

# 1. Félév

## 4. szeminárium

Dr. Varga Balázs

DE ÁOK Farmakológia és Farmakoterápia tanszék

# Tételek

7.

- ▶ Deszenzibilizáció, tachyphylaxia és tolerancia fogalma
- ▶ Indirekt paraszimpatikus izgatók
- ▶ Antihiperlipidémiás szerek
- ▶ Belső használatra szánt osztatlan porok

8.

- ▶ Gyógyszerek transzportja a biológiai membránokon
- ▶ Hatás-szerkezet összefüggés bemutatása a szimpatikus izgatók példáján
- ▶ Szívelégtelenségben ható szerek
- ▶ Tabletták

# Deszenzibilizáció, tachyphylaxia és tolerancia – fogalmak tisztázása

- ▶ Gyakran, a gyógyszer hatása fokozatosan lecsökken, ha folyamatosan vagy ismételten adják (a biológiai válasz csökken)
- ▶ *Deszenzibilizáció* és a *tachyphylaxia* fogalmakat gyakran szinonimaként használják, de a **deszenzibilizáció** inkább egy **mechanizmus** a hatáscsökkenésre, míg a **tachyphylaxia** inkább egy **jelenség** neve:
- ▶ A tachyphylaxia egy hirtelen fellépő gyógyszer-hatáscsökkenés, ami gyakran percek alatt kialakul, és ami nem függ a dózistól
- ▶ A *tolerancia* fogalmát rendszerint egy gyógyszerre adott válaszkészség fokozatosabb csökkenésének leírására használják, melynek kialakulása napokba vagy hetekbe telik
- ▶ A *gyógyszer rezisztencia* fogalmát antimikrobiális vagy tumorellenes gyógyszerek hatékonyságának csökkenésére használják

# A gyógyszer-hatáscsökkenés mechanizmusai

Számos mechanizmus okozhat hatás-csökkenést, mint pl.:

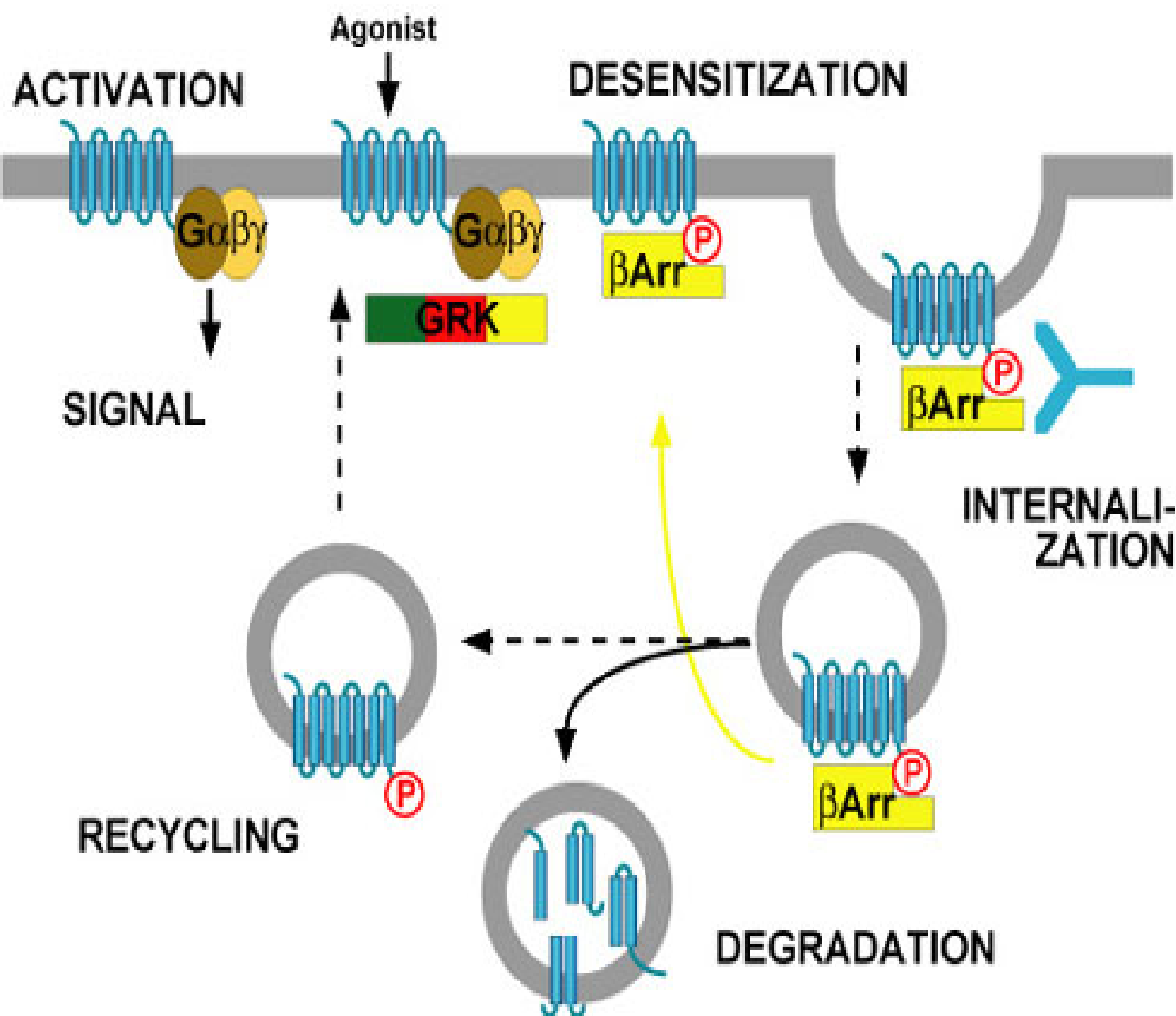
- ▶ • a receptorban bekövetkező változás
- ▶ • receptor áthelyeződés
- ▶ • mediátorok kimerülése (elfogyása)
- ▶ • megváltozott gyógyszer metabolizmus
- ▶ • élettani alkalmazkodás
- ▶ • gyógyszer aktív eltávolítása a sejtekből (tumorelles terápia jellemző)
- ▶ • gyógyszer ellenes antitestek képződése (pl. inzulin)

# Deszenzibilizáció

receptorban bekövetkező változás + receptor áthelyeződés

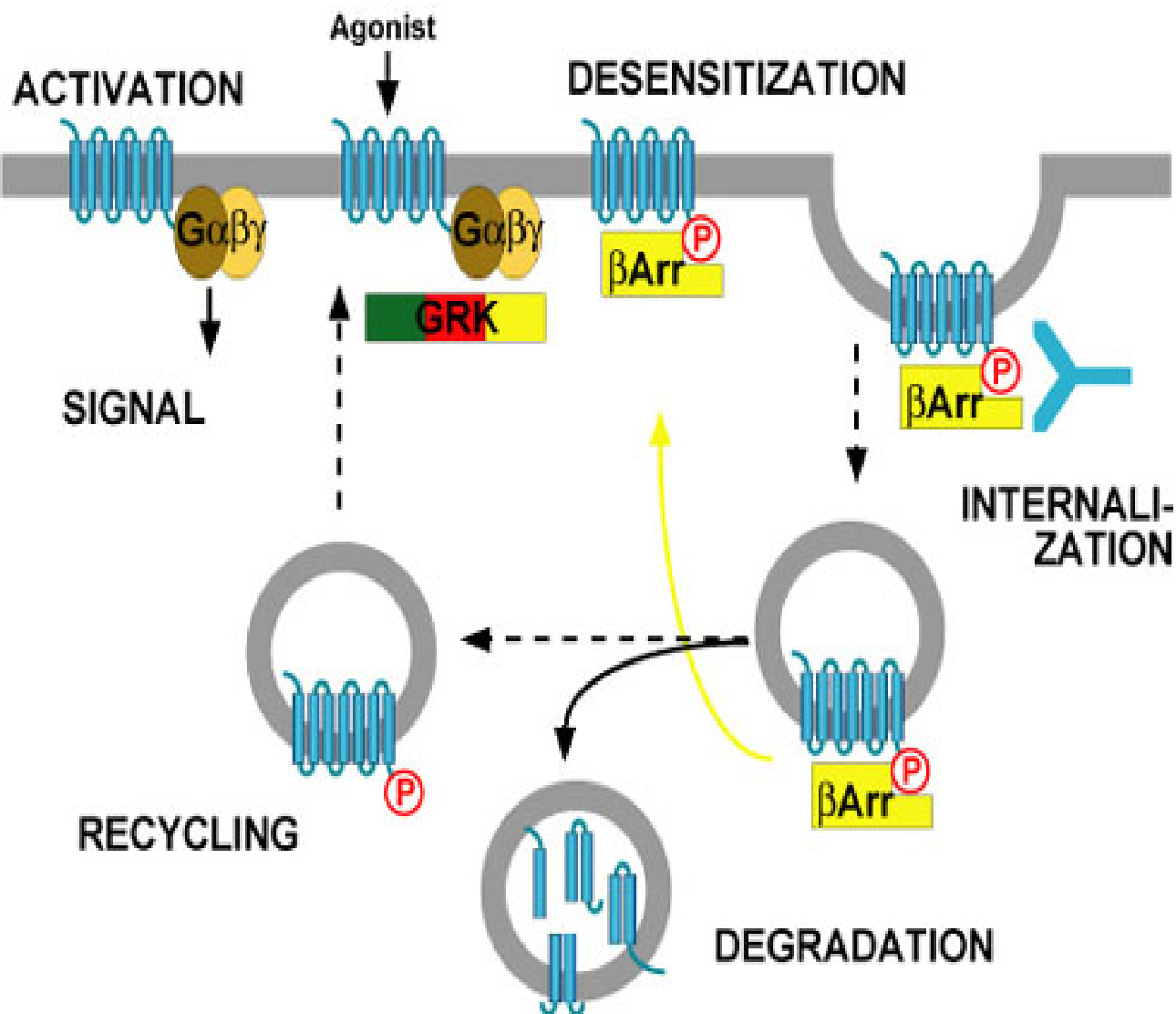
- ▶ Önvédelmi mechanizmus túlzott mértékű ingerek ellen
- ▶ A sejt először lekapcsolja a másodlagos hírvivő útvonalakat  
→ „uncoupling”  
később: receptor internalizáció → down-reguláció
- ▶ Ennek a szétkapcsolásnak („uncoupling”) a folyamatát 1998-ban írták le először (*Lefkowitz*)
  - ▶ A receptor még mindig a sejtfelszínen található, de funkcióját elveszti.
- ▶ Leggyakoribb G-fehérje kapcsolt receptorok esetén  
(a gyógyszerek több, mint 30%-ának ezek a támadáspontjai)

