



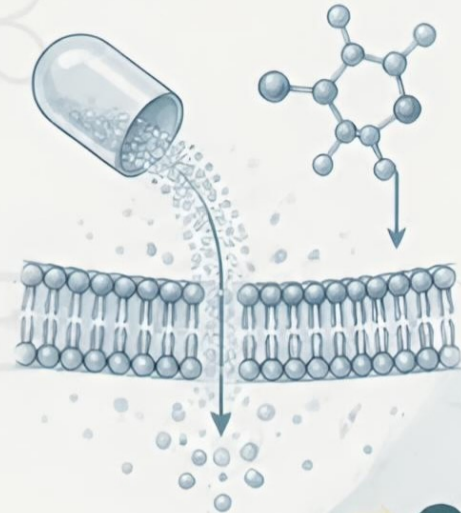
لجان الدفوعات



BIPHARMACEUTICS

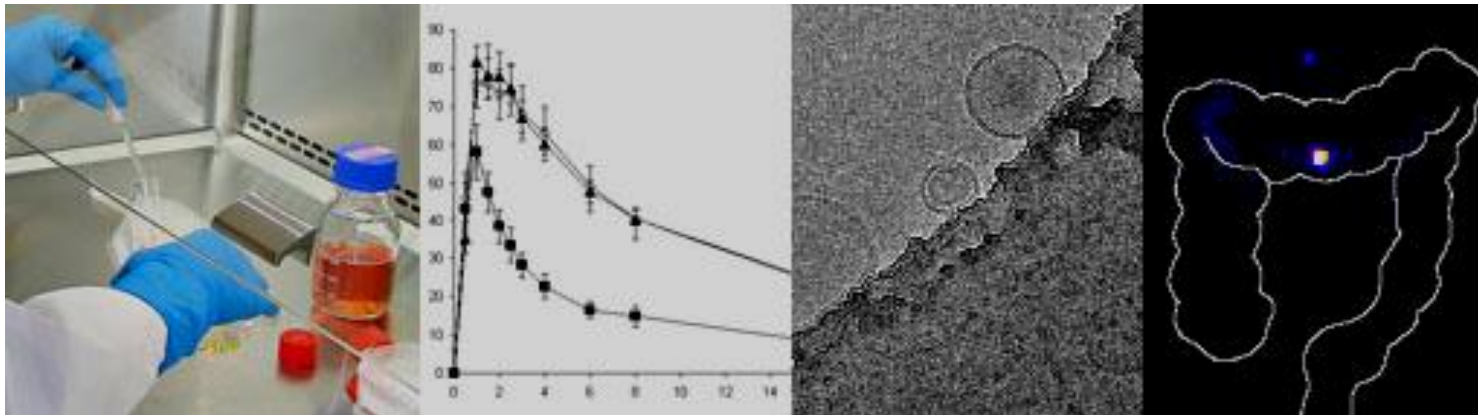
MORPHINE ACADEMY

MORPHINE
ACADEMY



Biopharmaceutics

Introduction



Introduction to biopharmaceutics

- **Biopharmaceutics:** the study of how the physicochemical properties of drugs, dosage forms and routes of administration affect the rate and extent of the drug absorption: *Bio availability*.
- Thus, biopharmaceutics involves factors that influence the:
 - 1) rate of drug release from the product;
 - 2) stability of the drug in the route of administration
 - 3) rate of dissolution of the drug at the absorption site
 - 4) availability of the drug at its site of action.

