Жаңа дәрілік формаларды алудың биофармацевтикалық негіздері

3-дәріс



дәріскер: доцент К.Б. Бажықова

Биофармация дәрі-дәрмек технологиясының теориялық негізі ретінде

Биофармация → **Дәрілік формалар технологиясының теориялық негіздері**



Биофармация → Дәрілік заттардың ағзаға терапевтік әсерінің әртүрлі өзгермелі факторларға тәуелділігін зерттейтін ғылым

Дәрілік препараттың биологиялық әсерін келесідей тәуелділікте зерттейтін ғылыми бағыт

1. физика-химиялық қасиеті,
2. дәрілік форма,
3. Дайындау технологиясы
4. Кейбір басқа факторлар

Дәрілік препараттардағы белсенді және қосалқы заттардың физикалық және физика-химиялық қасиеттерінің, әртүрлі дәрілік нысандарда бірдей дозада олардың емдік әсеріне әсерін зерттейді



Биофармацияның мақсаты жаңа дәрілік препараттарды құрудың теориялық және эксперименттік негіздемесі және олардың терапиялық әсерін арттыру және ағзаға жанама әсерін азайту ескеріле отырып, қолданыстағы препараттарды жетілдіру болып табылады

Biopharmaceutics is the study of the physical and chemical properties of a drug, and its dosage form, as related to the onset, duration and intensity of drug action, including coconstituents and mode of manufacture.

Farlex Partner Medical Dictionary © Farlex 2012

Қазіргі биофармацияны дамытудың негізгі бағыттары :

- Биофармацевтикалық скринингтің эксперименттік-теориялық негіздерін әзірлеу;
- Фармацевтикалық және басқа да айнымалы факторлардың дәрілік нысандардан дәрілік заттарды шығару және сіңіру процестеріне әсерін зерттеу;
- Дәрілік заттардың қосылысын және препараттарды енгізу тәсілдерін оңтайландыру үшін дәрілік препараттардың фармакокинетикасын зерттеу;
- Дайын дәрілік форманың компоненттері әртүрлі жасушалардың мембраналарының ақуыздарымен және липидтерімен әрекеттескенде болатын биофармацевтикалық процестердің механизмдерін зерттеу;
- Адам мен жануарлардың биологиялық сұйықтықтарындағы фармакологиялық белсенді субстанцияларды талдаудың жоғары сезімтал және селективті әдістерін әзірлеу;
- Жаңа биожетімділік модуляторларын табу;
- Берілген биофармацевтикалық қасиеттері бар жаңа дәрілік формаларды құру, олар белсенді заттардың оңтайлы биожетімділігін қамтамасыз етуі тиіс;
- Дәрілік заттардың биоэквиваленттілігін зерттеу.

Дәрілік препараттардың сапасын бағалауға қойылатын заманауи талаптар

ДП жоғары белсенділікке селективтілікке және дәрілік әсердің ұзақтығына ие болуы керек. Ол сондай-ақ зиянсыз болуы керек және жағымсыз жанама әсерлер тудырмауы керек. ДП құрамында таза компоненттер болуы керек және сақтау кезінде жеткілікті тұрақты болуы керек. Сонымен қатар, кейбір экономикалық талаптар бар - ДП қол жетімді болуы керек, ал шығындар мен мүмкін бағаның арақатынасы фармацевтикалық нарықта ДП сатудан айтарлықтай жоғары пайда әкеледі.



Осы факторлардың барлығы осы препараттың өмір сүру ұзақтығын басқа ДП арасында анықтайды, ұқсас әсерге ие және халықаралық медициналық практикада қолданылады.

ДЗ химиялық модификациясы (тұз, қышқыл, эфир байланыстары, кешендік қосылыстар)

ДЗ физика-химиялық қасиеттері , күйі, полиморфты формасы(кристалл формасы, өлшемі, заряды, эфир байланыстары, кешендік қосылыстар)

Көмекші заттар, табиғаты, мөлшері

ДФ түрі және енгізу жолы

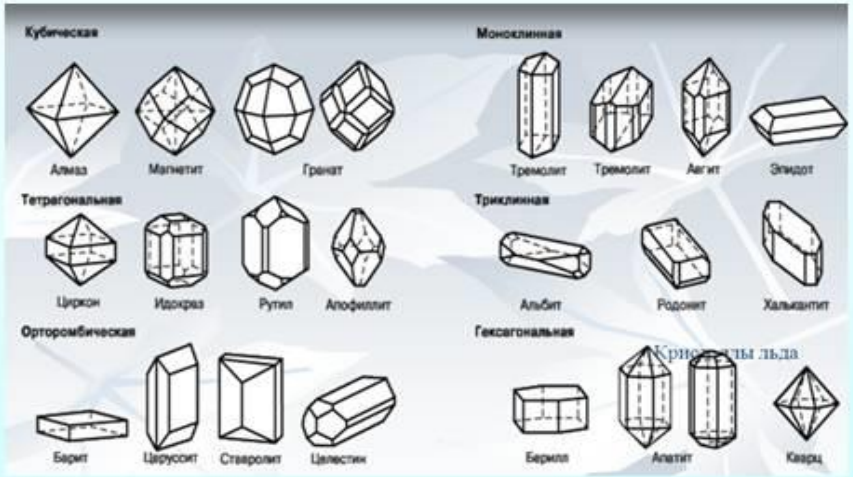
ДФ алудың фармацевтикалық технологиясы

Фармацевтикалық факторлар

Бұл факторлар фармацевтикалық дайындауды анықтайды

Значение физико-химических свойств и физического состояния фармацевтических субстанций:

