ҚАЗАҚСТАН РЕСПУБЛИКАСЫНЫҢ БІЛІМ ЖӘНЕ ҒЫЛЫМ МИНИСТІРЛІГІ
ӘЛ-ФАРАБИ АТЫНДАҒЫ ҚАЗАҚ ҰЛТТЫҚ УНИВЕРСИТЕТІ

Дәрілік қалыптардан белсенді фармацевтикалық ингредиенттердің босап шығу және еру кинетикасы.

Химия және химиялық технология факультеті, Физикалық химия, катализ және мұнайхимия кафедрасының оқытушысы

PhD Савденбекова Б.Е.

Алматы, 2026

Дәрістің мақсаты: Студенттерге дәрілік қалыптан белсенді фармацевтикалық ингредиенттің босап шығу механизмін, еру процесін, босап шығу кинетикасын эксперименттік анықтау әдістерін және алынған мәліметтерді математикалық өңдеуді түсіндіру.

Бақылау сұрақтары

1. Дәрілік қалыптан белсенді фармацевтикалық ингредиенттердің босап шығу және еру процестерін түсіндіріңіз. Босап шығу мен еру ұғымдарының айырмашылығын сипаттап, олардың өзара байланысын көрсетіңіз.
2. БФИ-дің босап шығуын спектрофотометриялық әдіспен анықтау кезеңдерін сипаттаңыз. Калибрлеу графигінің мақсатын түсіндіріп, абсорбция мәні бойынша БФИ концентрациясын анықтау принципін көрсетіңіз.
3. Кумулятивті босап шығу ұғымын түсіндіріңіз. БФИ-дің белгілі уақыттағы мөлшері мен бастапқы мөлшері арқылы кумулятивті босап шығу пайызын есептеу формуласын көрсетіңіз және оның физикалық мағынасын түсіндіріңіз.
4. Burst release және бақыланатын босап шығу процестерін салыстырыңыз. Олардың босап шығу профиліндегі айырмашылығын сипаттап, burst release пайда болу себептерін және дәрілік қалыптың қасиеттеріне әсерін түсіндіріңіз.

Жоспар

- Дәрілік қалыптан белсенді фармацевтикалық ингредиенттің босап шығуы туралы жалпы түсінік.
Дәрілік заттардың еру процесі және оған әсер ететін факторлар.
Дәрілік қалыптан белсенді ингредиенттің босап шығу механизмдері: диффузия, матрицаның ісінуі, эрозия және ыдырау.
Дәрілік заттардың еру және босап шығу кинетикасының негізгі модельдері.
Босап шығу кинетикасын эксперименттік анықтау әдістері.
Босап шығу процесін зерттеуде қолданылатын аналитикалық әдістер.
Эксперименттік мәліметтерді математикалық өңдеу және кинетикалық модельдерге сәйкестендіру.
Босап шығу кинетикасының фармацевтикалық маңызы және дәрілік қалыптарды әзірлеудегі рөлі.

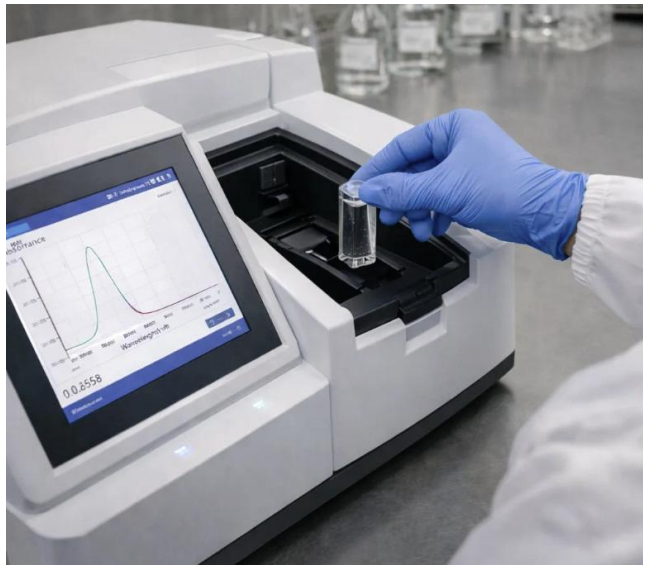
Дәрілік қалыптан белсенді фармацевтикалық ингредиенттің босап шығуы

1. Негізгі түсініктер

Дәрілік заттың босап шығуы (*drug release*) – дәрілік қалып құрамындағы белсенді фармацевтикалық ингредиенттің қоршаған ортаға немесе еріту ортасына өту процесі.