Introduction to biopharmaceutics

الموقع الذي يتفاعل معه الدواء site of action، أو حاد الدواء بوظيفته تأثيره العلاجي، أو حاد الدواء
على مستقبلات معينة (receptors) أو الحاد للدواء (receptors) كما أنه تأثير الدواء (action)

موقع التأثير site of action، أو حاد الدواء بوظيفته تأثيره العلاجي، أو حاد الدواء

الأسباب:

A given drug may exhibit differences in its availability at the site of action if it is administered:

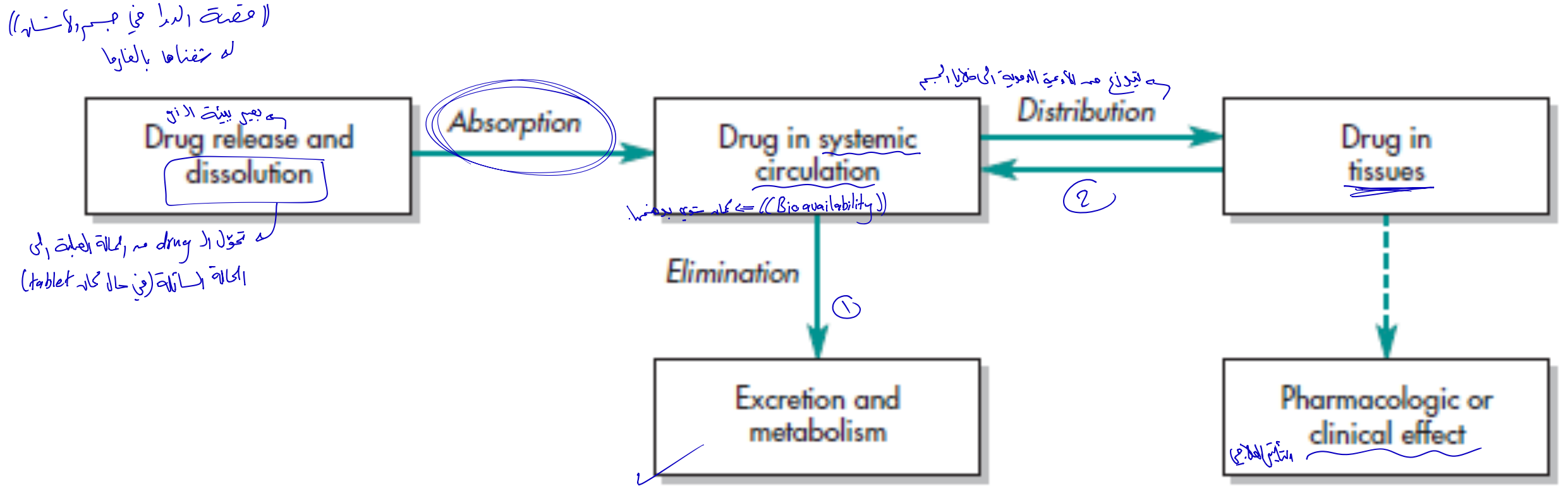
1 in the **same type of dosage form** by different routes of administration

(e.g. an aqueous solution of the drug administered by the oral and intramuscular routes);

2 by the same route of administration **but in different types of dosage form** (e.g. a tablet, a capsule and an aqueous suspension administered by the oral route)

3 in the **same type of dosage form** by the same route of administration **but in different formulations**

(e.g. different formulations of an oral aqueous suspension)
Additives



Scheme demonstrating the dynamic relationship between the drug, the drug product, and the pharmacologic effect.

Introduction to biopharmaceutics

Absorption
Distribution
metabolism
Excretion.

- **ADME**: is an acronym in pharmacokinetics and pharmacology for **absorption**, **distribution**, **metabolism**, and **excretion**, and describes the disposition of a pharmaceutical compound within an organism.

حركة الأدوية في الجسم (الإنسان)

