

Přehled lékových forem a aplikačních způsobů. Faktory ovlivňující účinek léčiva.

Léková forma = konečná podoba léčivého přípravku, v níž je podáván pacientovi

- Směs léčivých (LL) a pomocných látek (PL), kt. určuje tvar a vlastnosti léčivého přípravku, je přizpůsobena způsobu aplikace a ovlivňuje chování LL v organismu

Generace lékových forem:

1. generace = klasické lékové formy
2. generace = lékové formy s řízeným uvolňováním (retardety)
3. generace = lékové formy s řízenou biodistribucí

Klasifikace lékových forem

Podle konzistence: tekuté, polotuhé, tuhé, plynné (tuhé: tvarově specifické, tvarově nespecifické)

Podle způsobu užití: K vnitřnímu užití (*Ad usum internum*) – Peroralia, Parenteralia

K jinému užití (*Ad usum alium*) – Ocularia, Nasalia, Inhalanda...

Tekuté lékové formy

- Pro vnitřní užití:
 1. Perorální = roztoky, suspenze, emulze k perorálnímu použití, tinktury, kapky, sirupy
 2. Parenterální = injekce, infuze
- Pro zevní užití = oční kapky a vody, ušní kapky, nosní kapky; tekuté přípravky k aplikaci na kůži; tekuté přípravky k aplikaci na sliznice

Polotuhé lékové formy

- Aplikace na kůži nebo na sliznice, místní účinek (dermatologika) nebo celkový účinek (TTS)
- Masti, krémy, gely, pasty, náplasti s léčivou (TTS, Emplastra)

Tuhé lékové formy

- Tvarově specifické: tablety, čípky (rektální), vaginální globulky, tobolky
- Tablety: neobalené, obalené, enterosolventní, šumivé, dispergovatelné v ústech, s řízeným uvolňováním, žvýkací, vaginální
- Tobolky: tvrdé, měkké, enterosolventní, s modifikovaným uvolňováním

Plynné lékové formy = aerodisperze

- Topické = ušní, nosní, orální, sublingvální a kožní spreje
- Inhalační přípravky = tekuté (rozprašování tekutin), prášky k inhalaci (velikost částic určuje místo vstřebávání)
- Pěny = kožní, rektální, vaginální pěny

Aplikační způsoby

Systémová aplikace = léčivo se dostává do krevního oběhu → působí na celý organismus

- Enterální aplikace: p.o. a p.r.
- Parenterální aplikace: injekce a infuze

Lokální aplikace = léčivo se nevstřebává do krevního oběhu → působí jen v místě podání

- Zevní aplikace: na kůži, sliznice, oko, ucho...
- Vnitřní aplikace: léčivo podáno do GIT, ale z GIT se nevstřebává

Systémová aplikace – enterální

1. Perorální (per os, p.o.) – nástup účinku závisí na fyz-chem vlastnostech LL a PL, někdy ↓ biolog. dostupnost: first-pass efekt

2. Perrektální (per rectum) – nevyvolává nauzeu, ↓ biologická dostupnost než p.o. – malá plocha střešní stěny, kratší nástup účinku než p.o. – *plexus venosus rectalis* ústí přímo do dolní duté žíly („obchází játra“)

Systémová aplikace – parenterální

1. Neinjekční aplikace

- a) orální – vstřebávání sliznicí úst (bukálně, sublingválně), lipofilní látky – rychlá absorpce, př. nitroglycerin
- b) inhalační – plyny, páry těkavých roztoků nebo velmi drobné částice, terapie onem. dýchacích cest
- c) transdermální – lékové formy vyšších generací, řízené uvolňování (tzv. TTS), př. Evra (HAK), nikotinová náplast, opioidní analgetika

d) transnazální – velké prokrvení nosní sliznice, ale lokální dráždivost nebo možnost narušení funkce cílů, př. kalcitonin, antimigrenika

e) vaginální – př. Nuvaring (HAK)

2. Injekční aplikace

a) injekce – malý objem kapaliny, i.v. aplikace – rychlý nástup účinku, i.m., s.c. – depo ve tkáni, postupná absorpce do krevního oběhu

b) infuze – větší objemy kapaliny, parenterální výživa, minerály, glukóza, ATB, cytostatika atd.

Faktory ovlivňující účinek léčiv

a) *Faktory vztahující se k léčivému přípravku*

- fyzikální a chemické vlastnosti léčiva – např. lipofilita látky, optická izomerie
- léková forma – určuje biologickou dostupnost
- interakce s potravou – změna farmakokinetiky a/nebo farmakodynamiky léčiva

b) *Faktory vztahující se k nemocnému*

- věk – specifika dětí a seniorů (viz podklady k 5. přednášce)
- pohlaví – cyklické změny u žen, klimakterium, těhotenství a laktace
- tělesná hmotnost a konstituce – odlišnosti v kinetice i dynamice léčiv u obézních, kachektických, osob s vysokým podílem svaloviny...
- cirkadiánní rytmy – chronofarmakologie, vliv denní nebo roční doby
- patologický stav – vliv na kinetiku i dynamiku léčiva
- genetické faktory (genotyp, fenotyp) – genetický polymorfismus

c) *Faktory vztahující se k léčivému přípravku i k pacientovi*

- dávka – jednotlivá, denní, terapeutická, maximální, toxická, letální, terapeutický index a šíře
- opakované podávání léčiva – kumulace, tolerance, tachyfylaxe, senzitivace
- kombinace a interakce léčiv
- pozdní účinky léčiv – teratogenita, mutagenita, kancerogenita