

Způsoby aplikace léků a jejich inovační trendy.

PharmDr. Ondřej Zendulka, Ph.D.

Způsoby aplikace léků

1. Lékové formy – přehled
2. Způsoby aplikace léků
3. Inovační trendy v aplikaci léků

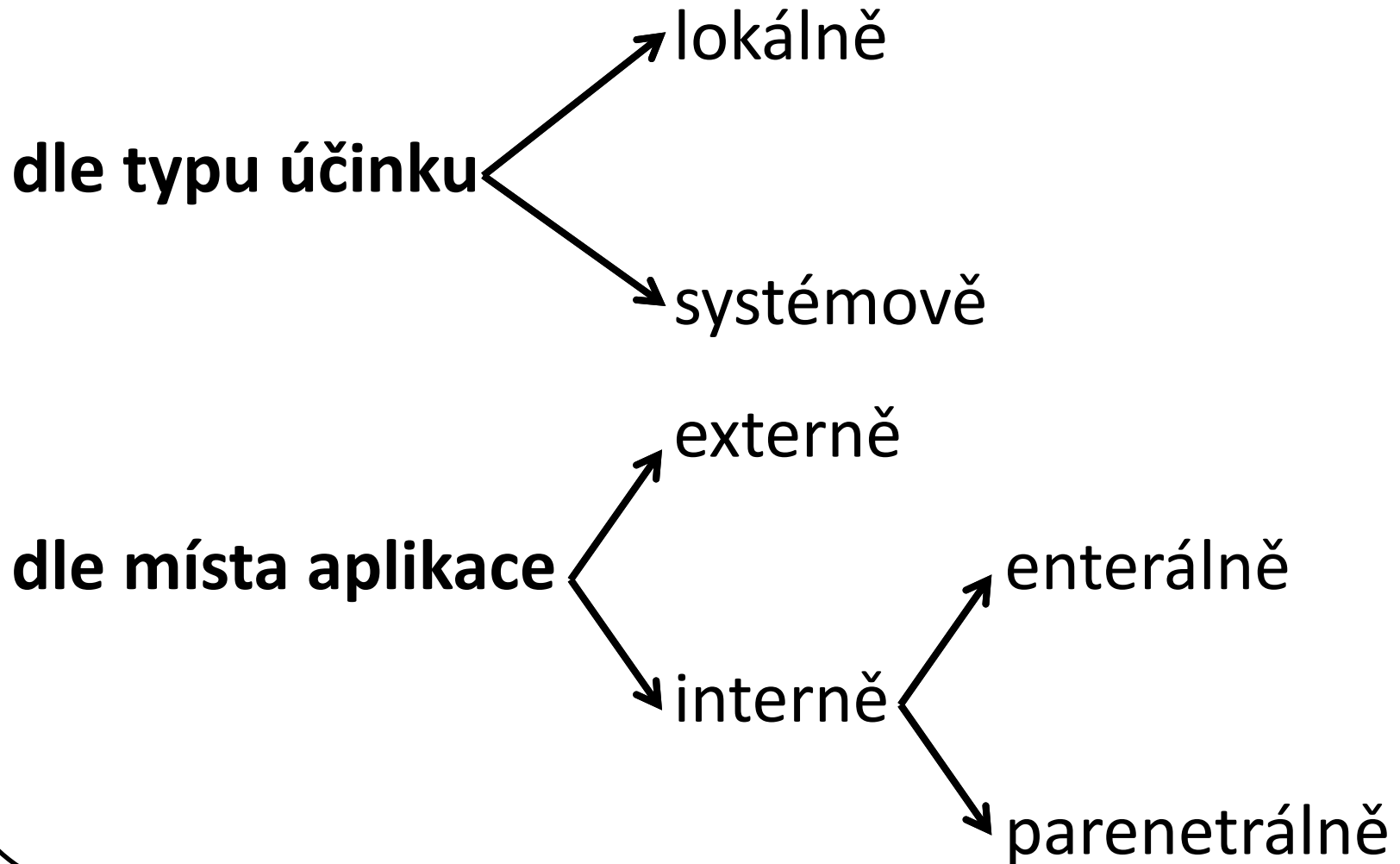
Léková forma

- konečná podoba, v níž je léčivý přípravek podáván nemocnému
- ovlivňuje zejména farmakokinetické parametry aplikovaného léčiva

Rozdělení:

- *podle konzistence*
 - tuhé
 - polotuhé
 - tekuté
 - plynné
- *podle způsobu užití (vnitřní/vnější-ostatní)*
- *podle tvarového uspořádání (specifické /nespecifické)*
- *podle počtu obsažených účinných látek (1 nebo více)*