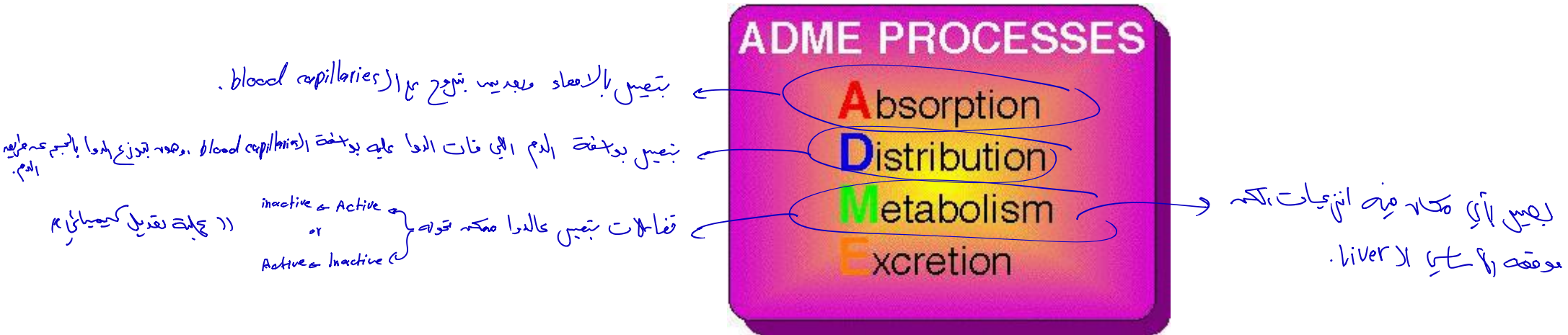
- **Pharmacokinetics**: The study and characterization of the time course (kinetics) of drug absorption, distribution, metabolism and elimination (ADME).

Excretion : اني اتخلص من الدواء بفضة الكلى من حالة الدواء.

Elimination : تنقص بكمية الدواء عن طريق التخلص منه بكمية أو أكثر.