Еру (*dissolution*) – қатты күйдегі дәрілік заттың сұйық ортада молекулалық немесе иондық деңгейде таралып, ерітінді түзу процесі.

Босап шығу және еру – өзара байланысты, бірақ бірдей емес процестер. Босап шығу дәрілік қалыптан белсенді заттың бөлінуін сипаттаса, еру қатты заттың ерітіндіге өтуін сипаттайды.



Дәрілік заттың босап шығу кезеңдері

1. Дәрілік қалыптың еріту ортасымен жанасуы

Сұйықтық дәрілік қалыптың бетіне өтеді

↓

2. Ылғалдану және ісіну

Полимер немесе қосымша заттар суды сіңіреді

↓

3. Белсенді ингредиенттің босап шығуы

Диффузия, матрицаның эрозиясы немесе еру арқылы

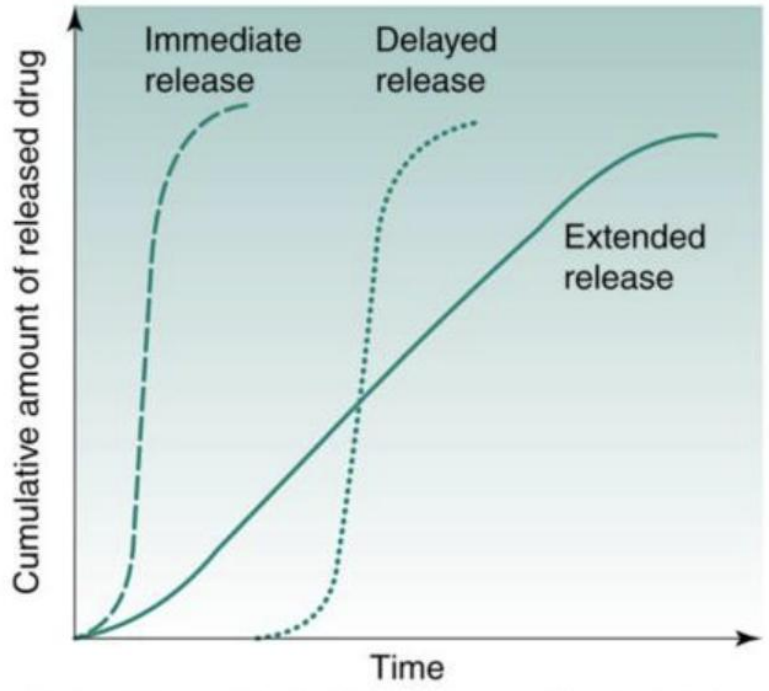
↓

4. Еріту ортасында таралуы

Белсенді зат ерітіндіге өтеді

Дәрілік қалыптардың негізгі түрлері

- Жедел босап шығатын дәрілік қалыптар (immediate release).
- Баяу босап шығатын дәрілік қалыптар (sustained release).
- Ұзартылған босап шығатын дәрілік қалыптар (extended release).
- Бақыланатын босап шығатын дәрілік қалыптар (controlled release).
- Ішекте еритін қабықшамен қапталған дәрілік қалыптар (enteric-coate





Immediate-Release Tablets

Rapid disintegration and drug release.
Quick onset of action



Extended-Release Tablet

Release the drug over an extended period
Reduces dosing frequency



Enteric-Coated Tablet

Coating protects the drug from stomach acid. Releases in the small intentine



Orally Disintegrating Tablet

Disintegrates in the mouth without water
Good for patients with difficulty swallowing



Delayed-Release Tablet

Releases the drug after a specific delay
Targets drug release at specific times or site

Дәрілік заттардың еру процесі және оның заңдылықтары

1. Еру процесінің мәні

Еру кезінде еріткіш молекулалары қатты заттың бетімен әрекеттесіп, оның бөлшектерін ерітіндіге өткізеді. Еру жылдамдығы дәрілік заттың физика-химиялық қасиеттеріне және еріту ортасының жағдайларына тәуелді.

