



Введение. Основные понятия и разделы фармакологии. Принципы классификации лекарственных средств





План

1. Предмет и задачи фармакологии, ее связь с другими науками. Значение знаний по фармакологии в практической деятельности фармацевта.
2. История развития фармакологии. Задачи фармакологии как науки, ее разделы.
3. Основные этапы создания и изучения новых лекарственных средств, пути их изыскания.
4. Понятие о лекарственных веществах, лекарственных средствах, лекарственных формах.
5. Понятие о международном непатентованном наименовании, торговом названии лекарственного средства, оригинальном и генерическом лекарственном средстве.
6. Источники получения лекарственных средств. Изыскание новых лекарственных средств, проведение клинических испытаний.

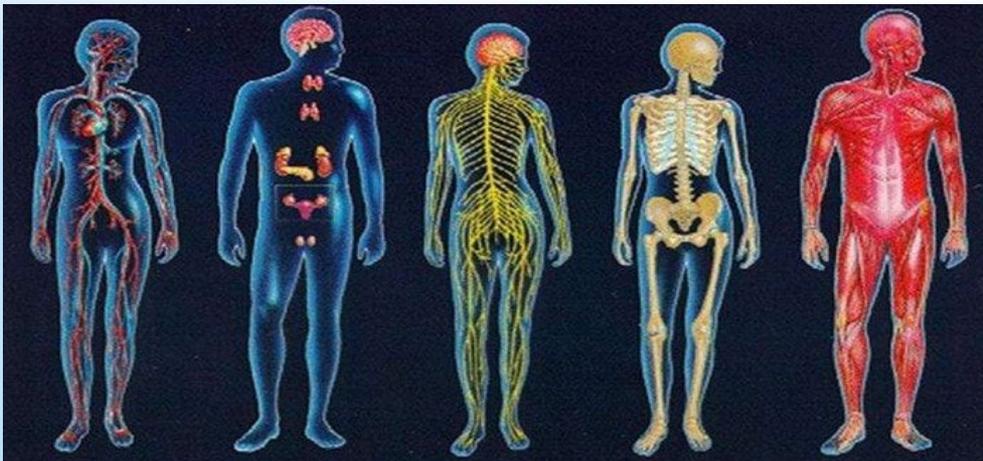


Фармакология - наука о лекарствах во всех аспектах - теоретическая основа фармакотерапии:

а) наука о взаимодействии химических веществ с живыми системами

б) наука об управлении процессами жизнедеятельности организма с помощью химических веществ

Предмет фармакологии: вещество → организм → фармакологический эффект (физиологические и биохимические изменения в живой системе, вызываемые вводимым в организм веществом).



Задачи фармакологии:

1. Изучение механизма действия и влияния лекарственных веществ на органы и системы организма;
2. Исследование нежелательных (побочных) и токсических реакций лекарственных веществ;
3. Установление показаний и противопоказаний к назначению ЛС;
4. Разработка схем рационального дозирования ЛС.



Внимание:

имеются противопоказания. Перед применением необходимо ознакомиться с инструкциями по применению и использованию рекламируемых лекарственных средств, медуслуг, медтехники или получить консультацию специалиста.



- * Так, 20—30-е годы XX в. оказались знаменательными получением инсулина, сульфаниламидных препаратов, и была выявлена гипотензивная активность препаратов раувольфии.
- * В 40-е годы были открыты антибиотики (пенициллин, хлортетрациклин, стрептомицин), выделен кристаллический витамин B₁₂, началось изучение противоопухолевых свойств азотистых ипритов.
- * Значительный прогресс в психиатрии и неврологии связан с открытием в 50-е годы целого ряда психотропных средств (аминазин, галоперидол, диазепам, резерпин, ингибиторы МАО, мепробамат, имипрамин), новых антибиотиков (левомицетин, нистатин, гризеофульвин), антиадренергических средств (р-адреноблокаторы и симпатолитики), противоопухолевых (сарколизин, допан) и др.
- * 60-е и 70-е годы ознаменовались открытием блокаторов гистаминовых рецепторов, кальциевых каналов, ангиотензиновых рецепторов и ингибиторов АПФ, новых антигипертензивных средств (метилдофа, празозин) и НПВС (индометацин, диклофенак натрий), а также противовирусных препаратов и ингибиторов биосинтеза холестерина (статины).