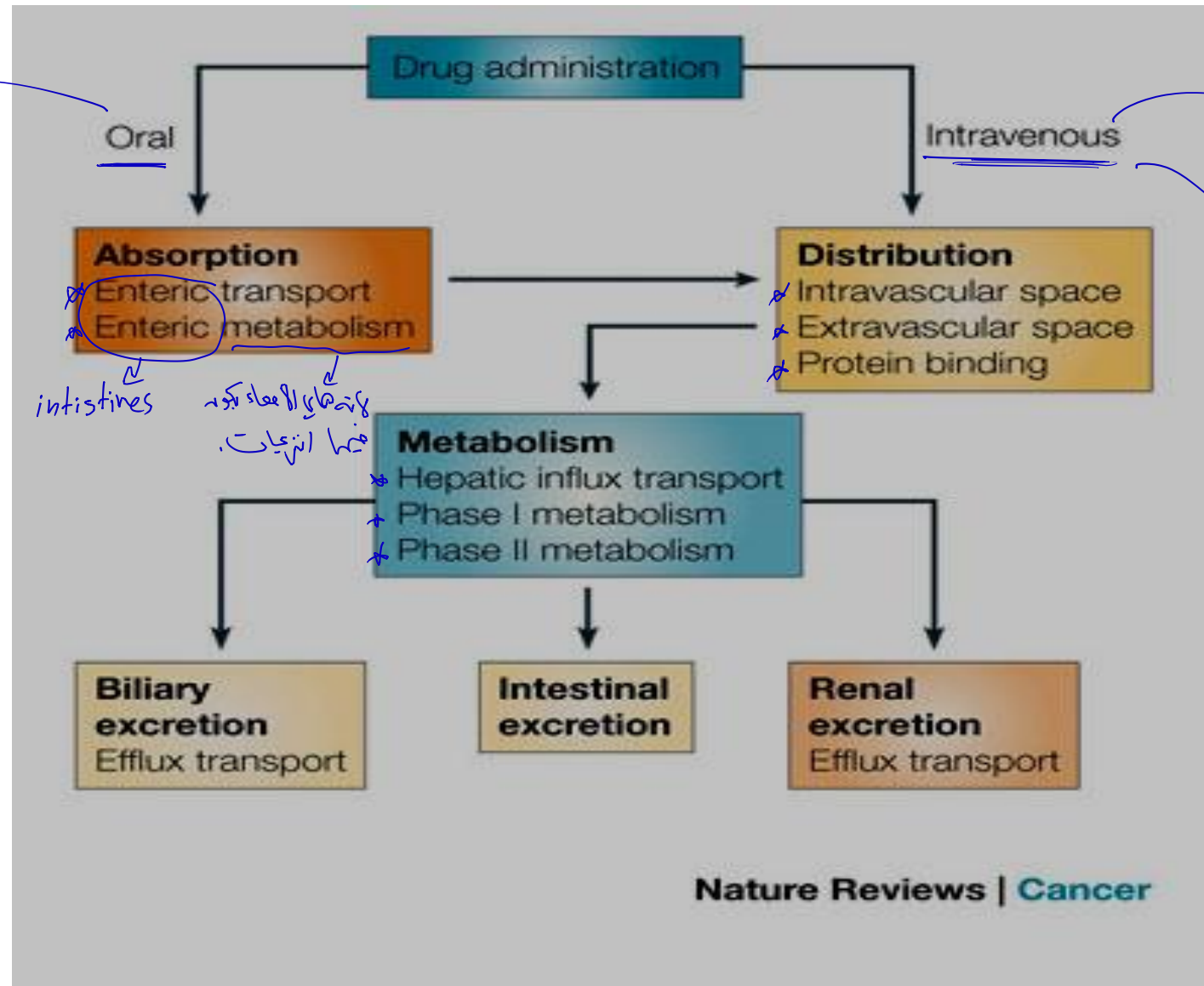
metabolism
Excretion

Introduction to biopharmaceutics

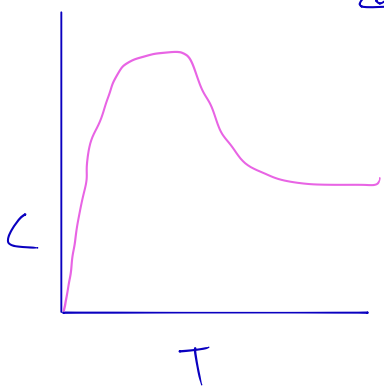
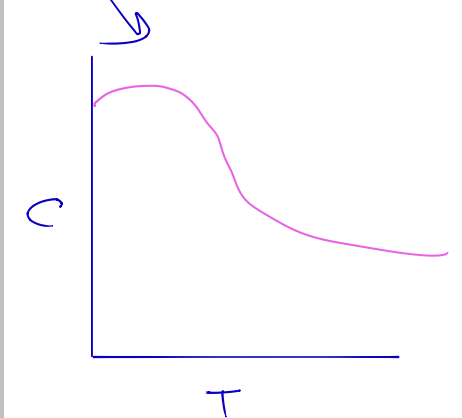


- **Absorption:** is the process of a substance entering the body.
- **Distribution:** is the dispersion of substances throughout the fluids and tissues of the body.
- **Metabolism:** is the irreversible transformation of parent compounds into daughter metabolites.
- **Excretion:** is the elimination of the substances from the body.

Introduction to biopharmaceutics



هذه أنت اعتبرت الدواء بشكل
مباشر بالدم يعني ما اعتبرت خطوة
الـ Absorption



Elimination and
Excretion.

الحكمي مهم

Distribution
Elimination

بعد تركيز الدواء بالدم ينقسم إلى النصفين: النصف الذي يتوزع في الأنسجة والنصف الذي يخرج من الدم بواسطة الكلى، يعني يصفى.

هنا النصفين يكونان two phases، فيها أحدهما يثبت التركيز (لا يزيد ولا يقل) ويتغير خلال وقت قصير جداً، C_{max} يعني أعلى تركيز وصله الدواء بداخل

دم المريض، وعندها يتجزأ.

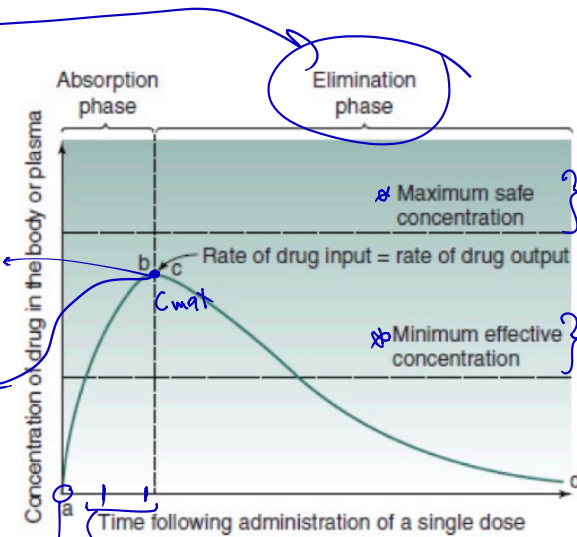
Rate of drug input = Rate of drug output.