2. Нойес–Уитни теңдеуі

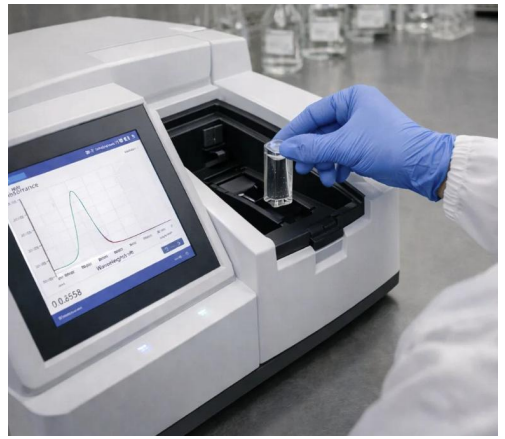
Қатты дәрілік заттың еру жылдамдығы Нойес–Уитни теңдеуімен сипатталады:

$$\frac{dM}{dt} = \frac{DA}{h}(C_s - C)$$

Теңдеудің физикалық мағынасы: заттың еру жылдамдығы оның беткі ауданы мен диффузия коэффициенті артқан сайын жоғарылайды, ал диффузиялық қабат қалыңдаған сайын төмендейді.

Мұндағы:

- dM/dt – еру жылдамдығы;
- D – диффузия коэффициенті;
- A – қатты заттың беткі ауданы;
- h – диффузиялық қабаттың қалыңдығы;
- C_s – қаныққан ерітіндідегі зат концентрациясы;
- C – ерітіндінің ағымдағы концентрациясы.