# Deszenzibilizáció – 1. Uncoupling



- ▶ Agonista receptorhoz-kötődése kivált egy jelet
- ▶ A kötődés szubsztráttá is alakítja a receptort egy egész kináz-család, a G-fehérje kapcsolt receptor kinázok (GRK-k) számára
- ▶ Ezek a kinázok csak agonista-aktivált receptorokat foszforilálnak
- ▶ A foszforilált receptor arrestin molekulák kötőhelyévé válik
- ▶ Ez a kötés a receptort hozzáférhetetlenné teszi a G-fehérjék számára (az arrestin-kötött receptor deszenzibilizálttá/érzéketlenné válik)

# Deszenzibilizáció - 2. Internalizáció (lassabb folyamat)



- ▶ Az arrestin-kötődés a receptort internalizációra jelöli
- ▶ Mert az arrestin-ek a klatrin-burkolt gödrök komponenseihez is kötődnek
- ▶ Így az arrestin-kötött receptorok klatrin-burkolt gödrökbe mozognak majd internalizálódnak
- ▶ Az internalizált receptorok membrán-részek endocitózisával jutnak a sejtbe
- ▶ A receptorok később lebomlanak vagy újra kikerülnek a sejtfelszínre

# Internalizáció

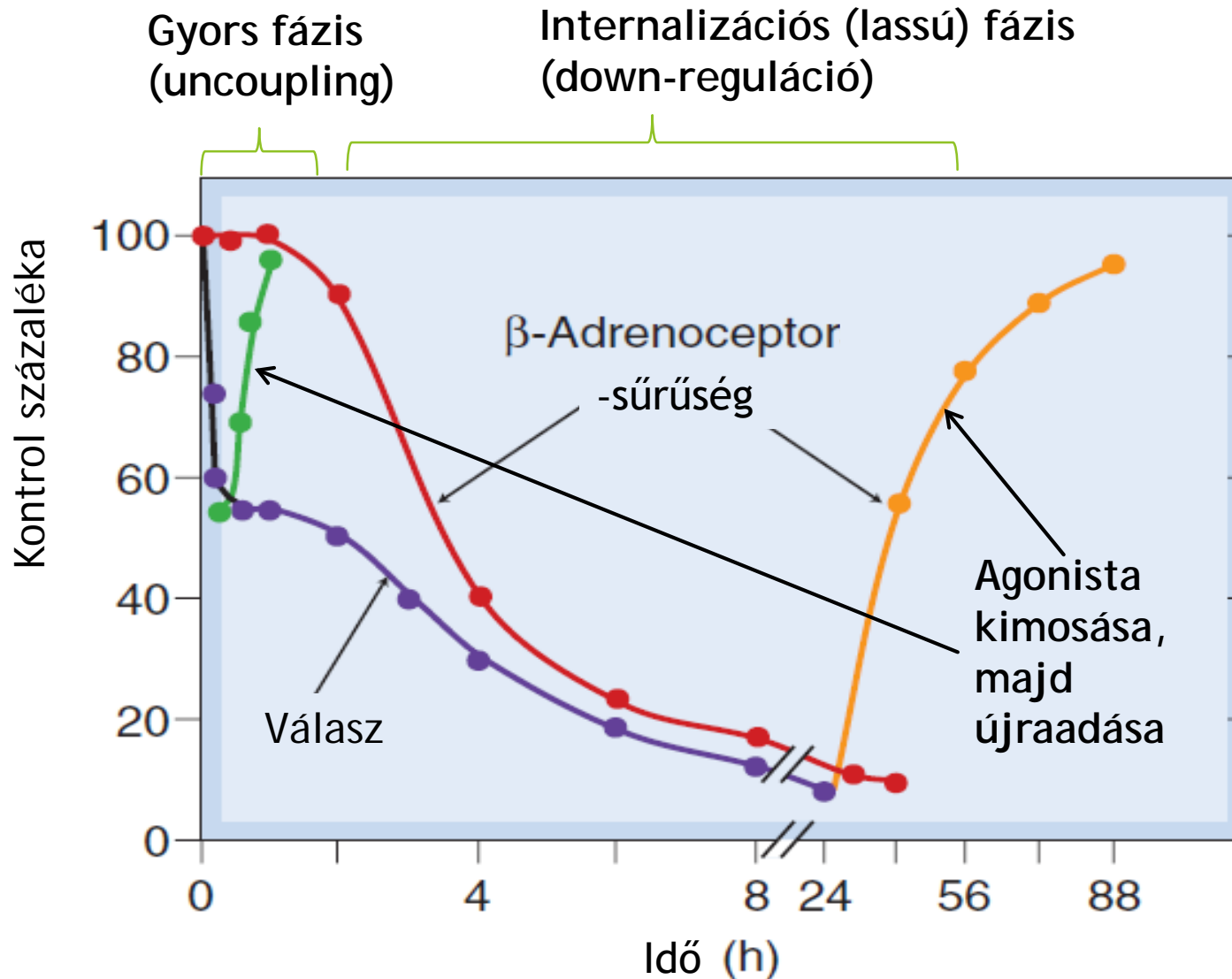
- ▶ Ez a típusú alkalmazkodás gyakori a beta-receptoroknál és a hormon receptoroknál
- ▶ Általában ez egy nem kívánt komplikáció a klinikai alkalmazás során, de kihasználható
- ▶ Például a **gonadotrophin-releasing hormont (GnRH)** alkalmazzák endometriosis vagy prosztata daganat kezelésére

Mert folyamatosan adva paradox módon csökkenti a gonadotropin felszabadulást

(ellentétben normál **serkentő** hatásával fiziológiai szekréció esetén, ami viszont pulzáló)



# Deszenzibilizáció



# Tachyphylaxia

- ▶ **Tachyphylaxia** (Görög *tachys*, „gyors”, és *phylaxis*, „védelem”)
- ▶ A hatás azonnali (akut) csökkenése a gyógyszer adagolása után (perceken belül kialakulhat).
- ▶ Egy kezdeti dózis után vagy kisebb dózisok sorozata után is bekövetkezhet
- ▶ **Okozhatja:**
  - ▶ Gyors deszenzibilizáció (lásd korábban)
  - ▶ Vagy mediátorok gyors kimerülése (elfogyása)
    - ▶ A gyógyszerhatást kialakító neurotranszmitterek elfogynak vagy számuk jelentősen csökken (pl.: efedrin, amfetamin)

