

Farmako baten iragazkortasunaren kalkulua



Ariketa praktikoa

Iragazkortasuna. Ariketa praktikoa

- ❑ Laborategi farmazeutiko batek hipertentsioaren aurkako molekula berri batekin aho-bidetik administratzeko sendagai bat garatu nahi du. Lau osagai aktibo berri ditu eta Caco-2 zelula kulturak erabiliz iragazkortasun saioak egin dira. Entseguen baldintzak honako hauek dira:
 - ❑ Konpartimentu emaelearen bolumena: 1 mL
 - ❑ Konpartimentu hartzailearen bolumena : 1 mL
 - ❑ Farmakoaren kontzentrazioa konpartimentu emaelean : 500 $\mu\text{g/mL}$
 - ❑ Zelula kulturaren gainazala: 2 cm^2
- ❑ Aldez aurretik zehaztutako denboratan farmakoaren kontzentrazioa neurtzen da konpartimentu hartzailean. Lortutako emaitzak hauek dira:

Iragazkortasuna. Ariketa praktikoa

	Kontzentrazioa ($\mu\text{g}/\text{mL}$)			
Denbora (h)	A Farmakoa	B Farmakoa	C Farmakoa	D Farmakoa
0	0	0	0	0
1	0,04	0,07	0,65	5,20
2	0,20	0,38	1,72	13,76
3	0,37	0,73	3,36	26,88
4	0,49	0,99	6,22	49,76
5	0,63	1,26	8,41	67,28
6	0,79	1,57	10,32	82,56
7	0,91	1,83	12,99	103,92
8	1,03	2,07	16,21	129,68
9	1,18	2,35	18,58	148,64
10	1,29	2,57	21,47	171,76
11	1,35	2,70	22,54	180,32
12	1,36	2,73	23,14	185,12

Iragazkortasuna. Ariketa praktikoa

- ❑ Farmako bakoitzarekin kontzentrazioa vs denbora irudikatu
- ❑ Farmako bakoitzarekin, kalkula ezazu:
 - ❑ Permeazio abiadura ($\mu\text{g}/\text{h}$)
 - ❑ Fluxua ($\mu\text{g}/\text{h cm}^2$)
 - ❑ Itxurazko iragazkortasuna (P_{app})

$$P_{app} = \frac{dQ}{dt} \cdot \frac{1}{A \cdot C_0}$$

P_{app} : Itxurazko iragazkortasuna (cm/seg)

dQ/dt : Permeazio abiadura ($\mu\text{g}/\text{seg}$)

A: Mintzaren gainazala

C_0 : Ganbera emailearen hasierako kontzentrazioa

Iragazkortasuna. Ariketa praktikoa

- ❑ Xurgatutako dosi frakzioa (F_a) kalkula ezazu. Mintza zeharkatzen duen farmako portzentajea eta gizakietan xurgatutako dosi frakzioa erlazionatzen dituen ekuazioa hau da:

$$F_a = 100 \cdot \left[1 - \text{EXP} \cdot (-0,85 \cdot \%T) \right]$$

- ❑ Xurgatutako dosi frakzioa (F_a) vs itxurazko iragazkortasunaren balioa (P_{app}) grafikoki irudikatu.

Iragazkortasuna. Ariketa praktikoa

- ❑ Molekula guztietatik, zeinekin hasiko zenuke garapen galenikoa?
Zergatik?
- ❑ Zeintzuk dira kontutan hartu beharreko beste faktoreak hautagairik egokiena aukeratzeko?