Time zero (يعني عند نفس وقت Administration) - طاعاً دواء داخل دم المريض.

بعد مرور وقت صار يثبت / مقصود (التركيز الدواء طاعاً يزيد فيما داخل جسم المريض).

المرحلة التي طاعاً يزيد فيها تركيز الدواء بداخل دم المريض - Absorption phase

يعني طاعاً يزيد مقصود الدواء من gi tract إلى الدم.



أقل تركيز لازم
حتى تبلى أو
toxicity

أقل تركيز لازم يوصله
الدواء جسم المريض حتى
يعطي تأثير علاجي

Introduction to biopharmaceutics

- The plasma level-time curve is generated by measuring the drug concentration in plasma samples taken at various time intervals after a drug product is administered.
- The concentration of drug in each plasma sample is plotted against the corresponding time at which the plasma sample was removed.

Introduction to biopharmaceutics

- **Drug Product Performance Parameters:**

هل أول ما يغتوت الدواء مع طول راح يعني

1- **Minimum effective concentration (MEC):** The minimum concentration of drug needed at the receptors to produce the desired pharmacologic effect.

تأثير؟ لا، لازم يوصل حد معين
منه التاثيرات النوعية للمدوية
يأتى بعد التأخر.

2- **Minimum toxic concentration (MTC):** The drug concentration needed to just produce a toxic effect.

الوقت الذي يحتاجه حتى اوصل

← لا minimum effective conc.

3- **Onset time:** The time required for the drug to reach the MEC.

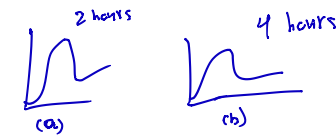
يعني انت اخذت الدواء الساعة 4 وبتأخر
تأخر الدواء ساعة 5 انما onset time هو ساعة.

4- **Duration of action:** The difference between the onset time and the time for the drug to decline back to the MEC.

الهدف بتقريبه انه الدواء يصل يبي MEC و
MTC الوقت الذي يقضي فيه الدواء بين هذين
المتيين هو duration of action.

الراح يقل بوظائف ال elimination & excretion

Introduction to biopharmaceutics



rate of Absorption t_{max} time of peak a , time of peak b , (الوقت بينهم الى كذا كذا شيء)

Absorption t_{max} peak t_{max} (شئ الى كذا كذا شيء)

rate of drug absorption t_{max} (شئ الى كذا كذا شيء)

5- (The time of peak plasma level) (t_{max}): The time of maximum drug concentration in the plasma and is proportional to the rate of drug absorption.

dose t_{max} (شئ الى كذا كذا شيء)

6- The peak plasma level (C_{max}): The maximum drug concentration, usually related to the dose and the rate constants for absorption and elimination of the drug.

rate for absorption t_{max} (شئ الى كذا كذا شيء)

Elimination t_{max} (شئ الى كذا كذا شيء)

7- Area under the plasma conc-time curve (AUC): It is related to the amount of drug absorbed systemically.