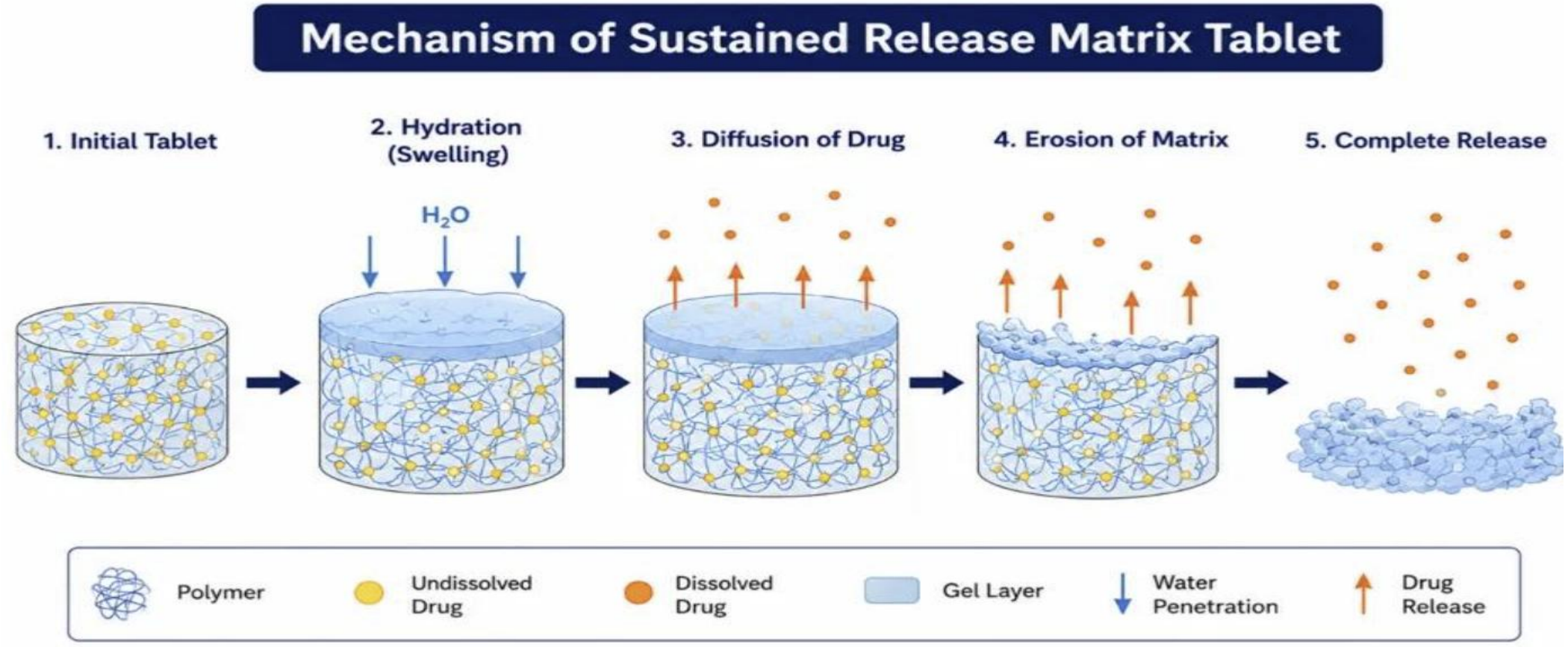


Дәрілік қалыптан белсенді ингредиенттің босап шығу механизмдері

Босап шығу механизмі дәрілік қалыптың құрамына, полимердің табиғатына, құрылымына және еріту ортасының қасиеттеріне тәуелді.

1. Диффузиялық механизм

Белсенді ингредиент концентрация градиенті әсерінен полимерлік матрица немесе мембрана арқылы еріту ортасына өтеді.