# Tachyphylaxia példák

- ▶ Beta-2 agonisták (asthma kezelés)
  - ▶ Tachyphylaxia és tolerancia is kialakul a bronchoprotektív és bronchodilatáló hatásra nézve
  - ▶ Kifejezetten a hosszú hatású agonisták esetén (pl. formoterol)
- ▶ Helyi glükokortikoid kezelés gyakori bőrgyógyászatban.
  - ▶ Ún. *intermittáló* pulzus terápia — néhány napos-hetes kezelés váltakozva kezelés-mentes periódusokkal — megelőzheti a tachyphylaxia kialakulását
- ▶ Desmopressin (vasopressin V2-rec agonista)
  - ▶ Vérzékenység ellen, emeli a vWF szintjét
  - ▶ Klinikai alkalmazás limitált tachyphylaxia és tolerancia miatt

# Tolerancia

- ▶ A gyógyszer-tolerancia fogalma:  
ismételt felhasználás után a gyógyszer hatása csökken
  - ▶ A dózis növelése visszaerősítheti a hatást,
  - ▶ de fel is gyorsíthatja a tolerancia kialakulását
- ▶ kialakulása napokba vagy hetekbe telik (fokozatosabb csökkenés)
- ▶ A gyógyszer tolerancia jellemzői:
  - ▶ visszafordítható,
  - ▶ Mértéke függ
    - ▶ a gyógyszertől,
    - ▶ Dózistól,
    - ▶ Használat gyakoriságától,
  - ▶ Egyazon gyógyszer különböző hatásaira különböző mértékben alakulhat ki tolerancia
- ▶ Két fő típus:
  - ▶ Farmakodinámiás tolerancia
  - ▶ Farmakokinetikai tolerancia

# Farmakodinámiás tolerancia

- ▶ Farmakodinámiás tolerancia alakul ki, ha egy adott anyagra adott sejtes válasz csökken ismételt használat után
- ▶ Okozhatják:
  - ▶ Lassú receptor deszenzibilizáció,
    - ▶ a receptorsűrűség csökkenése
  - ▶ Mediátorok/enzim-kofaktorok lassú kimerülése (elfogyása)
- ▶ Fontos: a gyógyszer vérszintje farmakodinámiás tolerancia esetén nem változik!
- ▶ példa: opioidok (morfin)

# Farmakokinetikai tolerancia

- ▶ Farmakokinetikai tolerancia azért alakul ki, mert csökken az a gyógyszer mennyiség, ami eléri a hatás helyét
- ▶ Ennek oka lehet a gyógyszer lebontásában résztvevő enzimek indukciója pl.: CYP450
- ▶ Ez a tolerancia-forma a legszembetűnőbb szájon át való bevételkor, mert más beadási utak elkerülhetik a first-pass-metabolizmust
- ▶ Példák: alkohol, karbamazepin - indukálják saját metabolizmusuk

# Példák - Nitrát tolerancia

(mediátorok kimerülése hosszútávon)

Nitrátok ismételt adása simaizom-preparátumokhoz csökkent relaxációt eredményez, feltehetőleg részben a szabad -SH csoportok elfogyása miatt



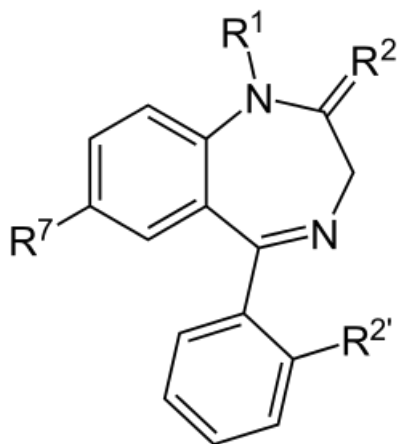
Tolerancia a nitrátok antianginás hatására

- ▶ Rövid-hatású szerek (pl. glicerín-trinitrát) hagyományos formái ellen nem alakul ki klinikailag jelentős mértékben
- ▶ De hosszú-hatású szerek ellen igen (pl. izoszorbid-mononitrát)
- ▶ vagy glicerín-trinitrát ellen nyújtott-felszívódású formák esetén (pl. transzdermális tapasz formájában)

# Példák – Benzodiazepin-tolerancia

(egyes hatásokra)

- ▶ *Vita tárgya, hogy kialakul-e tolerancia a benzodiazepinek szorongásoldó hatásaira.*
- ▶ *Viszont, izomrelaxáns hatásukra egyértelműen kialakul tolerancia.*





# Példák- Opioid-tolerancia

(egyes hatásokra)

- ▶ Az opioidok számos hatása ellen alakul ki tolerancia néhány napon belül ismételt adagolás után
- ▶ ideértve:
  - ▶ fájdalomcsillapító hatás
  - ▶ hányinger,
  - ▶ eufória és
  - ▶ légzés-depresszió
- ▶ De sokkal kevésbé befolyásolódik:
  - ▶ székrekedést okozó hatás
  - ▶ pupilla-szűkítő hatás
- ▶ Ezért, függőknél a normál fájd.csill. dózis 50-szerese sem okoz légzésdepressziót, de kifejezett székrekedés és pupillaszűkület jellemző.
- ▶ Kereszt-tolerancia kialakulhat azonos receptorokon ható opioidokkal szemben
- ▶ Klinikailag, az opioidok dózisát emelni kell a hatékony fájd.csill. hatás eléréséhez a tolerancia miatt.



# Érdekesség - Mithridatizmus

(nincs rá jó magyar kifejezés)

- ▶ **Mithridatizmus** jelentése: úgy védekezni mérgezés ellen, hogy a fokozatosan nem-halálos dózisokat adagolni.
  - ▶ A fogalom VI. Mithridátész pontoszi királytól ered, aki annyira félt a megmérgezéstől, hogy rendszeresen kis dózisokat vett be, hogy védetté váljon.
- ▶ Ritka gyakorlati felhasználás: állatkerti gondozók, kutatók, cirkuszi művészek, akik mérgező állatokkal szoros kapcsolatban állnak
- ▶ Ausztráliában és Brazíliában több extrém mérgező kobra és viperafélék ellen sikerrel érték el így immunitást.
- ▶ Mithridatizmust földimogyoró allergia kezelésére is alkalmazzák.

The background features abstract, overlapping green geometric shapes, primarily triangles and polygons, in various shades of green, creating a modern and scientific aesthetic.

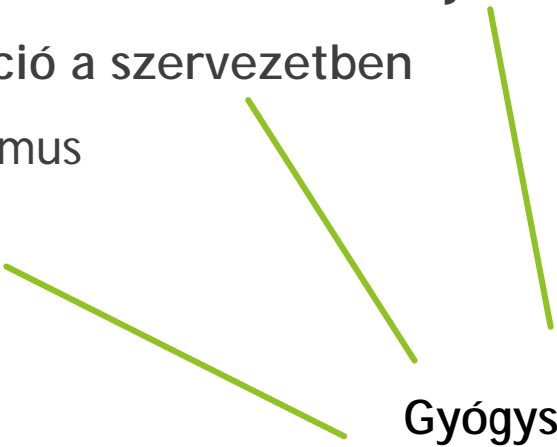
# Gyógyszerek transzportja a biológiai membránokon

# Farmakokinetika

- ▶ A gyógyszer sorsa 4 szakaszra bontható, amelyet az 'ADME' betűszó jelöl:

- ▶ • Abszorpció az alkalmazás helyéről
- ▶ • Disztribúció a szervezetben
- ▶ • Metabolizmus
- ▶ • Exkréció

Gyógyszermolekulák sejtmembránokon való átjutása szükséges



# Gyógyszermolekulák átjutása sejtmembránokon

- ▶ A sejtmembránok = barriereket (akadály, gát) képeznek a szervezet vízterei között
- ▶ Membrán választja el az extra- és intracelluláris tereket
- ▶ Az epitheliális barrier = szorosan kapcsolódó sejtek rétege pl.: GI mucosa, vesetubulus
  - ➔ minden gyógyszermolekula legalább két membránon kell áthaladjon (külső és belső), hogy átjusson

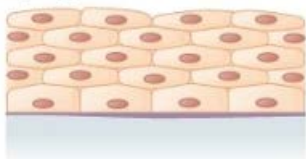
Egyrétegű laphám



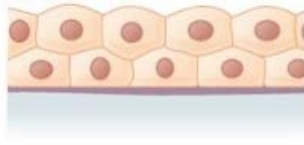
Egyrétegű köbhám



Többrétegű laphám



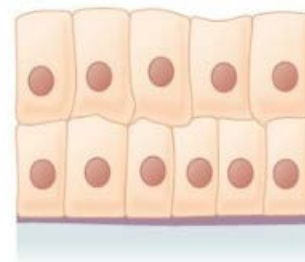
Többrétegű köbhám



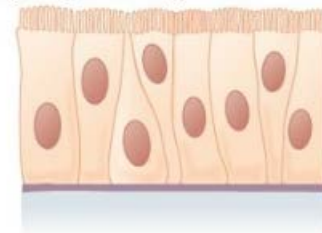
Egyrétegű hengerhám



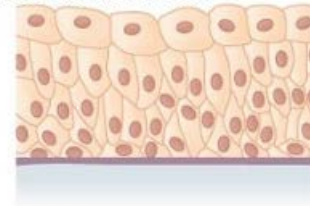
Többrétegű hengerhám



Többsejtmagsoros hengerhám



Átmeneti hám (urotélium)

