

Základní farmakologické pojmy

1. Farmakokinetika – jak působí organismus na léčivo

Oblast farmakologie, zabývající se osudem léčiva v organismu. Matematicky popisuje změny koncentrace léčiv v závislosti na čase od podání látky. Změny popisuje farmakokinetickými parametry.

Základními farmakokinetickými parametry jsou eliminační konstanty, distribuční objem, poločas, clearance a biologická dostupnost léčiva.

Eliminační konstanty se liší u jednotlivých typů látek, obecně nám však vyjadřuje množství látky vyloučené organismem za jednotku času.

Distribuční objem je parametr odpovídající zdánlivému objemu krve, který je potřeba, aby byla koncentrace látky rovna koncentraci v reálné krvi. Zjistíme jej tak, že po aplikaci léčiva a jeho distribuci po organismu odebereme pacientovi krev a koncentraci změříme. Čím vyšší je hodnota distribučního objemu, tím více se látka dostává do tkání.

Poločas (někdy také udáván jako poločas rozpadu) je veličina, která vyjadřuje čas, za který koncentrace látky klesne a polovinu.

Clearance udává objem plazmy, který se zcela očistí od dané látky za jednotku času. Můžeme ji rozdělit na clearance renální a nerenální. Renální clearance označujeme množství látky, které je vyloučeno z organismu ledvinami. Nerenální je někdy také označována jako hepatální, protože další eliminační mechanismy jsou pro většinou léčiv zanedbatelné. Tu pak můžeme stanovit jako rozdíl celkové a renální clearance.

Biologická dostupnost je veličina udávající rychlost a množství léčiva, které dosáhne systémové cirkulace po aplikaci dávky léčiva.

Aby měl lék požadované účinky na organismus, musí být v organismu v určité koncentraci. Ta se v čase od podání mění, především vlivem resorpce (absorpce), distribuce, metabolizace a exkrece.

Resorpcí je myšlen přestup léčiva do krevního řečiště. To souvisí se způsobem aplikace, kdy u IV aplikací není resorpce tak podstatná, jako u aplikací, kdy látka není vpravena přímo do krevního řečiště pacienta. Na resorpci mají vliv jak vlastnosti samotného léčiva (molekulární hmotnost, náboj, rozpustnost...), tak vlastnosti organismu a místo aplikace léčiva.

Distribuce léčiva v organismu opět záleží na jeho molekulové hmotnosti, náboji, rozpustnosti. Rozpustnost v tucích je důležitou podmínkou pro přestup přes

biomembrány. Distribuce může být také ovlivněna navázáním účinné látky na proteiny v plazmě. Díky tomu účinek nemusí být tak intenzivní, ale prodlužuje to dobu jeho trvání. Distribuce léčiva se děje pomocí prosté difuze, pasivního či aktivního transportu, transcytózy a endocytózy.

Metabolizace slouží k přeměně látky na takové produkty, které tělo dokáže vyloučit. Výsledkem může být přeměna aktivního léčiva na inaktivní metabolit, přeměna neaktivního prekurzoru na aktivní formu léčiva, přeměna aktivního léčiva na další aktivní metabolity či přeměna aktivního léčiva na toxické metabolity. Metabolizace není u všech druhů zvířat stejná. Vyskytují se mezidruhové rozdíly, které mají u některých léčiv zásadní význam. Příkladem může být paracetamol, který je relativně častou příčinou otrav koček.

Exkrece je děj, kdy dochází k vyloučení produktů metabolizace a tím ke snížení koncentrace účinné látky v organismu. Hlavním orgánem zodpovědným za exkreci látek jsou ledviny, některé látky odcházejí z organismu pomocí biliární exkrece (stolicí).

Praktické využití farmakokinetiky je především při výpočtu účinné dávky léku.

2. Farmakodynamika – jak působí léčivo na organismus

Oblast farmakologie, zabývající se účinkem léčiva na organismus a mechanismy jeho účinku. Důležitý je vztah mezi velikostí dávky a účinkem dané látky. Vliv na farmakodynamiku mají fyzikální a chemické vlastnosti léčiva či jeho schopnost navázat se a interagovat s cílovými strukturami. Farmakodynamiku dělíme na obecnou a speciální. Obecná se zabývá obecnými pravidly pro působení látek na organismus a obecnými mechanismy účinku. Speciální se zabývá účinkem skupin léčiv či konkrétních látek.

3. Souhrn údajů o přípravku – SPC (Summary of product characteristics)

Písemné shrnutí všech informací o přípravku. Obsahuje zejména léčivé indikace, kontraindikace, dávkování, podmínky skladování, nežádoucí účinky.

4. Nežádoucí účinek

Jedná se o účinek léku, který je nepříznivý a je nezamýšlený. Je navozen běžnou dávkou léku. Jsou uvedeny v SPC. Můžeme také rozlišit závažný nežádoucí účinek (účinky ohrožující život pacienta či vážně poškozující zdraví) a neočekávaný nežádoucí účinek (takový, který není uvedený v SPC)

5. Ochranná lhůta

Doba od skončení podávání léčivého přípravku, po kterou může dojít k nepříznivému ovlivnění zdravotní nezávadnosti živočišných produktů.

6. Exspirace

Označuje lhůtu, po kterou je přípravek vhodný k použití. Po jejím vypršení nesmí být lék požíván a musí být řádně zlikvidován. Uvádí se především u očkovacích látek, některých celkových anestetik, antibiotik a dalších.

7. Šarže

Označuje množství výrobku, vyrobeného v daném výrobním cyklu při produkci HVLP. Přípravky z jedné šarže jsou stejnorodé.

8. Číslo výrobní šarže

Číselný kód, ve kterém je zahrnuta šarže, měsíc a rok výroby a doba použitelnosti výrobku. První číslo udává dobu použitelnosti přípravku v letech, předposlední dvojčíslí je měsícem výroby a poslední dvojčíslí je rokem výroby. Ostatní znaky mezi tím slouží pro účely výrobce. Takto tvořený číselný kód je však povinný pouze pro české výrobce, u zahraničních produktů se může lišit.

Př. Číslo výrobní šarže: 31560318 (čti 3-156-03-18) - První číslo, tedy 3, udává, že výrobek je použitelný po dobu 3 let od výroby. Předposlední dvojčíslí, tedy 03, udává měsíc výroby březen. Poslední dvojčíslí, tedy 18, udává rok výroby 2018. Vlastní označení šarže pro účely výrobce je 156.