- * В 80-е годы был сделан ряд открытий (активаторы калиевых каналов, ингибиторы протонного насоса, эндотелиальный релаксирующий фактор, блокаторы лейкотриеновых рецепторов), послуживших внедрению новых ЛС. Особенно важным событием явилось биотехнологическое получение инсулина человека.
- * В 90-е годы произошли новые открытия в получении рекомбинантных колониестимулирующих факторов, созданы непептидные блокаторы ангиотензиновых рецепторов для лечения гипертонической болезни, открыта роль NO в действии нитроглицерина и натрия нитропруссида, произведен синтез ингибиторов NO-синтетазы, новых противорвотных средств — блокаторов серотониновых рецепторов. Появились новые антибиотики — цефалоспорины и многие другие препараты.
- * Созданы гипотензивные препараты, взаимодействующие избирательно с имидазолиновыми рецепторами (моксонидин). Открыта новая группа противовоспалительных средств, избирательно ингибирующая фермент ЦОГ-2. Получены препараты, влияющие на систему лейкотриенов: ингибиторы 5-липоксигеназа и блокаторы лейкотриеновых рецепторов (зилеутон, зафирлукаст).

* Разделы современной фармакологии:

- * общая фармакология (изучает общие принципы действия ЛС на организм человека и животных)



- * частная фармакология (изучает отдельные группы ЛС и их терапевтическое применение)



1) фармакодинамика - изучает а) воздействие ЛС на организм человека, б) взаимодействие различных ЛС в организме при одновременном их назначении, в) влияние возраста и различных заболеваний на действие ЛС.

- механизм действия;
- физиологические эффекты;
- биохимические эффекты;
- побочное действие;
- токсическое действие.



2) фармакокинетика - изучает всасывание, распределение, метаболизм и экскрецию ЛС (т.е. как организм пациента реагирует на ЛС)

3) **фармакогенетика** - изучает роль генетических факторов в формировании фармакологического ответа организма на ЛС.

4) **фармакоэкономика** - оценивает результаты использования и стоимость ЛС для принятия решения о последующем их практическом применении.

5) **фармакоэпидемиология** - изучает применение ЛС и их эффекты на уровне популяций или больших групп людей для обеспечения применения наиболее эффективных и безопасных ЛС.

Большинство лекарств являются продуктами химического синтеза.

При этом они могли быть получены:

-Путем скриннинга (просеивания, т.е. поиска определенного вида фармакологической активности среди химических веществ, синтезированных химиками с различными целями). Так были получены, например, сульфаниламиды. Немецкий ученый Домагк, работая на химическом концерне «IG-FI», исследовал антимикробное действие веществ, синтезированных как возможные красители для тканей, в том числе и сульфаниламидсодержащих азосоединений, в результате чего были обнаружены их противомикробные свойства.

-Путем воспроизведения биогенных веществ (например, адреналин, норадреналин, дофамин) и созданием антиметаболитов (например, противоопухолевое средство метотрексат является антиметаболитом фолиевой кислоты)

-Путем модификации молекул соединений с уже известной фармакологической активностью (например, получение синтетических глюкокортикоидов: преднизолона, дексаметазона; полусинтетических и синтетических антибиотиков).

-Путем синтеза активных метаболитов лекарственных веществ (такой известный анальгетик-антипиретик как парацетамол является активным метаболитом ранее применявшегося с аналогичными целями лекарственного средства фенацетина, анксиолитическое средство оксазепам - это метаболит анксиолитика диазепама).

Этапы создания ЛС:

1. Синтез ЛС в химической лаборатории
2. Доклиническая оценка активности и нежелательных эффектов ЛС Минздравом и др. организациями
3. Клинические испытания ЛС

* **Исследуемый лекарственный препарат** - лекарственный препарат, который при проведении клинического исследования (испытания) подвергается испытанию или применяется для сравнения, включая плацебо, в том числе зарегистрированный лекарственный препарат в случае, если способ его применения отличается от утвержденного, а также если он используется по новому показанию для медицинского применения или получения дополнительной информации по утвержденному показанию.

* **Лекарственная форма** - состояние лекарственного препарата, соответствующее способам его введения и медицинского применения и обеспечивающее достижение необходимого эффекта;

* **Лекарственное средство** - средство, представляющее собой или содержащее вещество либо комбинацию веществ, вступающее в контакт с организмом человека, предназначенное для лечения, медицинской профилактики заболеваний человека либо восстановления, коррекции или изменения физиологических функций его организма посредством фармакологического, иммунологического либо метаболического воздействия или для диагностики заболеваний и состояний человека;

* **Лекарственный препарат** - лекарственное средство в виде лекарственной формы.

