



Lääkkeen vaiheet ja vaikutukset elimistössä

Krista Puustinen



Ammattitaitovaatimus ja arviointikriteerit

- › Opiskelija käyttää alan työmenetelmiä, -välineitä ja materiaaleja perushoidossa ja huolenpidossa, saattohoidossa ja **lääkehoidossa**
 - tietää ja tarkkailee tavallisimpien muisti-, pitkäaikais- ja kansansairauksissa sekä mielenterveys- ja päihdesairauksissa käytettävien lääkkeiden vaikutuksia, yhteisvaikutuksia ja monilääkityksiä, tunnistaa yleisimpiä haitta- ja sivuvaikutuksia sekä huomioi mahdollisia lääkkeiden väärinkäytön ilmiöitä ja tiedottaa niistä työryhmässä
 - ohjaa asiakasta ja hänen lähiverkostoaan työyksikön ohjeiden mukaisesti



Farmakokinetiikka ja Farmakodynamiikka

FARMAKOKINETIIKKA

- › Imeytyminen
- › Jakautuminen
- › Metabolia
- › Erittyminen

FARMAKODYNAMIIKKA

- › Vaikutusmekanismit
- › Lääkeaineen vaste



Lääkkeen vaiheet ja vaikutukset elimistössä

› Lääkehoidon tavoite:

- Lääkeannoksesta on mahdollisimman paljon hyötyä mahdollisimman pienillä haitoilla

› Liian suuri lääkeannos (haitat lisääntyvät)

› Liian pieni lääkeannos (ei saada haluttua vaikutusta)

› Jotta lääkeaine vaikuttaa halutusti, pitää lääkeaineen kulkeutua kohteeseen, jossa vaikutusta tarvitaan

Tämä lääkkeen vaiheita ja vaikutuksia tutkiva tieteenala on
FARMAKOLOGIA



Lääkärin määräämä
lääkeannos

Haluttu
vaikutus

Lääkkeen ja asiakkaan
ominaisuudet, sairaudet, muut
elimistössä samanaikaisesti
olevat lääke- ja ravintoaineet

Farmakokinetiikka

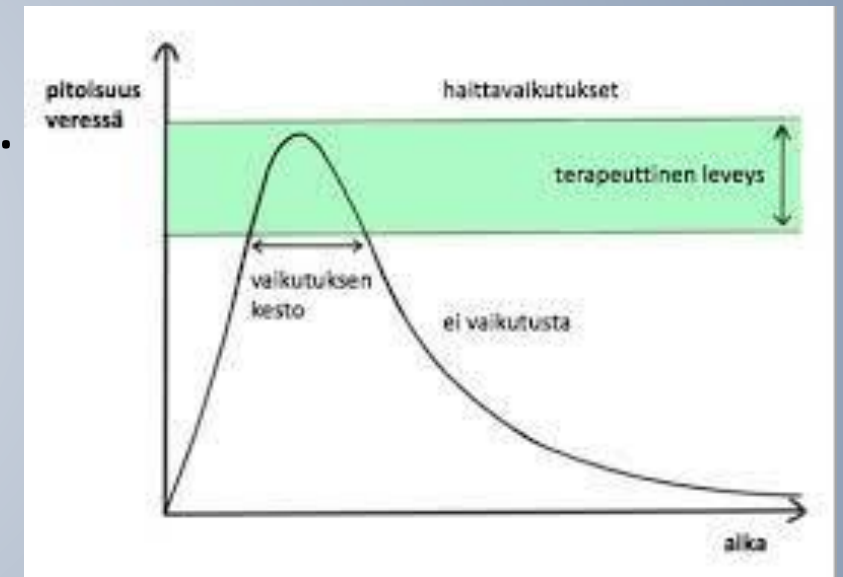
- › Tarkastelee lääkkeen eri vaiheita elimistössä:
 - Imeytyminen
 - Jakautuminen
 - Aineenvaihdunta (metabolia)
 - Erittyminen
- › Lääkkeen kulkeutumiseen elimistössä vaikuttaa monet tekijät
 - Verenkierto (suurin osa lääkeaineista siirtyy vaikutuspaikkaan verenkierron mukana)
 - › Ihon paikallishoito (lääkevoiteet)
 - › Silmätipat
 - › Keuhkoihin hengitettävät
 - Munuaisten ja maksan toiminta
 - Lääkeaineen kyky siirtyä elimistössä

