



I. HAFTA

TERMINOLOJİ

Biyofarmasötik

Biyofarmasötik, dozaj şekillerinin biyolojik yanıt üstündeki bütün etkileri ile, dozaj şekli içindeki etkin madde ve dozaj şeklinin kendisinin üzerindeki tüm olası fizyolojik etkenleri araştıran, tanımlayan ve incelen bilim dalıdır.

❖ Uygun biyolojik etki ařağıdaki konularda alıřmalar yapılarak elde edilebilir :

1- Etkin maddeyi tuz, ester veya kompleks řeklinde vermek.

2- Etkin maddenin fiziksel zelliklerini deęiřtirerek optimum biyolojik etki elde edilebilir. rneęin; kristal řekilleri veya partikl byklęnn kltlmesi.

Partikl boyut kldęnde, partikln yzey alanı artacaęından etkin maddenin dozaj formundan aıęa ıkıřı daha hızlı olacak ve daha absorpsiyonu artacaktır.

3- Dozaj şeklini değiştirerek.

4- Formülasyon içindeki yardımcı maddeleri ve oranlarını değiştirerek. Örneğin; dolgu maddeleri, bağlayıcı, dağıtıcı veya kaydırıcıların oranlarının değiştirilmesi, biyolojik etkide değişiklik oluşturabilir.

5- İmalat ve depolama koşullarında değişiklikler yaparak.

Biyofarmasötik terimi, ilk defa 1961 yılında John G. Wagner tarafından tanımlanmış ve kullanılmıştır.

Wagner'e göre Biyofarmasötik; hayvanlarda ve insanda izlenen biyolojik etkilerin özellikleri ve yoğunlukları arasındaki ilişkileri tanımlar ve şu hususları kapsar:

1. Etkin maddenin yapısının özelliklerini (ester, tuz, kompleks, v.b.),
2. Fiziksel durumu, partikül büyüklüğü ve yüzey alanını,
3. Etkin maddeyle beraber bulunan yardımcı maddelerin varlığını veya yokluğunu,
4. Etkin maddenin verildiği dozaj şeklinin türünü,
5. Dozaj şeklinin imalatında kullanılan farmasötik yöntemleri

Farmakokinetik

Etkin maddelerin saf ve dozaj şekilleri içinde organizmaya verilişlerinden sonra, plazma, idrar, lenf ve omurilik sıvısı gibi biyolojik sıvılarda oluşturduğu adsorpsiyon, dağılma, metabolize olma ve eliminasyon davranışlarını inceleyerek, elde edilen profilleri matematiksel denklemlerle tanımlayan bilim dalıdır.

Temel Farmakokinetik Parametreler Nelerdir?

- **Biyolojik yarı-ömür**
- **Absorpsiyon (emilim) hız sabiti**
- **Metabolizma hız sabiti**
- **Atılım (eliminasyon) hız sabiti**
- **Uzaklaşma hız sabiti**
- **Klirens**
- **Dağılım hacmi**
- **Ortalama yaşam süresi**

- **Plazma doruk konsantrasyonu (C_{\max})**
- **Plazma doruk süresi (t_{\max})**
- **Eğri altında kalan alan (AUC)**
 - $AUC_{0 \rightarrow \infty}$
 - $AUC_{0 \rightarrow n}$
- **Biyoyararlanım katsayısı**
- **Michael Menten hız sabiti (V_{\max})**
- **Michael Menten sabiti (k_m)**

- **Biyolojik yarı-ömür ($t_{1/2}$):**

Etkin maddenin yarısının organizmayı 'terk etmesi' için gereken süreye denir. Bu terk etme işlemi, metabolizmayı da kapsamaktadır; yani doğrudan uzaklaşmayla ilişkilidir. Etkin maddelerin biyolojik yarı-ömürleri birkaç dakikadan 10 güne kadar değişebilmektedir. $t_{1/2}$, plazma profilinin uzak bölgesi ve doğrusal olan, log-lineer aşamasındaki k_d üzerinden hesaplanmaktadır.

- **Absorpsiyon (emilim) hız sabiti (k_a):**

Dozaj formları organizmaya absorpsiyonun söz konusu olduğu veriliş yollarından herhangi biri ile verildiğinde, absorpsiyon hız sabiti gözlenmeye başlar. İlaçlar büyük oranda oral yoldan verildiklerinden, bu parametre oral emilim hız sabiti olarak rol oynamaktadır. Diğer absorpsiyonun rol oynadığı veriliş yolların da (rektal, transdermal, vajinal, i.M., nazal, v.b.) kendilerine özgü absorpsiyon hız sabitlerinin bulunması söz konusudur.