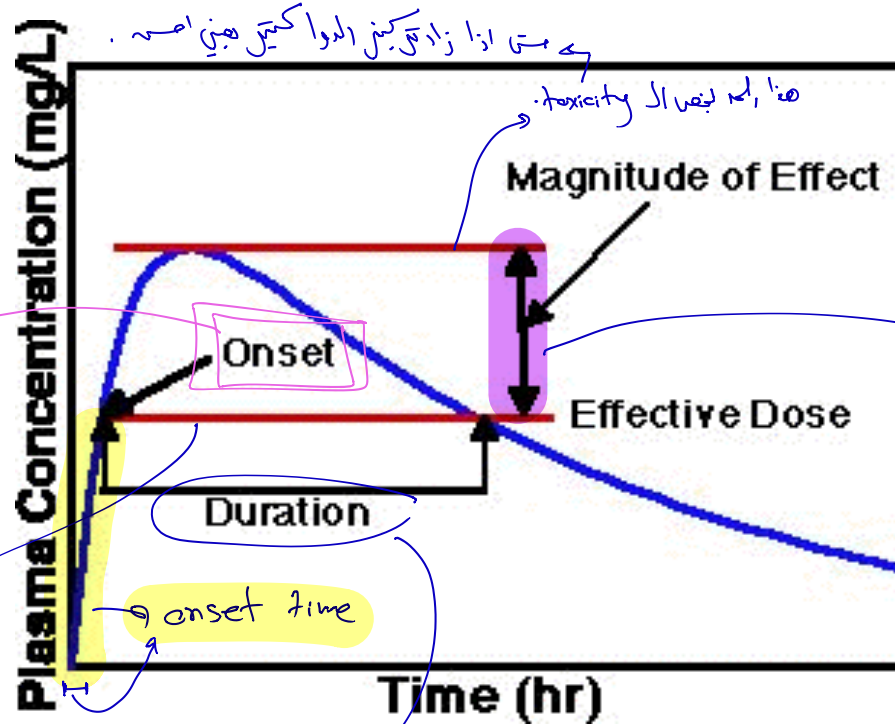
كمية الى كذا كذا شيء curve

هذا oral curve
منزوا على النسخة.

Introduction to biopharmaceutics

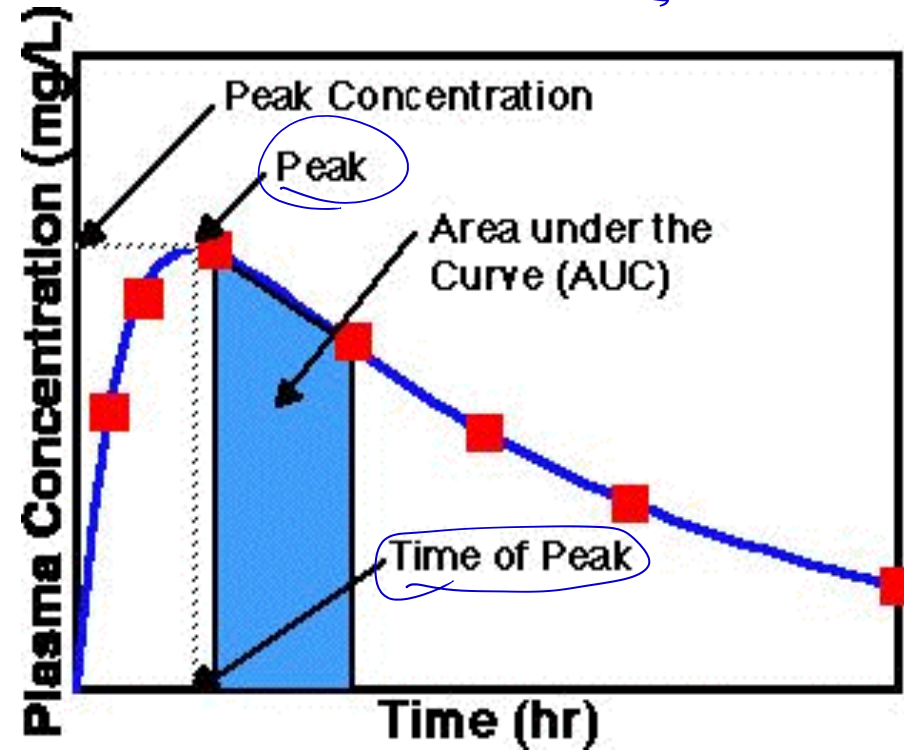
إستمار : $\frac{1}{2}$ أي بي تعتمد $\frac{1}{2}$ peak