- **Полиморфизм**



- **Химическое состояние**

алкалоид хинин (основание) → сульфат, хлорид, бромид (соли)

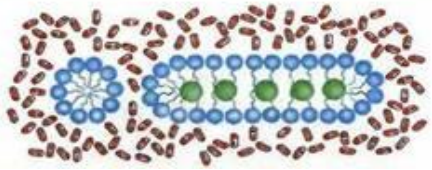
Растворимость: 1 : 800, 1 : 34, 1 : 16

- **Дисперсность**

сыпучесть порошкообразных материалов
насыпную массу
точность дозирования



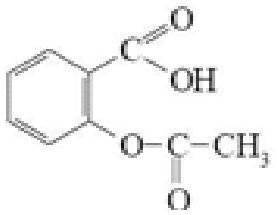
- **Солюбилизация**



Ұнтақтау дәрежесі- бұл фактор ұнтақтар, суспензиялар, суспензия майлары, суппозиторийлер, таблеткалар, ұнтақ құрамы бар желатинді капсулалар сияқты дәрілік формалардағы еритін заттар үшін ерекше маңызды. Дәрілік заттың ұсақ ұнтақтарын қолданған кезде емдік әсерге аз мөлшерде қол жеткізіледі.

Ацетилсалицил қышқылы



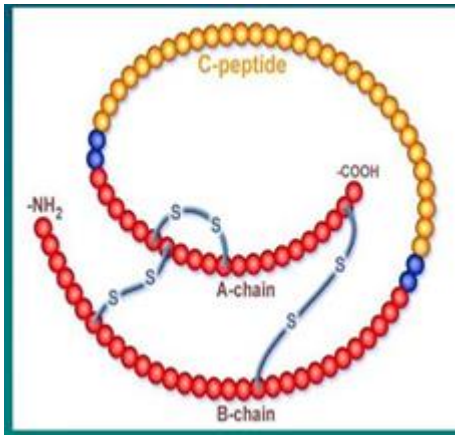


Ацетилсалицил қышқылы бөлшектерінің мөлшері 30 есе азайған кезде анальгетикалық белсенділік екі есе артады.

Анальгетикалық, ыстықты қайтаратын, қабынуға қарсы әсері бар

Физикалық құрылымы және ерігіштігі

Инсулин (лат. *insulinum insula* — арал) — эндокринді эпителиоциттерден құралған ұйқы безі аралшықтарының бета-жасушалары (В- инсулоциттері) бөліп, қанға шығаратын гормон. Қандағы глюкозаның мөлшерін азайтып, оны адам мен жануарлар бауыры мен бұлшықеттерінде қорланатын күрделі көмірсу — гликогенге айналдырады. Инсулин жетіспеушілігі қант диабетін тудырады. Инсулинді табиғи жолмен сиырдың ұйқы безінен алынады.



Инсулиннің кристалды түрінің әсер ету ұзақтығы 36 сағат,

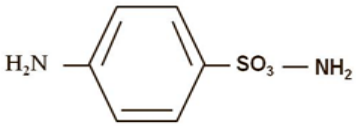
- аморфты-12-16 сағат.

Кристалдар формасы

Стрептоцид пластиналар, үлкен ұзартылған призмалар, ине тәрізді кристалдар түрінде болуы мүмкін. Призмалар түрінде ұзартылған форма ең айқын терапиялық әсерге ие екендігі анықталды.

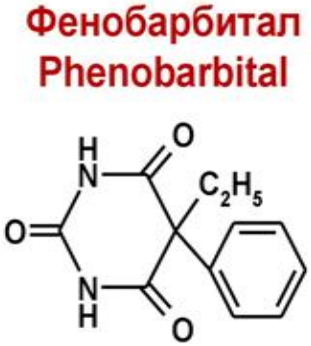
Стрептоцид

п-аминбензой қышқылы



Ангина, цистит, инфекциялық жара кезінде микробқа қарсы қолданылады

Полиморфизм



Заттың әртүрлі полиморфты формаларынан алынған фенобарбитал таблеткаларының еру жылдамдығында айтарлықтай айырмашылық бар. Аспирин I және II 2 модификацияда бар. I форма II-ге қарағанда 1,5 есе тез сіңеді.

5-этил-5-фенилбарбитал қышқылы

Ақ түсті ұнтақ, суда нашар ериді, спиртте және сілті ерітіндісінде жақсы еруі, оның имид-имидолды өзгерістен болатын қышқылдық қасиеттерімен түсіндіріледі.

Биоэквиваленттілікті бағалау бойынша салыстырмалы фармакокинетикалық зерттеулер

Дені сау еріктілерге арналған клиникалық зерттеулер



GCP

Биоаналитикалық бағалау



GLP

Статистикалық талдау



GSP

Жалпы дәрілік заттардың биоэквиваленттілігін бағалау бойынша зерттеу есебі