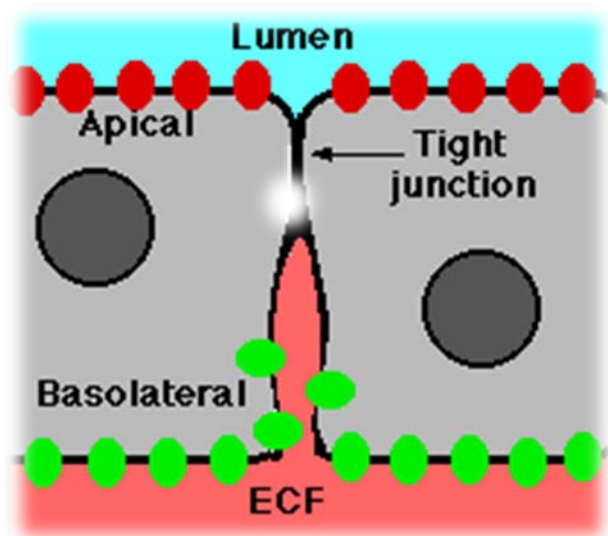


# Gyógyszermolekulák átjutása sejtmembránokon

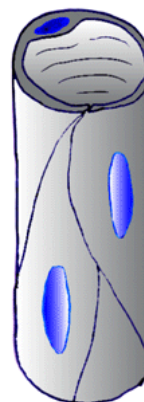
A vaszkuláris endothelium még bonyolultabb, anatómiai elhelyezkedése és átjárhatósága szövetről szövetre változik

1. ► Egyes szervekben, különösen a KIR-ben és a placentában tight junction-ök vannak a sejtek között

Ez megakadályozza az esetleg káros molekulák vérből szövetbe való szivárgását.



Continuous  
Capillary



Typical  
Locations

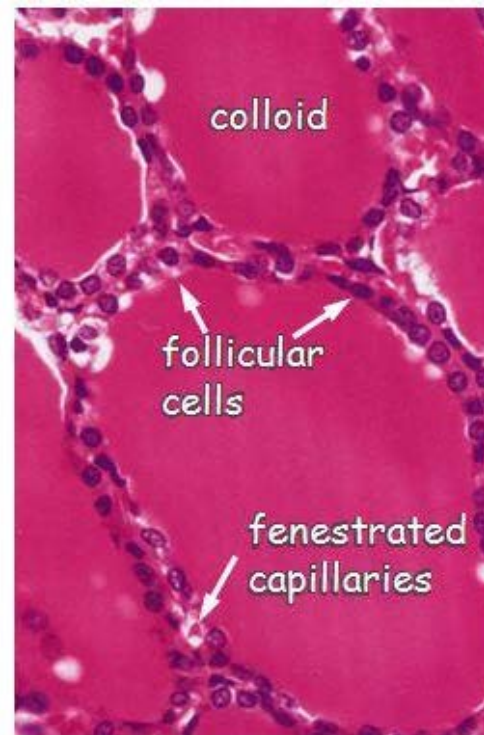
fat  
muscle  
nervous  
system

# Gyógyszermolekulák átjutása sejtmembránokon

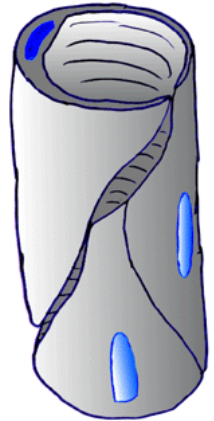
2. ► Más szervekben (pl. májban, lépben), diszkontinuus az endothel (nem-összefüggő), amely szabad átjárást tesz lehetővé a sejtek között.

A májban a hepatocyták alkotják a barriert az intra- és extravaszkuláris kompartmentek között és átvesznek számos endothel funkciót.

3. ► Az ún. fenesztrált endothel endokrin mirigyekben fordul elő, elősegítik a hormonok és más molekulák véráramba jutását.



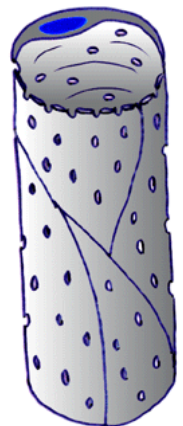
Discontinuous Capillary



Typical Locations

liver  
bone marrow  
spleen

Fenestrated Capillary

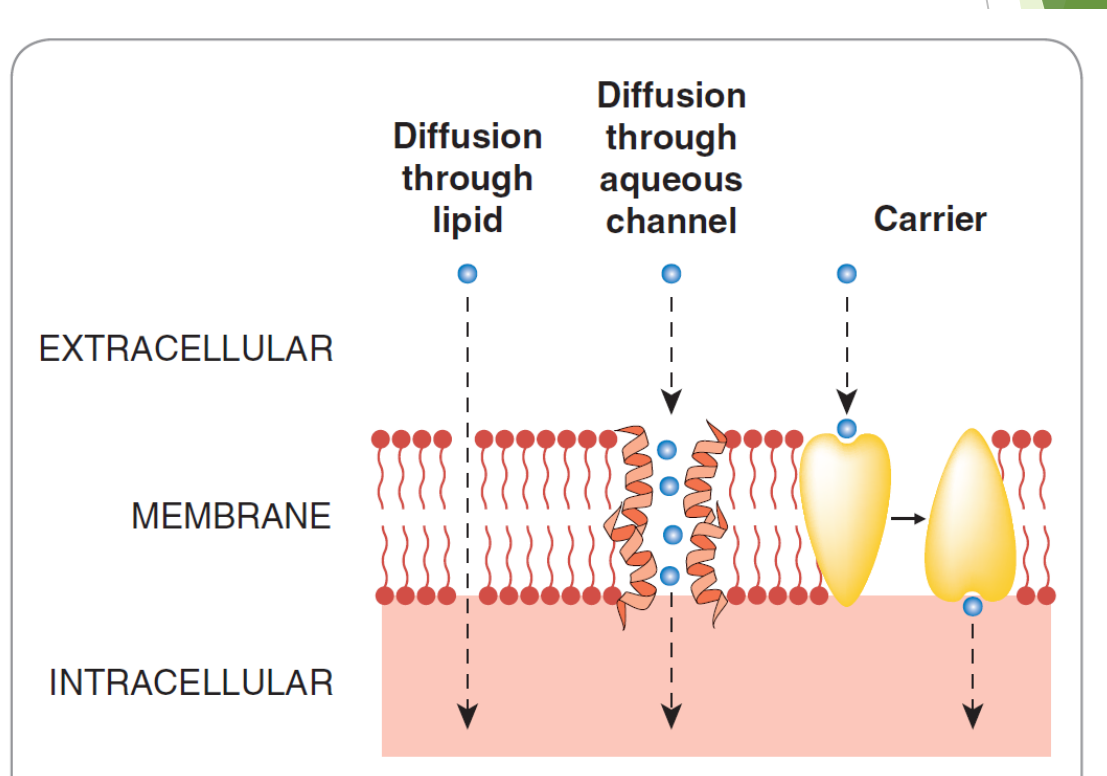


Typical Locations

intestinal villi  
endocrine glands  
kidney glomeruli

# Fő útvonalak

- ▶ A kis molekulák 4 fő útvonalon keresztül juthatnak át a membránokon:
  - ▶ I. diffúzió közvetlenül a lipidrétegen keresztül
  - ▶ II. carrier-mediált transzport
  - ▶ III. diffúzió vizes pórusokon keresztül melyeket speciális, transzmembrán fehérjék képeznek (*aquaporin*-ok)
  - ▶ IV. *pinocytosis*





# I. Membrán-diffúzió

- ▶ A membrán-diffúzió jellemzője:  
A *permeabilitási koefficiens*:  
A membránon át egységnyi területen egységnyi idő alatt átjutó molekulák száma.
- ▶ Az apoláris molekulák (amelyekben az elektronok egyenletesen oszlanak meg) szabadon oldódnak a membrán-lipidekben, ezért könnyen diffundálnak át a membránon.

