

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
КАФЕДРА ПРОМИСЛОВОЇ ТЕХНОЛОГІЇ ЛІКІВ ТА КОСМЕТИЧНИХ ЗАСОБІВ
КАФЕДРА АПТЕЧНОЇ ТЕХНОЛОГІЇ ЛІКІВ

MINISTRY OF HEALTH OF UKRAINE
NATIONAL UNIVERSITY OF PHARMACY
DEPARTMENT OF INDUSTRIAL TECHNOLOGY OF MEDICINES AND COSMETICS
DEPARTMENT OF DRUG TECHNOLOGY



Матеріали
V міжнародної науково-практичної конференції
Proceedings of the V International Scientific and Practical Conference

ФУНДАМЕНТАЛЬНІ ТА ПРИКЛАДНІ ДОСЛІДЖЕННЯ
У ГАЛУЗІ ФАРМАЦЕВТИЧНОЇ ТЕХНОЛОГІЇ

FUNDAMENTAL AND APPLIED RESEARCH IN THE
FIELD OF PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY

23 жовтня 2025 р.
October 23, 2025
Харків, Україна
Kharkiv, Ukraine

РОЛЬ БІОФУНКЦІОНАЛЬНИХ ДОПОМІЖНИХ РЕЧОВИН У ПІДВИЩЕННІ БІОДОСТУПНОСТІ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

¹Дзюбинська М.В., ²Дубініна Н.В.

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

Вступ. Близько 60–90 % нових активних фармацевтичних інгредієнтів (АРІ) відносяться до Класу II (низька розчинність, висока проникність) та Класу IV (низька розчинність, низька проникність) за Біофармацевтичною класифікаційною системою (BCS). Ця критична біофармацевтична характеристика, а саме низька розчинність у воді та недостатня проникність крізь біологічні мембрани, є основною перешкодою для їх ефективного перорального застосування та призводить до субоптимальної терапевтичної ефективності.

Традиційно допоміжні речовини (ексципієнти) розглядали як фармакологічно інертні компоненти, основною функцією яких було надання необхідного об'єму, форми та забезпечення стабільності лікарського засобу. Однак сучасні тенденції у фармацевтичній технології свідчать про перехід до концепції біофункціональних ексципієнтів, здатних активно модулювати фізико-хімічні та біофармацевтичні властивості АРІ (активні фармацевтичні інгредієнти). Їх використання відкриває нові можливості для підвищення розчинності, стабільності, контрольованого вивільнення та таргетованої доставки лікарських засобів.

Мета дослідження. Проаналізувати роль біофункціональних допоміжних речовин у підвищенні біодоступності лікарських засобів, визначити основні механізми їх дії та навести приклади впливу конкретних ексципієнтів на фармакокінетичні характеристики препаратів.

Матеріали та методи. Проведено систематичний аналітичний огляд сучасних наукових джерел (зокрема, бази даних PubMed, ScienceDirect, PMC), сфокусований на *in vitro* та *in vivo* результатах досліджень впливу біофункціональних ексципієнтів на ключові параметри: розчинність, швидкість дисоціації, мембранну проникність та біоеквівалентність активних фармацевтичних інгредієнтів (АРІ), що належать до BCS класів II та IV.

Основні результати. Основна стратегія підвищення біодоступності АРІ, особливо для препаратів BCS класів II та IV, полягає у використанні функціональних допоміжних речовин, які забезпечують радикальну зміну фізико-хімічних властивостей. Ці механізми можуть бути класифіковані за їхнім впливом на розчинність, швидкість вивільнення та абсорбцію.

1. Механізми, спрямовані на підвищення Розчинності

- Метод 1. Комплексоутворення

Допоміжні речовини: Циклодекстрини (CDs) та їх похідні.

Механізм: утворення комплексів включення, де гідрофобний АРІ розміщується у ліпофільній порожнині CD, підвищуючи уявну водну розчинність.

- Метод 2. Солюбілізація та Зниження Поверхневого Натягу

Допоміжні речовини: Сурфактанти (ПАР) / Біосурфактанти (наприклад, SLS).

Механізм: солюбілізація через утворення міцел та зниження поверхневого натягу, що прискорює розчинення АРІ.

2. Методи, спрямовані на Транспорт та Абсорбцію

- Метод 3. Наносистеми та Самоемульгування

Допоміжні речовини: Ліпіди (Смарт-ліпіди).

Механізм: формування самоемульгуючих систем доставки (SEDDS), які *in vivo* утворюють нанорозмірні краплі, що значно підвищує розчинення та абсорбцію у ШКТ.

- Метод 4. Модифікація Кінетики Вивільнення та Проникності

Допоміжні речовини: Полімери (розумні, біоадгезивні, цільові).

Механізм: формування твердих дисперсій (Solid Dispersions) для аморфізації/зменшення розміру АРІ. Використання як модифікаторів проникності та цільової доставки.

- Метод 5. Зміна Локального Середовища

Допоміжні речовини: рН-модифікатори (алкалізуючі/кислотні агенти).

Механізм: зміна локального рН для сприяння іонній формі АРІ (більш розчинний).

Приклади впливу:

- Для ризперидону (BCS I) навіть незначне додавання сорбітолу (7–60 мг) суттєво змінює його біодоступність і фармакокінетичний профіль, що підтверджує неінертність допоміжних речовин.
- Для альендронату (BCS III) введення 4 мг SLS підвищувало біодоступність більш ніж у 5 разів, демонструючи значний вплив поверхнево-активних речовин на абсорбцію.

Висновок. Біофункціональні допоміжні речовини (ексципієнти) є ключовим, активним інструментом сучасної фармацевтичної технології. Вони забезпечують підвищення уявної розчинності та проникності АРІ, використовуючи такі механізми, як комплексоутворення (Циклодекстрини), солюбілізація (Сурфактанти) та формування наносистем (Ліпіди, Полімери). Ексципієнти не є фармакологічно інертними: навіть незначні кількісні зміни можуть суттєво змінювати фармакокінетичний профіль препарату, що було доведено на прикладах Рисперидону та Альендронату. Це вимагає більш обережної та точної регуляторної оцінки впливу ексципієнтів на біодоступність і біоеквівалентність, особливо при застосуванні BCS-вейверів.

Подальші дослідження мають бути спрямовані на розробку стандартизованих *in vitro* методів для прогнозування *in vivo* впливу ексципієнтів та створення єдиних підходів до класифікації й оцінки безпечності та функціональності біофункціональних допоміжних речовин.