Paikallisesti
vaikuttavat
lääkeaineet

Osa näistä
pääsee myös
verenkiertoon →
haittavaikutukset

Terapeuttinen leveys

- › Tarkoitetaan suurimman turvallisen ja pienimmän tehoavan annoksen välistä eroa
- › Kapea terapeuttinen leveys on esim.
 - Varfariini (Marevan®)
 - Digoksiinilla (Digoxin®)
 - Fenytoiinilla (Hydantin®)
 - Teofylliinillä (Retafyllin®)
 - Litiumilla (Lito®)
- › Tällaista lääkeainetta käytettäessä jo melko pieni pitoisuuden muutos verenkierrossa voi johtaa haittavaikutuksiin tai lääkkeen tehottomuuteen





Lääkkeen vaiheet elimistössä

› Lääkkeitä voidaan antaa elimistöön käyttämällä eri antoreittejä

– Nieltävä lääke

- › Ruokatorven kautta mahalaukuun, jossa se hajoaa.
- › Ohutsuolessa lääkeaineen hajoaminen jatkuu
- › Lääkeaine imeytyy verenkiertoon
- › Suurin osa lääkeaineesta kulkeutuu maksaan, jossa alkureitin aineenvaihdunta voi muuttaa lääkeaineen kokonaan tai osin toiseksi aineeksi
- › Jäljelle jäävä aine pääsee verenkiertoon

– Kudokseen injektoitava lääke

- › Ihon alle tai lihakseen injektoidut lääkeaineet imeytyvät kudosten kautta verenkiertoon

– Hengitysteihin annettava lääke

- › Vaikuttaa pääasiassa paikallisesti, mutta osa lääkeaineesta pääsee imeytymään kudosten kautta verenkiertoon

– Suoraan verenkiertoon annettava lääke

- › Laskimon kautta suoraan verenkiertoon
- › Verenkierron mukana jakautuu elimistöön ja jakautuu vaikutuspaikkaansa

› Lääkkeen poistuminen elimistöstä

- Lääkeaineen aineenvaihduntaa eli metaboliaa tapahtuu maksassa
- Lääkeaine tai sen metabolia tuotteet poistuu elimistöstä munuaisten erittämän virtsan mukana



Lääkkeen biologinen hyötyosuus

- › Ilmoitetaan prosentteina 0-100 %
- › Laskimoon annettavan lääkeaineen hyötyosuus on 100 %
- › Hyötyosuuden ollessa pieni ja sen imeytyminen heikkenee esim. ruoan vaikutuksesta → välttämättä ei saada riittävää vaikutusta
- › Kaikkia lääkeaineita ei voida antaa suun kautta → pitänyt kehittää injektioita



Farmakokinetiikan vaikutuksia lääkehoitoon

› Imeytyminen

- Systeemisesti verenkierron välityksellä vaikuttavan lääkkeen tulee imeytyä kudoksesta verenkiertoon
 - › Lääkeaineen imeytymistä ruoansulatuskanavasta heikentää ruoansulatuskanavan huono liikkuvuus, mahan pH, ruoka, juoma
 - › Lihakseen, iholle tai ihon alle annettavien lääkkeiden imeytymiseen verenkiertoon vaikuttaa mm. pistopaikan kudoksen verenkierron vilkkaus
 - › Lääkemuodolla voidaan vaikuttaa lääkeaineen imeytymisnopeuteen – esim. hitaasti vapauttava depottabletti tai nopeasti suun limakalvolta imeytyvä lääkemuo