# A lipidoldékonyság hatása a diffúzióra

- ▶ Következésképpen, szoros összefüggés van a lipid-oldékonyság és a membrán áteresztő képessége között különböző gyógyszermolekulákra nézve
- ▶ A lipid-oldékonyság meghatározza a gyógyszer farmakokinetikai viselkedését
- ▶ A bélből való felszívódást, a különböző szövetekbe való bejutást és a vesén keresztüli kiválasztást meg lehet jósolni a gyógyszer lipid-oldékonyságának ismeretében

# A pH hatása a diffúzióra

- ▶ A membránon való átjutást bonyolítja, hogy a legtöbb gyógyszer gyenge sav vagy bázis
  - ▶ Ezért ionizált és nem-ionizált formában is léteznek
  - ▶ a két forma aránya a pH-val változik
- ▶ Az ionizált forma lipid-oldékonysága nagyon alacsony  
→ gyakorlatilag nem képesek átjutni a membránokon
- ▶ A töltés nélküli forma lipid-oldékonysága a kémiai szerkezettől függ, de
- ▶ A legtöbb gyógyszer töltés-nélküli formája eléggé lipid-oldékony → gyorsan átjutnak a membránokon

# A pH-változtatás fontos következményei

- ▶ Vizelet savanyítása felgyorsítja a gyenge bázisok kiválasztását és visszatartja a gyenge savak kiválasztását
- ▶ A vizelet lúgosítása ellentétes hatást vált ki: csökkenti a gyenge bázisok kiválasztását és növeli a gyenge savak kiválasztását
- ▶ A plazma pH növelésére (pl. nátrium-bikarbontáttal) a gyenge savak a KIR-ből a plazmába dúsulnak
- ▶ A plazma pH csökkentésére (pl. karbonanhidráz-bénító acetazolamiddal) a gyenge savak a KIR-ben dúsulnak  
→ neurotoxicitásuk nő

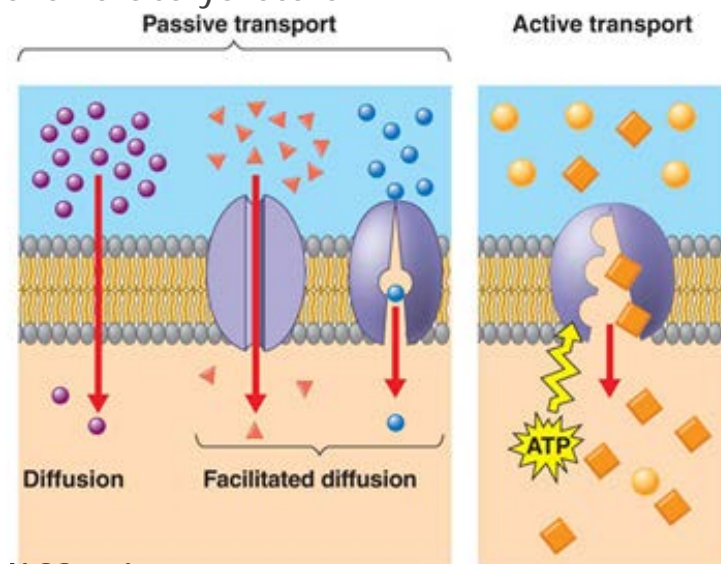
## II. Carrier-Mediált transzport

- ▶ Számos sejtnek van speciális transzport mechanizmusa az élettanilag fontos molekulák belépésének és kijutásának szabályozására:

- ▶ cukrok,
- ▶ aminosavak,
- ▶ neurotranszmitterek
- ▶ fém ionok

### Két fő típus:

- ▶ Aktív transzport (ATP-függő)
- ▶ Passzív transzport (vagy facilitált diffúzió, carrier fehérjék által)



# Transzporter fehérjék

## *solute carrier (SLC) transzporterek*

Oldott anyagok **passzív** mozgását közvetítik = elektrokémiai gradiensüknek **megfelelően**

A mechanizmus neve **facilitált diffúzió** és a transzporter általában „uniporter” \*

## *ATP-binding cassette (ABC) transzporterek*

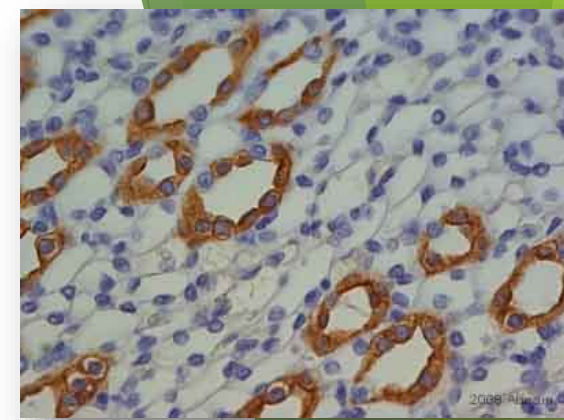
Ezek **aktív** pumpák melyek **ATP** energiáját használják

Legfontosabbak:  
**P-glycoprotein-ek (P-gp)**  
másnév: **multidrug resistance protein 1**  
Fontos szerepük van a **abszorpcióban, disztribúcióban és eliminációban**

\* SLC-k egy csoportja másodlagos aktív transzportot végző „antiporter” pl.: OAT-k, OCT-k

# III. Aquaporin-ok

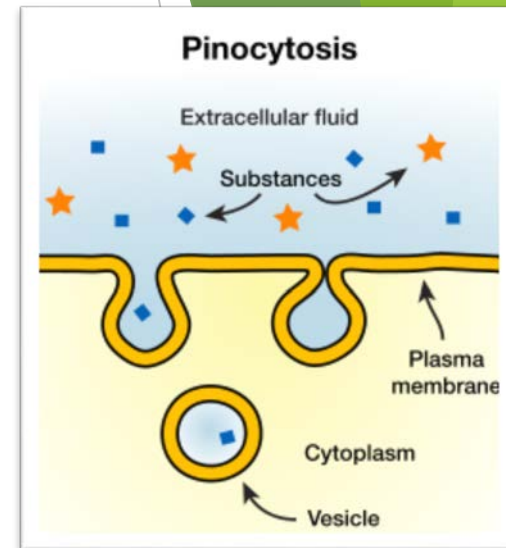
- ▶ Az aquaporin-ok képezik a sejtek „vízveték rendszerét”
  - ▶ (Peter Agre, 2003, Nobel-díj a felfedezésért)
- ▶ Az aquaporin-ok transzmembrán, pórus-képző fehérjék, vízcsatornák
- ▶ Fő funkciójuk víz visszaszívás a vesékben ADH-függően
  - ▶ Szelektíven csak vízmolekulákat engednek át, ionokat és más oldott anyagokat nem.
- ▶ Az aquaporin-okon keresztüli diffúzió valószínűleg gázok transzportjában fontos, mint pl. szén-dioxid, de a pórusok mérete túl kicsi (csak 0,4 nm) ahhoz, hogy a legtöbb gyógyszermolekulát (amelyek átmérője általában nagyobb, mint 1 nm) átengedje
- ▶ Az aquaporin-okat higany tartalmú vegyületek gátolják (mint a *para-klór-merkurobenzén szulfonát*)



# IV. Pinocitózis

## (pino = inni)

- ▶ A pinocytosis („folyadék-endocitózis”) során a sejtmembrán betüremkedik így egy olyan vezikula jön létre amely extracelluláris összetevőket tartalmaz
- ▶ A vezikula tartalma felszabadulhat a sejten belül, vagy a másik oldalon kiválasztódhat
- ▶ Ez a mechanizmus makromolekulák transzportjához fontos (pl. inzulin ezzel a folyamattal jut át a vér-agy gáton),
- ▶ de kis molekulák számára, mint a hagyományos gyógyszerek, nem
- ▶ A folyamat energiaigényes (ATP).
- ▶ Ez a folyamat ritka.





# Belső használatra szánt osztatlan porok

# Porok (ismétlés)

- ▶ Def.(FoNoVII):  
A porok (pulveres) bevitelre vagy külső használatra szánt osztatlan vagy adagokra osztott, szilárd, por alakú gyógyszerkészítmények.
- ▶ Egyszerű porok: a gyógyszeranyagból porítással kapott készítmények.
- ▶ Porkeverékek: egyszerű poroknak egymással, esetleg kis mennyiségű folyadékokkal készült keverékei.
- ▶ A porok felhasználásuk szerint lehetnek:
  - ▶ Külső használatra szánt porok (lásd 3. szeminárium)
  - ▶ Belső használatra szánt porok
    - ▶ Utóbbiak adagolásuk szerint lehetnek:
      - ▶ Osztatlan porok (lásd itt)
      - ▶ Osztott porok (lásd 9. szeminárium)

# A VIII. Magyar Gyógyszerkönyv a porokat tagoltan tárgyalja.

- ▶ Bevételekre szánt orális porok: olyan gyógyszerkészítmények, amelyek különböző méretű, szilárd, laza eloszlású, száraz részecskékből állnak.
- ▶ Egy vagy több hatóanyagot tartalmaznak, segédanyagokkal vagy azok nélkül, továbbá szükség esetén tartalmaznak az illetékes hatóság által engedélyezett színezékeket, valamint íz javító anyagokat is.
- ▶ Közvetlen lenyelésre vagy vízzel való bevételekre ajánlottak. Lehetnek egy vagy több adagos készítmények.
- ▶ A PhHg VIII megkülönbözteti még ezen kívül a következőket: **Pezsgőporok; Dermális porok;** Porok injekciókhoz, infúziókhoz; Inhalációs porok; Porok rektális alkalmazásra (feloldva/diszpergálva)

# Belső használatra szánt osztatlan porok

- ▶ Osztatlan por két keresztes szert nem tartalmazhat, mert a beteg egy tartályban kapja meg a homogenizált porkeveréket és az adagolást maga végzi!
- ▶ Egy keresztes szert is csak abban az esetben tartalmazhat ha a porkeverék erős hatású szer-tartalma összesen nem haladja meg a napi maximális adagot!

