



7. HAFTA

BİYOYARARLANIM
ARTIRMA ÖNERİLERİ

- **Bir etkin maddenin vücuda alındıktan sonra etki gösterebilmesi için öncelikle biyolojik membranlardan absorbe olması gerekir.**
- **Özellikle mide-barsak kanalındaki lipitler, proteinler, polisakkaritlerden oluşan kompleks yapı «yarı-geçirgen bir membran» özelliğine sahip olup, bazı kimyasalların geçişine izin verirken bazılarına ise izin vermez.**

Teşhis, tedavi ve profilaktik amaçla kullanılan ilaçların uygulama yolu

- **ilacın özelliklerine (suda veya yağdaki çözünürlük, iyonizasyon gibi)**
- **Tedavi amacına (hızlı etki istenmesi, uzun dönem kullanılma ihtiyacı, sistemik veya lokal etki istenmesi gibi), göre belirlenir.**

Biyoyararlanımın artırılmasına yönelik yaklaşımların anlaşılabilmesi açısından öncelikle gastrointestinal kanaldan ilaçların absorpsiyonunu, dolayısıyla da biyoyararlanımlarını etkileyen temel faktörlerin tanımlanması gerekmektedir. Bu faktörler şu şekilde sınıflandırılabilir:

❖ Etkin maddeye ait faktörler:

1) Partikül büyüklüğü

2) Polimorfizm

3) Kristal yapı

4) Sudaki çözünürlük

5) Tuz formu

6) İyonlaşma sabiti (pKa)

7) Hidrat veya solvat formu, önilaç

8) Dağılma katsayısı

9) Difüzyon katsayısı

10) Kompleksleştirme

11) Molekül büyüklüğü

Bunlardan;

- ❖ **Partisyon katsayısı:** Hücre membranlarının fosfolipit yapısında olmaları nedeniyle yağda çözünen moleküller suda çözünenlere kıyasla çok daha hızlı bir şekilde dokulara geçerler.
- ❖ **Difüzyon katsayısı:** Herbir etkin madde için sabittir. Birim zamanda birim alandan difüze olan etkin maddenin molekül sayısıdır (cm^2/sn).

❖ **iyonizasyon derecesi:** Çoğu ilaç ya zayıf asidik ya da zayıf karakterdedir. Bu ilaçlar vücuda verildiklerinde dissosiyeye olma eğilimindedirler. Bu da bir kısım ilaç aktif iken bir kısmın inaktif olması anlamına gelir. Bu durum ilacın oluşturduğu çözeltinin pH'sına bağlıdır. Örn: zayıf asidik ilaçlar asit ortamda dissosiyeye olmazlar ve membranlardan aktif formda geçerler.

❖ **Molekül ağırlığı ve molekül**

büyüklüğü: Küçük hidrofilik moleküller GIK'dan kolaylıkla pasif olarak absorplanırlar. Molekül ağırlığı bir kaç yüze ulaşan bazı büyük polar moleküller membran komponentleri aracılığıyla aktif olarak absorplanırlar.