› Alkureitin aineenvaihdunta (metabolia) eli ensikierron aineenvaihdunta

- Tapahtuu joillekin suolesta imeytyville lääkeaineille, kun ne kulkeutuvat suolesta maksan kautta yleiseen verenkiertoon
 - › Ikä, geneettiset ominaisuudet, ruokailu, muut lääkeaineet tai maksasairaudet vaikuttavat alkuvaiheen aineenvaihduntaan
 - › Lääkemuodolla – esim. antamalla lääkeaine suun limakalvolle, iholle tai ihon alle, keuhkoihin, lihakseen, laskimoon – voidaan välttää alkureitin metabolia
 - › Alkureitin metabolian vuoksi joitain lääkeaineita annetaan suun kautta suurempia annoksia kuin esim. laskimoon



Farmakokinetiikan vaikutuksia lääkehoitoon

› Jakautuminen

– Verenkierrosta lääkeaine

- › Lääkeaine voi olla jakautumatta verenkierron ulkopuolelle, jolloin se vaikuttaa vain verenkierrossa, tai jakautumalla sen ulkopuolisiin kudoksiin
- › Jotkut lääkeaineet kertyvät kudoksiin, kuten maksaan, sydämeen ja munuaisiin. Tällaiset lääkkeet poistuvat elimistöstä yleensä hitaasti.
- › Joidenkin lääkeaineiden jakautuminen ja siten vaikutuspaikkaan pääsy voi muuttua raskausaikana, vastasyntyneillä, vanhuksilla tai tulehdussairauden aikana. Tällöin annosta voidaan joutua muuttamaan.

› Lääkkeen erittyminen

– Lääkeaineen poistuminen elimistöstä muuttomattomana

- › Rasvaliukoiset lääkeaineet muuttuvat elimistössä vesiliukoisiksi yhdisteiksi, jotta ne voivat poistua elimistöstä
- › Tärkein metaboloiva elin on maksa, jonka CYP-entsyymeillä on merkittävä asema lääkeaineiden aineenvaihdunnassa
- › Entsyymien aktiivisuudessa on perinnöllisiä eroja, ja monet lääkeaineet sekä esimerkiksi tupakka lisäävät tai heikentävät näiden entsyymien toimintaa
- › Tämän vuoksi maksan kautta hajoavia lääkeaineita käytettäessä tulee ottaa huomioon yhteisvaikutusten mahdollisuus



Farmakokinetiikan vaikutuksia lääkehoitoon

› Lääkeaineen eliminaatio

– Poistuminen elimistöstä

- › Lääkeaine voi poistua elimistöstä yllä kuvatuilla tavoilla: erittymällä, metaboloitumalla tai molempia reittejä käyttäen
- › Lääkeaineen poistumisessa elimistöstä on yksilöllistä vaihtelua, mikä johtuu esimerkiksi maksan kyvystä käsitellä lääkeainetta sekä munuaisten toiminnasta
- › Puoliintumisaika ($T_{1/2}$) on luonteenomainen piirre kullekin lääkeaineelle. Se kuvaa aikaa, jossa elimistön lääkeainepitoisuus pienenee puoleen.



Kuinka lääke vaikuttaa elimistössä?

- › Farmakodynamiikka = lääkkeen vaikutus elimistöön, elimiin, soluihin ja molekyyleihin
- › Lääkeaineella vahvistetaan tai estetään elimistön omia reaktioita
- › Jotta lääkeaine vaikuttaa se tarvitsee kohdesoluissa olevia solun osia = **kohdemolekyylejä**
 - Reseptorit
 - Entsyymit
 - Kuljetusproteiinit



Kuinka lääke vaikuttaa elimistössä

- › Lääkeaineen vaste = elimistön, elimen, kudoksen tai solun reaktioita lääkeaineeseen
- › Lääkeaineen teho = lääkkeestä saadun vasteen suuruus
- › Lumelääke (Plasebo) = ei sisällä farmakologisesti vaikuttavia aineita