# Kötelelzően tudandó receptek a témából

Osztatlan porok

# Osztatlan porok

- ▶ Keserűsítő rendelése hashajtóként (osztatlan)
- ▶ Antacidumokat tartalmazó osztatlan porkeverék

# Keserűső rendelése hashajtóként (osztatlan)

Keserűső?

Magnézium-szulfát



► Magnesii sulfas  
heptahydricus

► 100 g

Rp./

Magnesii sulfatis heptahydrici  
grammata centum (g 100,0)

Misce fiat pulvis

Detur ad scatulam

Signetur: Hashajtó. 5-10 gramm  
port 2 dl vízben elkavarva bevenni.

# Antacidumokat tartalmazó osztatlan porkeverék

- ▶ Aluminium-hidroxid
- ▶ Magnézium-oxid  
↓
- ▶ Aluminii oxydum  
hydricum
  - ▶ 40 g
- ▶ Magnesii oxydum leve
  - ▶ 10 g

Rp./

Aluminii oxydi hydrici  
grammata quadraginta (g 40,0)

Magnesii oxydi levis  
grammata decem (g 10,0)

Misce fiat pulvis

Detur ad scatulam

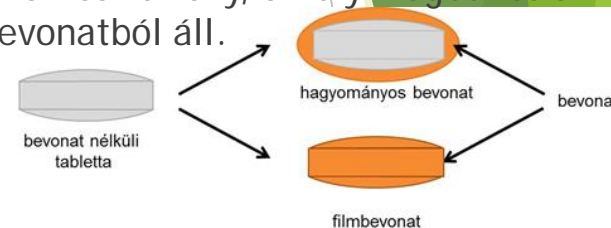
Signetur: Fél teáskanálnyi port  
vízben elkeverve evés előtt bevenni.



# Tabletták

# FOGALMAK (PhHg VII szerint)

- ▶ A tabletta (*tabletta*) préseléssel előállított, meghatározott mennyiségű hatóanyagot tartalmazó, adagolt, szilárd gyógyszerkészítmény. Alakjuk rendszerint lapos vagy többé-kevésbé domború, korong alakú, ritkábban szögletes vagy ovális.
- ▶ A bevont tabletta, köztük a drazsé (*dragee*) is, bevételre szánt, meghatározott mennyiségű hatóanyagot tartalmazó, általában lencse alakú, szilárd gyógyszerkészítmény, amely magból és az ezt burkoló hézagmentes cukor-, intesztinoszolvens vagy filmbevonatból áll.



- ▶ A kapszula (*capsula*) főként bevételre és lenyelésre, egyes esetekben rektális vagy vaginális alkalmazásra szánt és meghatározott mennyiségű szilárd vagy folyékony gyógyszert tartalmazó adagolt gyógyszerkészítmény. Lehet lágy- vagy kemény zselatin kapszula.



bliszter



# Ph.Hg. VIII.:

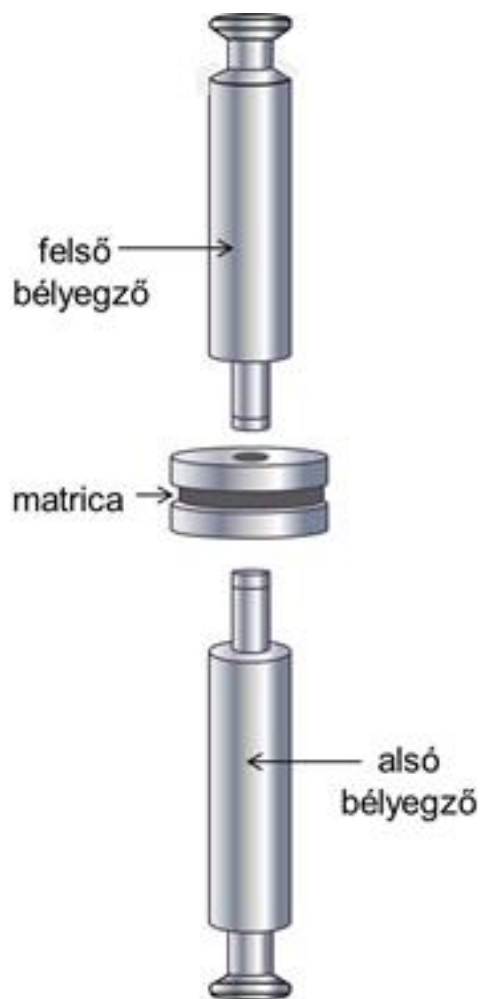
- ▶ Def.: A tabletták egy vagy több hatóanyag egyszeri dózisát tartalmazó, szilárd, bevételre szánt gyógyszerkészítmények, melyek rendszerint azonos térfogatú szemcsemennyiség préselésével állítanak elő.
- ▶ Többségüket egészben, másokat elrágás után kell lenyelni, vannak olyan tabletták is, amelyeket bevétel előtt vízben fel kell oldani vagy diszpergálni kell, bizonyos fajtákat pedig a szájban kell tartani, hogy hatóanyaguk itt szabaduljon fel.
- ▶ A préselésre szánt szemcsék egy vagy több hatóanyagot tartalmaznak, segédanyagokkal vagy azok nélkül. A segédanyagok lehetnek: töltő- és kötőanyagok, szétesést elősegítő anyagok, csúsztató és síkosító anyagok, olyan anyagok, amelyek módosítják a készítmény viselkedését az emésztőcsatornában, lehetnek ezenkívül az illetékes hatóság által engedélyezett színezékek, továbbá ízjavítók is.
- ▶ A tabletták rendszerint korong alakú, szilárd készítmények; felszínük lehet sík vagy domború, éleik pedig olykor letompítottak. Felületükön esetenként vonalak, törési bemetszések, szimbólumok vagy egyéb jelzések láthatók. A tablettákon bevonat is lehet.

# Ph.Hg. VIII. (folyt.):

Az orális tabletták több csoportra oszthatók:

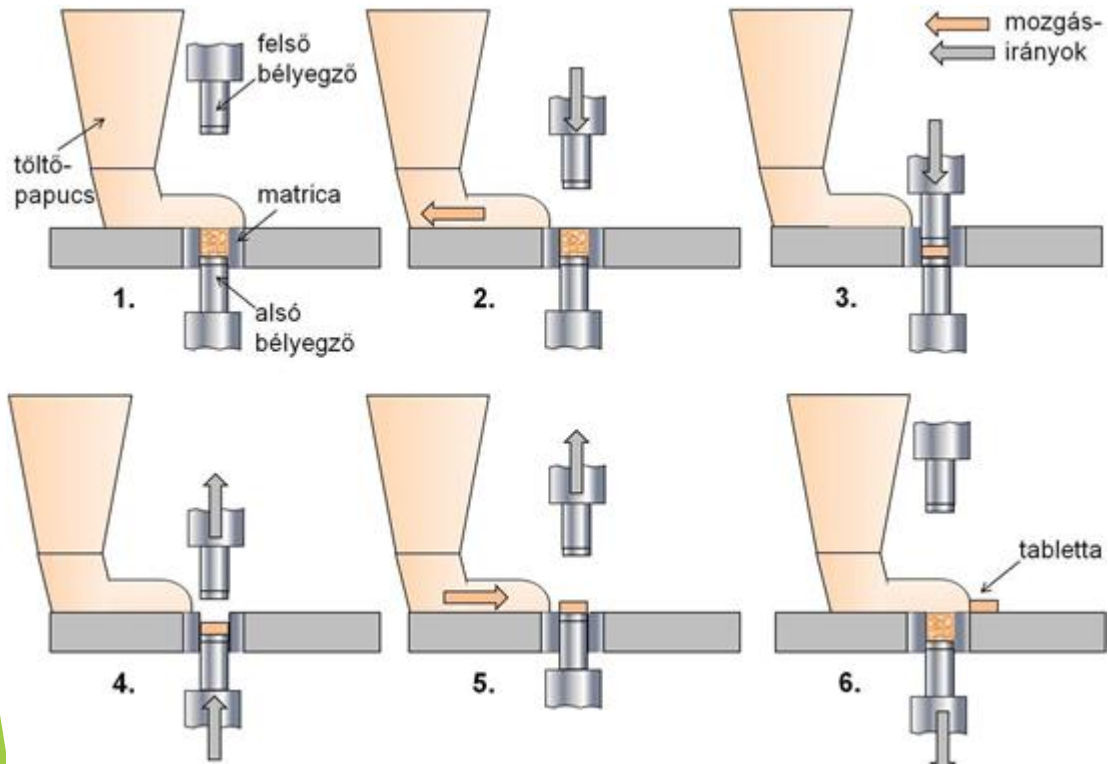
- ▶ bevonat nélküli tabletták
- ▶ bevont tabletták
- ▶ pezsgőtabletták
- ▶ oldódó tabletták
- ▶ diszpergálható tabletták
- ▶ szájban diszpergálható tabletták
- ▶ gyomornedv-ellenálló tabletták
- ▶ módosított hatóanyagleadású tabletták
- ▶ szájüregben alkalmazott tabletták

