтетические, конъюгации)**
 - **Глюкуронизация - микросомы печени**
 - **Аминоконъюгация**
 - **Ацетилирование**
 - **Сульфоконъюгация**
 - **Метилирование**



Биотрансформация лекарственных веществ





Зависимость фармакокинетики лекарственных веществ от возраста

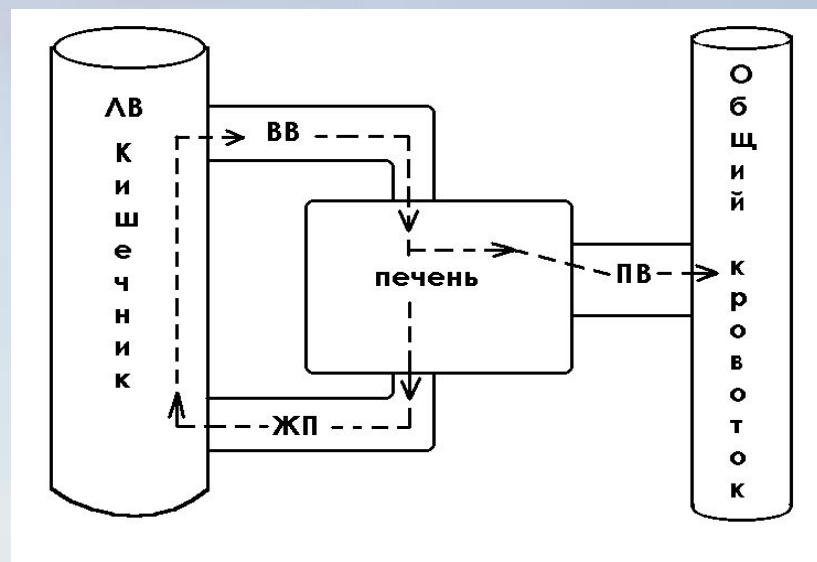
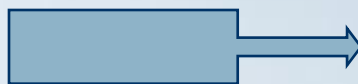




Экскреция

Процесс выделения из организма препарата или его метаболитов без дальнейшего изменения их химической структуры

- Почки
- Печень/желчь
- Кишечник
- Слюна
- Кожа
- Слезы
- Грудное молоко
- Выдыхаемый воздух





Элиминация

- Биотрансформация и экскреция лекарственных веществ объединяются термином «элиминация».
- Важным параметром является **период полуэлиминации** ($t_{1/2}$) — это время, за которое концентрация лекарственного вещества в плазме крови уменьшается на 50%.



Препарат: Диклофенак

Форма выпуска	Путь введения
Таблетки	Пероральный
Мазь	Наружный
Раствор для инъекций	Парентеральный
Суппозитории	Ректальный