Způsoby aplikace léků



Způsoby aplikace léků

Aplikace

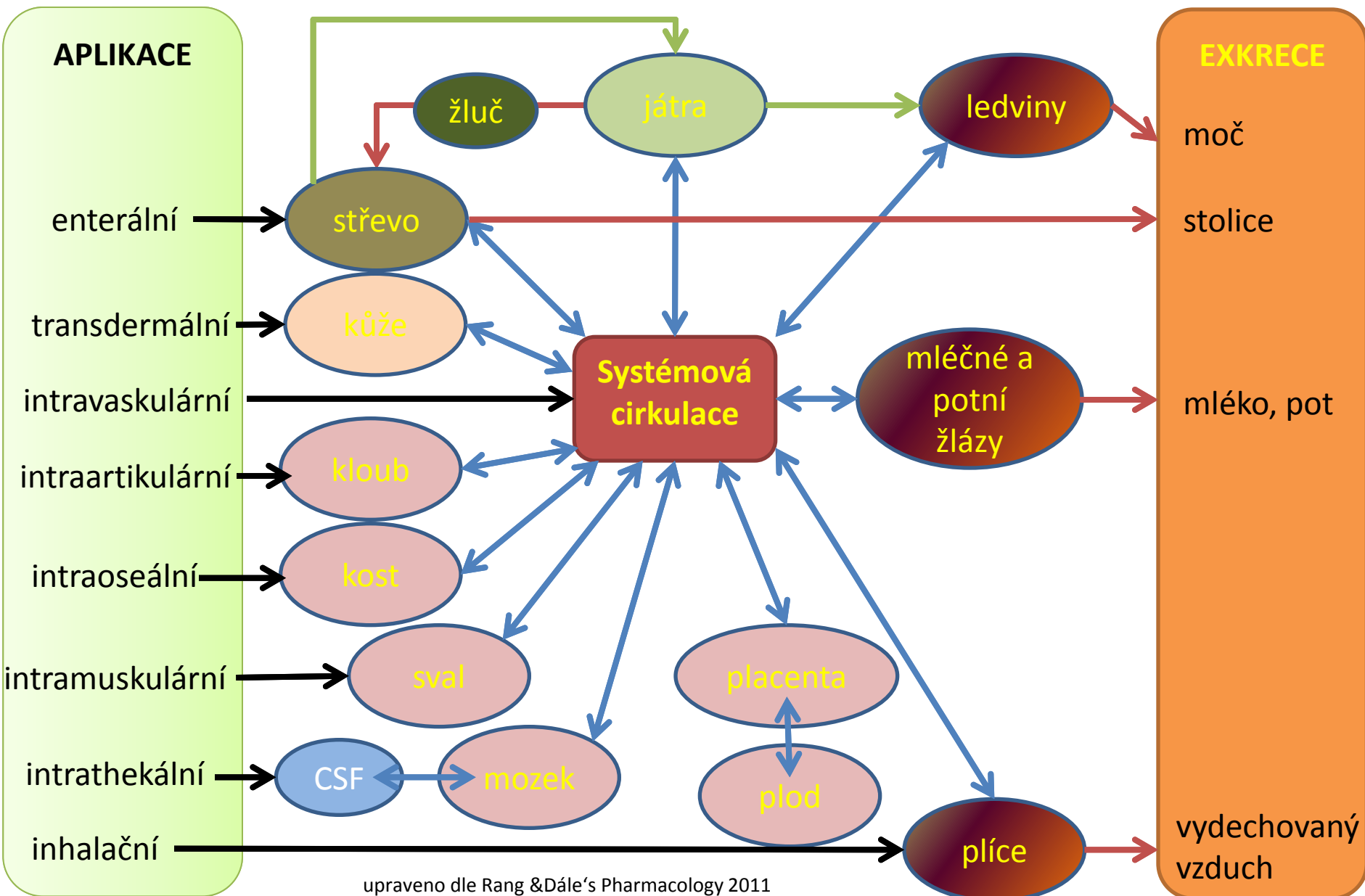
LOKÁLNÍ

- omezený průnik léčiva z místa podání do okolí
- cílený účinek na postiženou tkáň/orgán
- snížení rizika NÚ

SYSTÉMOVÁ

- léčivo přestupuje do systémové cirkulace
- možnost ovlivnění všech tkání a orgánů
- vyšší riziko NÚ

Schéma systémového podání léčiv



Způsoby aplikace léků

Aplikace

EXTERNÍ

- aplikace léčiva topicky na pokožku, sliznice nebo do tělních dutin

- účinek lokální/systemový

INTERNÍ

- aplikace léčiva jinam než na pokožku, sliznici nebo do tělní dutiny

- účinek lokální/systemový

Vnější (externí) aplikace léků

Epikutánní (topická)

Konjunktivální

Intranazální

Inhalační

Rektální

Vaginální

sublingvální, intrauretrální, dentální, gingivální, orální,
endotracheopulmonální, itraaurální....