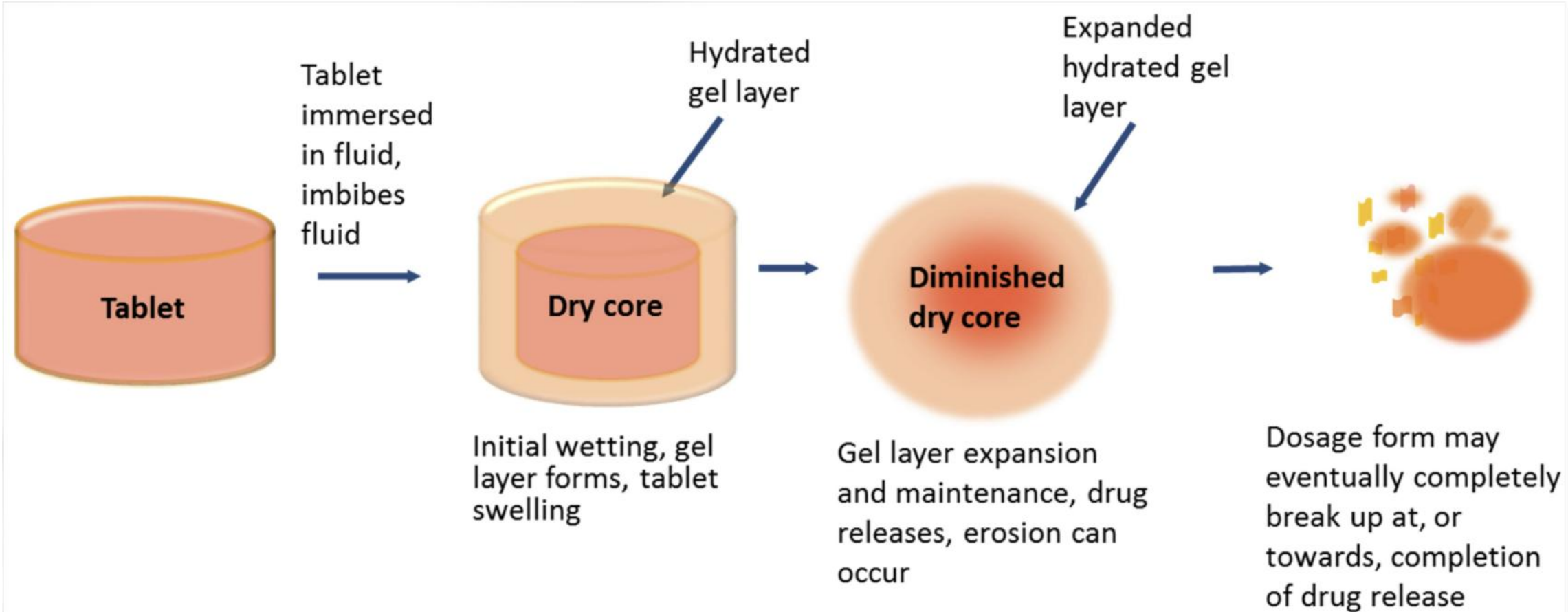


Дәрілік қалыптан белсенді ингредиенттің босап шығу механизмдері

2. Ісіну механизмі

Гидрофильді полимерлер еріту ортасымен жанасқанда суды сіңіріп, көлемі ұлғаяды. Полимерлік тордың ісінуі нәтижесінде белсенді ингредиенттің диффузиясы жүреді.

Мысалы: гидроксипропилметилцеллюлоза (HPMC) негізіндегі матрицалық таблеткалар.



Босап шығу кинетикасын эксперименттік анықтау әдістері

Дәрілік қалыптан белсенді ингредиенттің белгілі уақыт аралығында қанша мөлшерде босап шыққанын анықтау және оның кинетикалық заңдылықтарын бағалау.