# Tablettázás



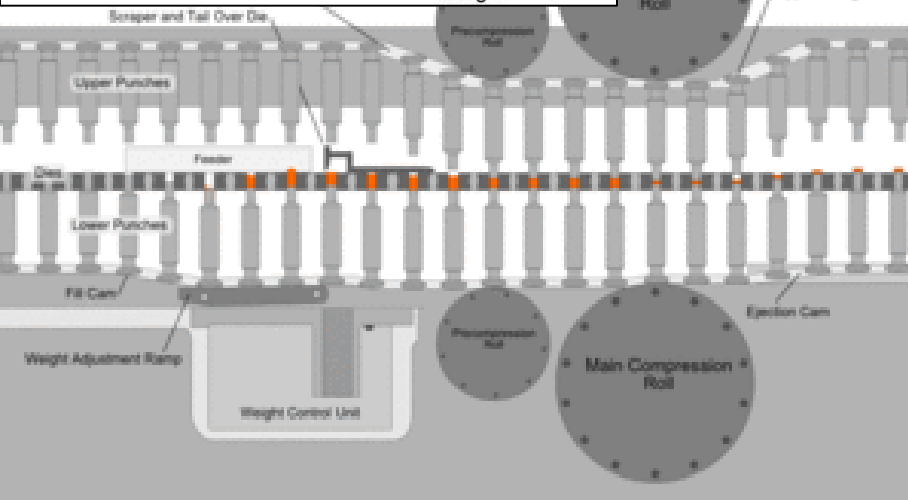
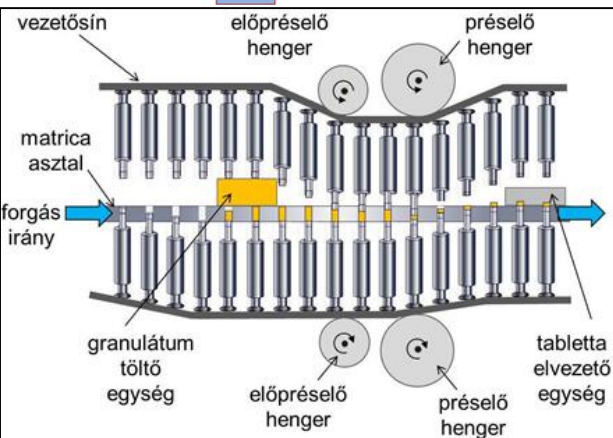
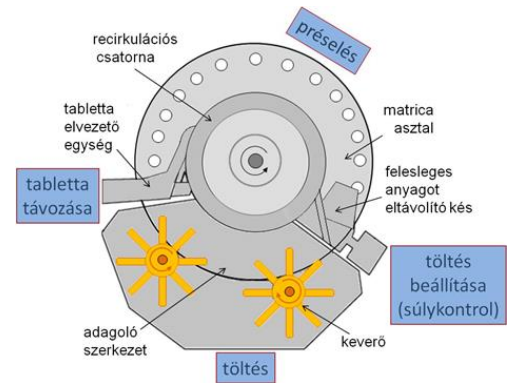
	felülnézet	előlnézet	oldalnézet
kerek, lapos, plánpárhuzamos (bipán)			
kerek, lapos, ferde élű (fazettás)			
kerek, kétszer domború (bikonvex)			
ovális, bikonvex			
oblong, bikonvex			
lekerekített, hengeres (kapszula forma)			

# Excenteres tablettázó gép





# Rotációs tablettázó gép



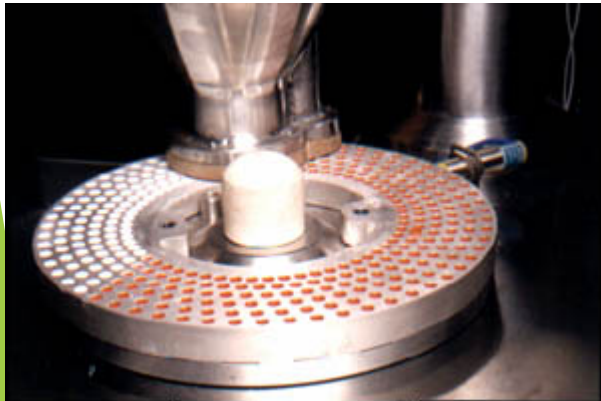
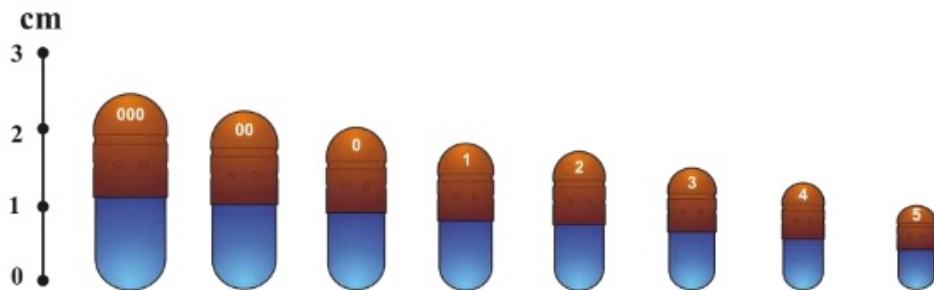
# Kemény zselatin kapszulák

## HARD GELATIN CAPSULES

Also referred to as “DFC” **D**ry **F**illed **C**apsule.