- * Полное химическое название - описание строения молекулы по международной химической номенклатуре;

аспирин $C_9H_8O_4$
2-ацетокси-бензойная кислота,

- * Непатентованное название, международное непатентованное название (МНН, INN)
- название которое выдается лекарственному средству специальным комитетом ВОЗ или национальным фармацевтическим комитетом. Это название не является чьей-либо интеллектуальной собственностью и может быть использовано любым производителем лекарства. При выборе МНН должны учитываться 3 принципа:
 - * -название должно иметь отчетливое звучание и написание;
 - * -название не должно быть созвучно уже имеющимся наименованиям лекарств;
 - * -название должно отражать родовую связь ЛС. Например, суффикс -олол у блокаторов бета-адренорецепторов, -прил - у ингибиторов АПФ, -сартан- у антагонистов ангиотензиновых АТ 1-рецепторов, префикс цефа-у цефалоспориновых антибиотиков.
- * Если врач выписывает лекарство под его МНН, то он оставляет право выбора производителя ЛС за провизором и оставляет на его усмотрение возможность генерической замены (т.е. отпуска лекарства под любым из его торговых наименований).

- * В зависимости от производителя выделяют оригинальные и генерические лекарственные средства:
- * **Оригинальные лекарства** - лекарства, которые производятся фирмой-разработчиком, т.е. фармацевтическим концерном, который открыл данное лекарство и провел все стадии его изучения. Все оригинальные лекарства, после своего открытия находятся под патентной защитой (срок действия патента в большинстве стран составляет 15 лет).
- * **Дженерики (генерические лекарственные средства)** - производятся фармацевтическим концерном по лицензии фирмы-владельца или после того, как срок патента на лекарство истек. Дженерики не требуют полной программы исследований, для их регистрации фирма иногда должна лишь представить данные о всасывании препарата в сравнении с оригинальным лекарством. Таким образом, дженериковые лекарства всегда дешевле их оригинальных аналогов.
- * **Синоним** лекарственного препарата - это препарат, содержащий то же действующее лекарственное вещество, но выпускаемый другой фирмой и под другим названием.
- * **Аналог** лекарственного препарата - лекарственный препарат той же фармакологической группы, но содержащий другое действующее вещество.
- * Препараты-аналоги должен назначать врач.

Источниками получения лекарств могут быть:

1. Продукты химического синтеза
2. Растительное сырье
3. Ткани животных
4. Продукты жизнедеятельности микроорганизмов
5. Минеральное сырье.

I этап - доклинических испытаний.

- * Включает получение активной субстанции и выявление в экспериментах на животных фармакологической активности, определение параметров острой и хронической токсичности, тератогенного действия (ненаследуемых дефектов в потомстве), мутагенного действия (наследуемых дефектов в потомстве) и канцерогенного действия (опухолевой трансформации клеток).



II этап - клинических испытаний.

- * **Включает 3 фазы:**

- * Фаза I. В ходе проведения этой фазы клинических исследований должен быть получен ответ на вопрос: является ли предлагаемое вещество безопасным? Исследование проводят на небольшом (20 - 30 человек) контингенте здоровых добровольцев.
- * Фаза II. Призвана дать ответ на вопрос: оказывает ли исследуемое вещество заявляемое действие при испытаниях его на больных? Исследование проводят на ограниченном числе пациентов (100 - 300 больных).

- * **Фаза III.** Должна дать ответ на вопрос: является ли вещество эффективным?
Исследования выполняют на большом количестве больных (1000 - 5000 человек). Оценивают эффективность в сравнении с уже используемыми с аналогичными целями лекарственными средствами.
- * После завершения каждого этапа и фаз исследований материалы передаются на экспертизу в Комиссию по лекарственным средствам Министерства здравоохранения.
После завершения III фазы клинических испытаний Комиссия по лекарственным средствам принимает окончательное решение, лекарственное вещество регистрируется в Государственном реестре лекарственных средств и изделий медицинского назначения.
Только после этого можно начинать промышленный выпуск лекарства и его распространение через аптечную сеть.
- * **Выделяют также IV фазу** - постмаркетингового надзора. Цель этой фазы выявление редко встречающихся, но потенциально опасных нежелательных эффектов, которые не могли быть выявлены на предыдущих этапах из-за ограниченного числа наблюдений. В случае регистрации таких нежелательных эффектов лекарство может быть отозвано с рынка.

Спасибо за внимание!