Epikutánní (topická) aplikace léků

Lokální účinek

- masti, krémy, pasty, náplasti, roztoky...
- minimální NÚ
- dermatologické indikace

Systemový účinek

- transdermální aplikace léčiv
- většinou ve formě náplastí
- kontinuální uvolňování léčiva
- lokální i systémové NÚ
- vysoká compliance
- snadné přerušení terapie

Konjunktivální aplikace léků

- většinou ve formě očních kapek nebo mastí
- lokální efekt
- riziko systémových NÚ
- specifické požadavky na kvalitu LP

Intranazální aplikace léků

- kapky, masti, spreje
- lokální účinek
 - antiseptika, ATB
 - antihistaminika, dekongesce
 - antiflogistika
- systémový účinek
 - hormony (ADH, gonadotropin, inzulin)
 - analgetika, antivirotika

Inhalační aplikace léků

- plyny, aerosoly
- systémový účinek – celková anestetika
- lokální účinek – antiastmatika
- rychlý nástup účinku
- minimální presystémová eliminace
- aplikace z tlakových nádob nebo pomocí specifických instrumentů (turbohaler, diskhaler, nebulizátor....)

Rektální aplikace léků

- čípky, tobolky, tablety, pěny, tampony
- alternativa pro p.o. podávaná léčiva
- nespolehlivá absorpce

Vnitřní (interní) aplikace léků

Enterální

1. pro lokální efekt léčiva v GIT

- per os nebo per rectum
- minimum nežádoucích účinků
- riziko interakcí se systémově podávanými

léčivy

Vnitřní (interní) aplikace léků

Enterální

2. pro systémový efekt

- absorpce léčiva z různých částí GIT
 - lze ovlivnit lékovou formou
- „pomalý“ nástup účinku
- účinek závisí na „compliance“ pacienta

Enterální LF s řízeným uvolněním

- řízené uvolňování - kontinuální
- pulzní
- systémy řízeného uvolňování: matrice
zásobníky
částice
nanočástice
- 1952 Spansules

Vnitřní (interní) aplikace léků

Parenterální

1. pro lokální efekt léčiva

- i.v. léčiva nebo jiný typ injekční aplikace
- aplikace injekční/ostatní
- omezení absorpce = prodloužení účinky + snížení rizika NÚ

Vnitřní (interní) aplikace léků

Parenterální

2. pro systémový efekt léčiva

- i.v. x e.v. aplikaci
- farmakokinetické rozdíly
- specifické kvalitativní požadavky na LF
- implantáty

Vnitřní (interní) aplikace léků

Parenterální

2. pro systémový efekt léčiva

- intravenózně
- subkutánně
- intramuskulárně
- intradermálně
- intrathekálně
- intraatrikulárně, intraokulárně, intraoseálně

Vnitřní (interní) aplikace léků

- intratekálně

Vnitřní (interní) aplikace léků

- intraatrikulárně
- intraokulárně
- intraoseálně

Vnitřní (interní) aplikace léků

Implantáty

- degradovatelné/nedegradovatelné
- většinou s.c. nebo oční implantáty
- systémový účinek/lokální účinek
- kontinuální přívod léčiva
- compliance
- nevýhoda - ukončení terapie
- kontinuální x pulzní uvolňování léčiva

Způsoby aplikace léků

Faktory ovlivňující výběr způsobu aplikace
léčiva:

- fyzikálně-chemické vlastnosti léčiva
- terapeutická indikace + závažnost stavu
- benefit:risk ratio
- komorbidita, komedikace

Lékové formy

1. generace:

- LF s neřízeným uvolňováním (konvenční LF)

2. generace:

- LF s řízeným uvolňováním (controlled release, CR)

3. generace:

- LF s cílenou distribucí (drug delivery system)

Transdermální podání

Pasivní náplasti 3. generace

- léčivo obsaženo v adhezivní vrstvě
- snížené riziko dráždění
- snížená koncentrace léčiva
- zmenšení rozměrů

Aktivní transdermální přípravky

- ve stádiu vývoje
- fyz. principy usnadňující nebo řídící uvolnění a přestup léčiva

Transdermální podání

Elastické lamely s mikrojehlami

- schopnost aplikovat i makromolekulární látky
- vakcinace, imunizace
- spíše intradermální aplikace

Lipozomy

- částicové systémy
- nosiče polárních i nepolárních léčiv
- biokompatibilní, degradovatelné
- využitelné pro cílený transport léčiva

Nanočástice

- velikost mezi 1-1000 nm
- podle struktury: nanosféry x nanotobolky
- degradovatelné, netoxické
- značná variabilita vlastností
- chytré nanočástice