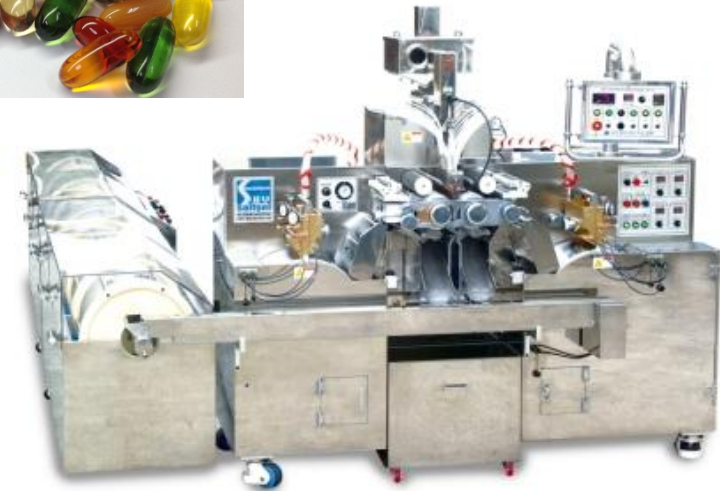
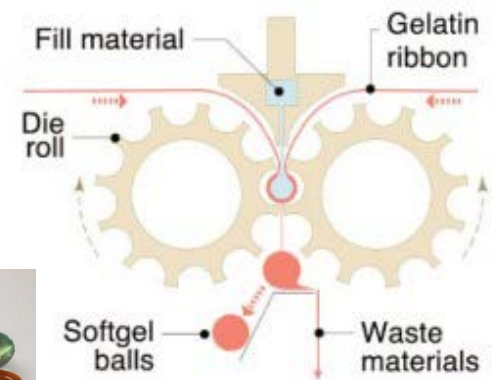
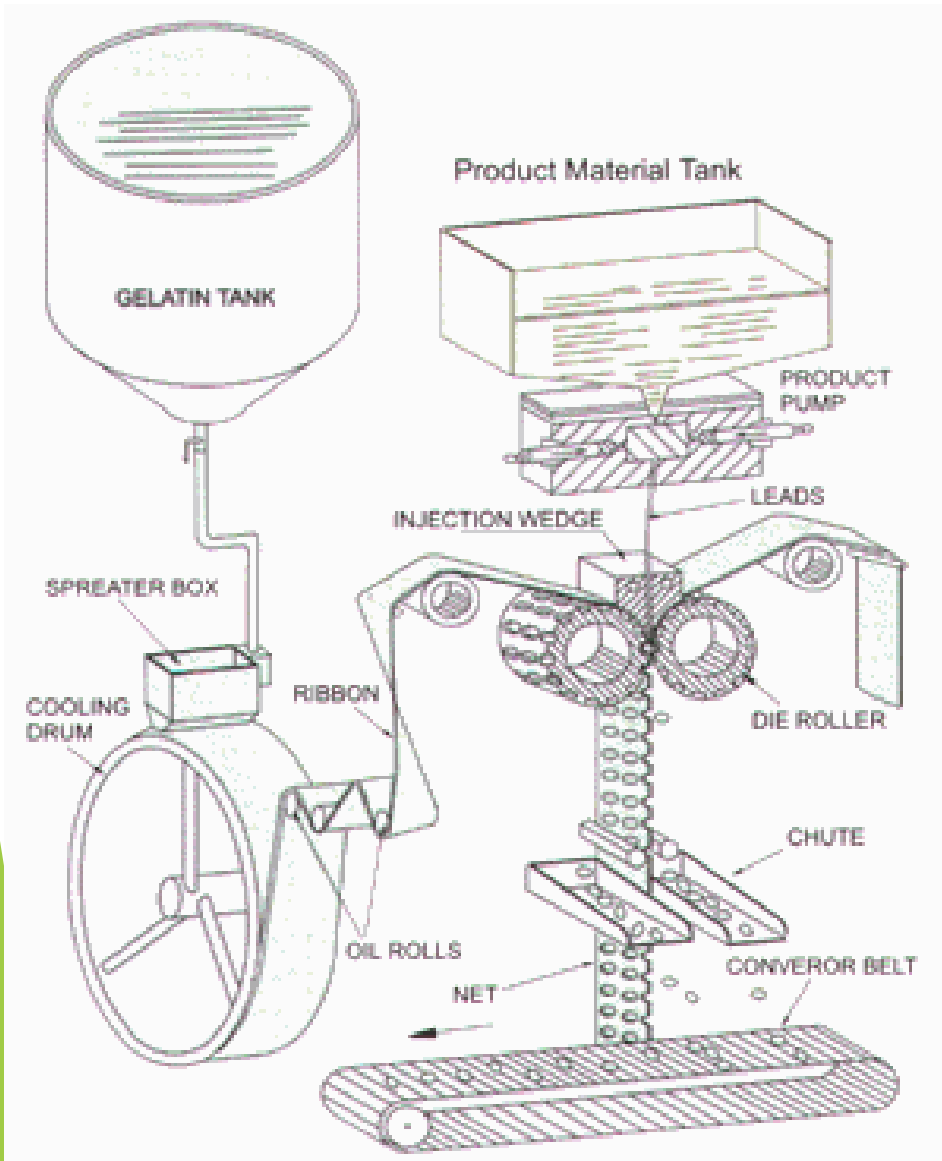
### CAPSULE SIZES

For human use, empty capsules ranging in size from **000** (the largest) to **5** (the smallest) are commercially available.





# Lágy zselatin kapszulák



Kötelelzően  
tudandó receptek a  
témából

# *Hisztamin (H2) receptor antagonistá peptikus fekélybetegség kezelésére*

Pl.: Famotidin



Pl.: Quamatel

Rp./

Tablettarum Quamatel 20 mg  
scatulas originales No. III (tres)

D.S.: Naponta 2x1 tablettát  
bevenni

Ekkor 2(!) doboz Quamatel 20mg 28x  
kerül expediálásra

(Kiszerelése: 20mg 28x, 20mg 60x,  
40mg 14x, 40mg 30x)

# Akut anginás rohamban alkalmazható nitrátkészítmény (TABLETTA)

► nitroglicerín



► Nitromint

Rp./

Tablettarum Nitromint 0,5mg 50x

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Szükség esetén 1 tablettát nyelv  
alá helyezni!

A hatás kb. 1-2 percen belül jelentkezik és  
30-45 percig tart. 5 perc múlva  
ismételhető (max 3 tabl)

(kiszerezései:

0,5mg 50x; 2,6mg 60x retard (ez akutan  
nem jó))

# *Akut anginás rohamban alkalmazható nitrátkészítmény (SPRAY)*

► nitroglicerín



► Nitromint

Rp./

Aerosoli Nitromint 8 mg/g

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Szükség esetén 1 puff  
nyelv alá!

A hatás kb. 1-1,5 percen belül  
jelentkezik. 5 perc múlva ismételhető  
(max 3 puff)

Manapság már mind a tablettá, mind a spray vény nélkül kiadható!

# *A renin-angiotenzin rendszerre ható, hipertónia kezelésére alkalmas készítmény (AKUT)*

Pl.: captopril



Pl.: Tensiomin

Rp./

Tablettarum Tensiomin 25mg  
scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Szükség esetén 1 tablettát  
szétrágni.

Ekkor: Tensiomin 25 mg 30x kerül  
expediálásra

(kiszerezései: 12,5mg 30x; 12,5mg  
90x; 25mg 30x; 25mg 90x; 50mg 90x)

# *A renin-angiotenzin rendszerre ható, hipertónia kezelésére alkalmas készítmény (KRÓNIKUS)*

Pl.: perindopril



Pl.: Coverex

Rp./

Tablettarum Coverex

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Naponta 1x1 tablettát bevenni

Ekkor Coverex-AS 5mg 30x-et fognak  
kiadni

(kiszerezései: 5mg 30x, 10mg 30x)

# *Protonpumpa-gátló szer peptikus fekélybetegség kezelésére*

Pl.: Pantoprazol



Pl.: Controloc

Rp./

Tablettarum Controloc 20 mg  
scatulas originales No. II (duas)

D.S.: Naponta 1 tableta

Ekkor 2 doboz Controloc 20mg 14x kerül  
expediálásra. Ha kéthavit akar, akkor  
kell a: 28x és a „56 napra ellátva” is.

(Kiszerelések: 20mg 14x, 20mg 28x,  
40mg 14x, 40mg 28x)



# *Béta-receptor gátló tablettá*

Pl.: bisoprolol



Pl.: Concor

Rp./

Tablettarum Concor

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Naponta 1x1/2 tablettát bevenni.

Ekkor 1 doboz Concor 5mg 30x-os kerül  
expediálásra (mert nincs kisebb)  
De hivatalosan rá kell írni, hogy:  
Ellátva 60 napra.

(Kiszerelések: 5mg 30x; 5mg 60x; 10mg  
30x; 10mg 60x)

# *Hypertonia kezelésére használható, szelektív $\alpha_1$ receptor blokkoló tabletta*

- ▶ Pl. prazosin  
↓
- ▶ Pl. Minipress

Rp./

Tablettarum Minipress 2mg 30x  
scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Naponta 1 tabletta

(Kiszerelések: 1mg 30x, 2mg 30x)

# *Ca csatorna blokkoló antiaritmiás szer*

► Pl. verapamil



► Pl. Verapamil

Rp./

Tablettarum Verapamil 40mg 50x  
scatulas originales No. II (duas)

D.S.: Naponta 3x1 tablettá

Általában kiadják a két dobozt, de  
hivatalosan rá kell írni, hogy:  
33 napra ellátva

(Kiszerelések: 40 mg 50x; 80mg 50x;  
de létezik retard változat 120-180-  
240mg-os más néven (pl. Chinopamil))

# *Hipertónia kezelésére használható, Ca-csatorna blokkoló tablettá*

► Pl. amlodipin



► Pl. Tenox

Rp./

Tablettarum Tenox 10mg 30x

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Naponta 1 tablettá

(Kiszerezései: 5mg 30x; 10mg 30x)

# Kálium megtartó diuretikum

► Pl. spironolakton

↓

► Pl. Verospiron

Rp./

Tablettarum Verospiron

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Naponta 1 tabletta

(Kiszerezései:

25mg 20x; 50mg 30x; 100mg 30x;)

# *Hiperkoleszterinémia kezelésére alkalmas tabletta*

▶ Pl. atorvastatin      Rp./

↓

▶ Pl. Atoris

Tablettarum Atoris 30mg 30x

scatulam originalem No. I (unam)

D.S.: Naponta 1 tabletta

(Kiszerelései: 10mg 30x; 20mg 30x;  
30mg 30x; 40mg 30x; 60mg 30x)