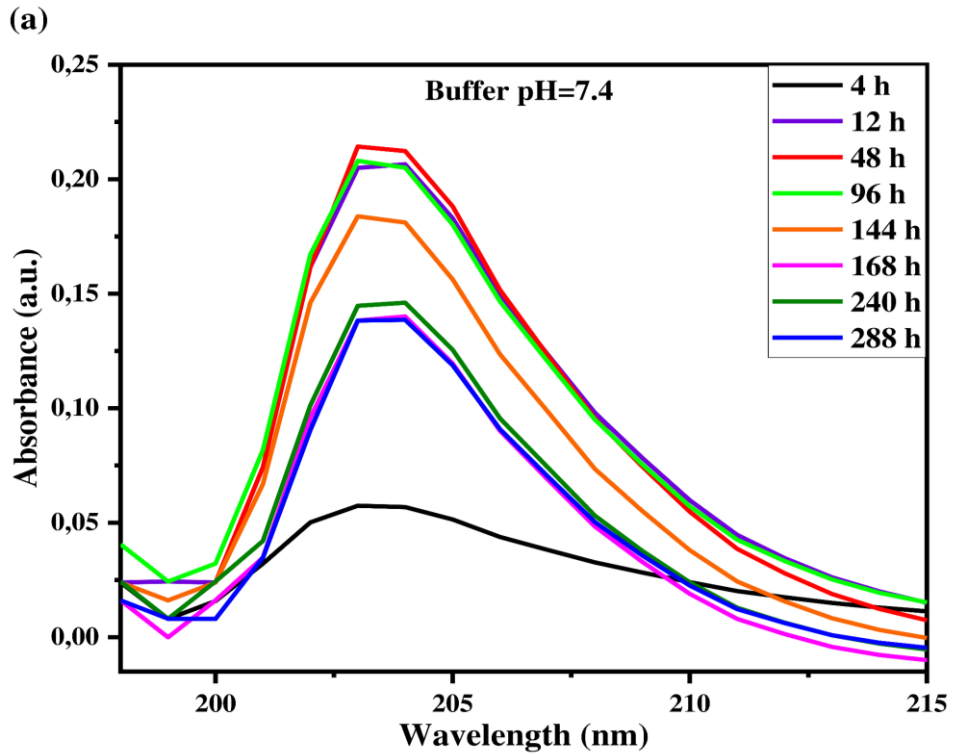




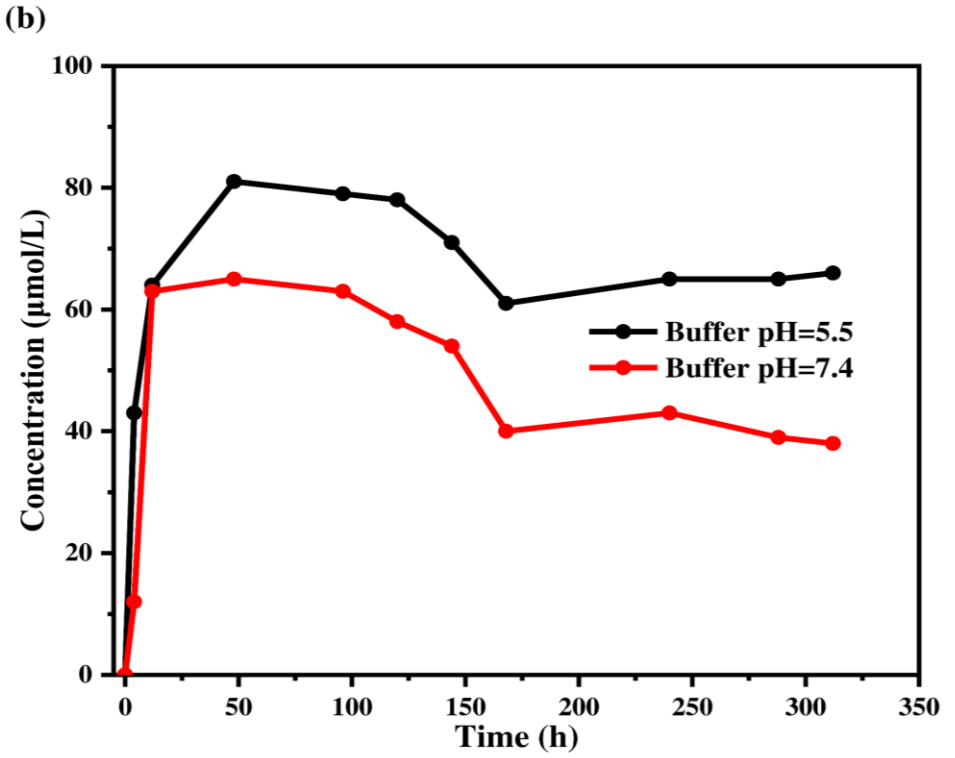
Фармакопеялық еру аппараттары

Дәрілік қалыптан белсенді фармацевтикалық ингредиенттердің босап шығуы

Калибрлеу графигі



Буфферлік ерітіндіде дәрілік қалыптан белсенді фармацевтикалық ингредиенттердің босап шығуы



Пайдаланған әдебиеттер тізімі

1. Физикалық химия (химиялық кинетика және электрохимия): оқулық / Ә.Қ. Оспанова, Г.А. Сейілханова; Әл-Фараби атын. ҚазҰУ. - Алматы : Қазақ ун-ті, 2023. - 243, [1] б. - ISBN 978-601 04-6459-9 :
2. Оспанова, Әлия Қапанқызы. Физикалық химияның теориялары мен мәселелері : оқу құралы / Ә. Қ. Оспанова, Г. Х. Шәбікова, Л. И. Сыздықова ; Әл-Фараби атын. ҚазҰУ. - Алматы : Қазақ ун-ті, 2021. - 188, [1] б. - ISBN 978-601-04-5546-7 :
3. Физикалық химия пәні бойынша есептер. (Химиялық кинетика және электрохимия) : оқулық / Г. Х. Шабікова, Ә. Қ. Оспанова, Н. С. Ашимхан ; ҚР Білім және ғылым м-гі, Әл-Фараби атын. ҚазҰУ. - Алматы : Қазақ ун-ті, 2016. - 285
4. Физикалық химия : оқулық / С.Х. Хұсайын ; ҚР Білім және ғылым м-гі, Қ.И. Сәтбаев атын. ҚазҰТУ. - Алматы : ҚазҰТУ, 2014. - 403, [1] б. : сур. - Библиогр.: 355-356 б. - ISBN 978-601-228 643-4