- ① Dose (directly)
- ② Constant for absorption (directly)
- ③ Elimination of the drug (inversely)



هو المجال الذي يكون فيه تركيز الدواء مرتفعاً بما يكفي لإحداث التأثير العلاجي، لكنه ليس مرتفعاً لدرجة تسبب السمية.
هذا الفرق هو therapeutic range
التي التي تكون فيه التأثير العلاجي

إذا كان narrow (ضيقة) : يكون الـ toxicity أو عالية، منه مرعبة (مثل الـ digoxin) في القلب اعتدائه بالباطن.
إذا كان broad (واسع) : على الأدوية أفضى للاستعمال.



وقت بداية التأثير
هذا الحد هو الـ minimum effective conc.

أهميتها : الدواء يُعطى تأثيره ساعة ١ وانتهى ساعة ٥، فانت تعرف انه الساعة ٥ لازم المرفعة أيضاً الـ dose الثانية، فهي مهمة عاين اعرف الـ frequency (الكل قدتي اعني dose مبدية ١١)

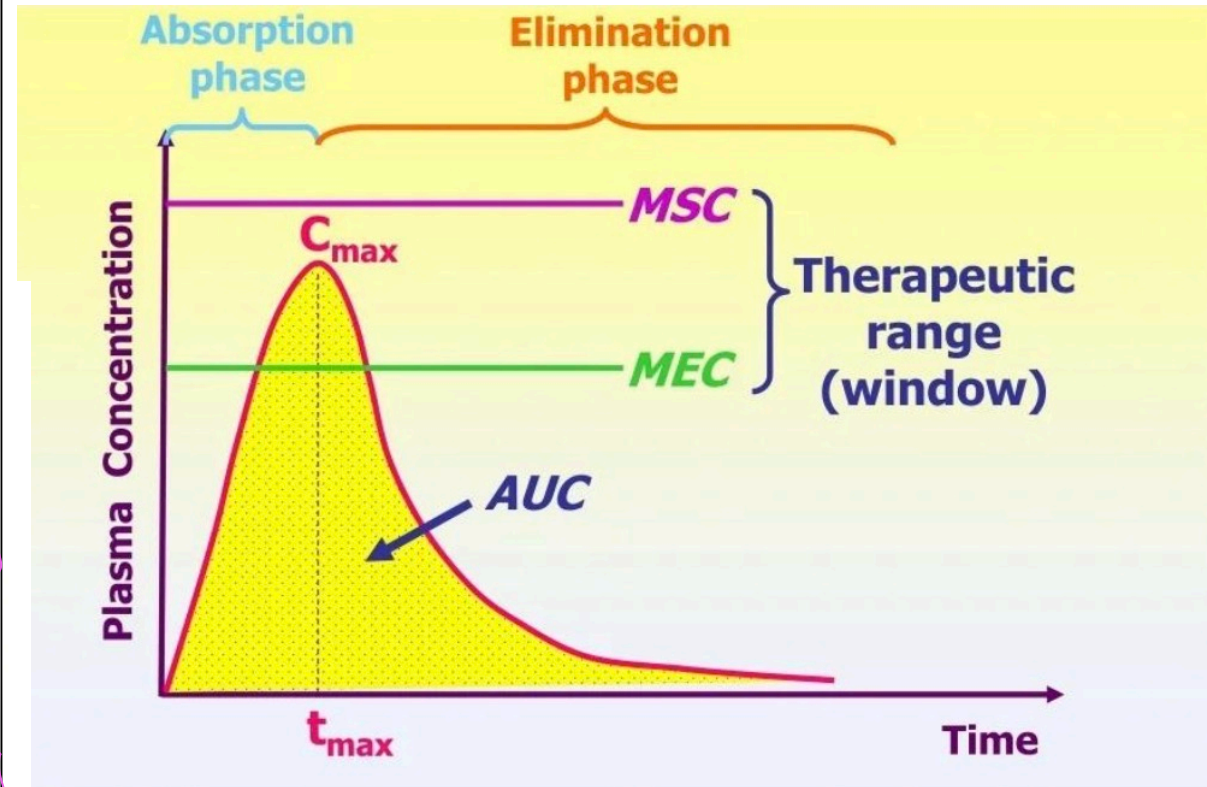
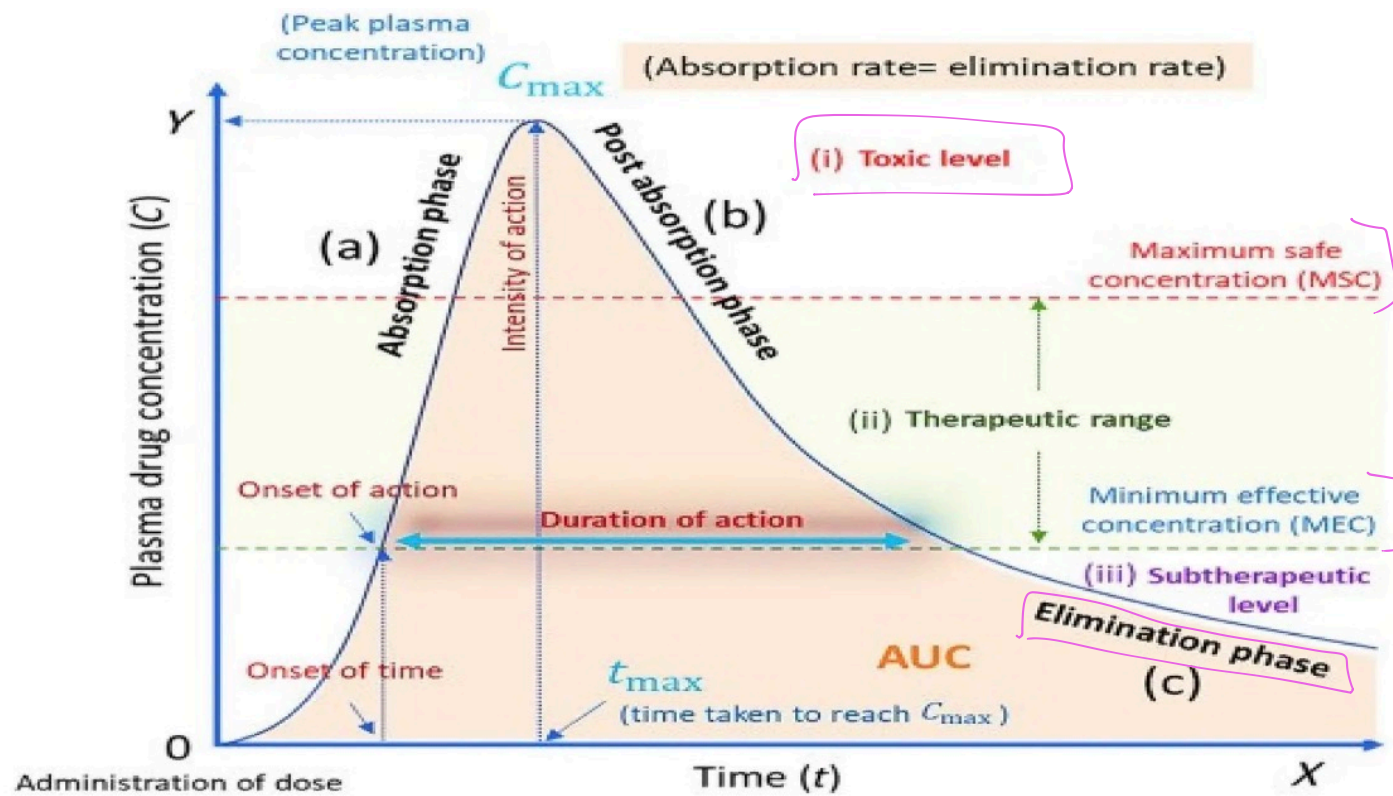
تركيز الدواء من فعال بعينه المدة.

كما تقل الـ duration of action - تنبيه الـ frequency.

في عدد مرات الخطأ الدواء.

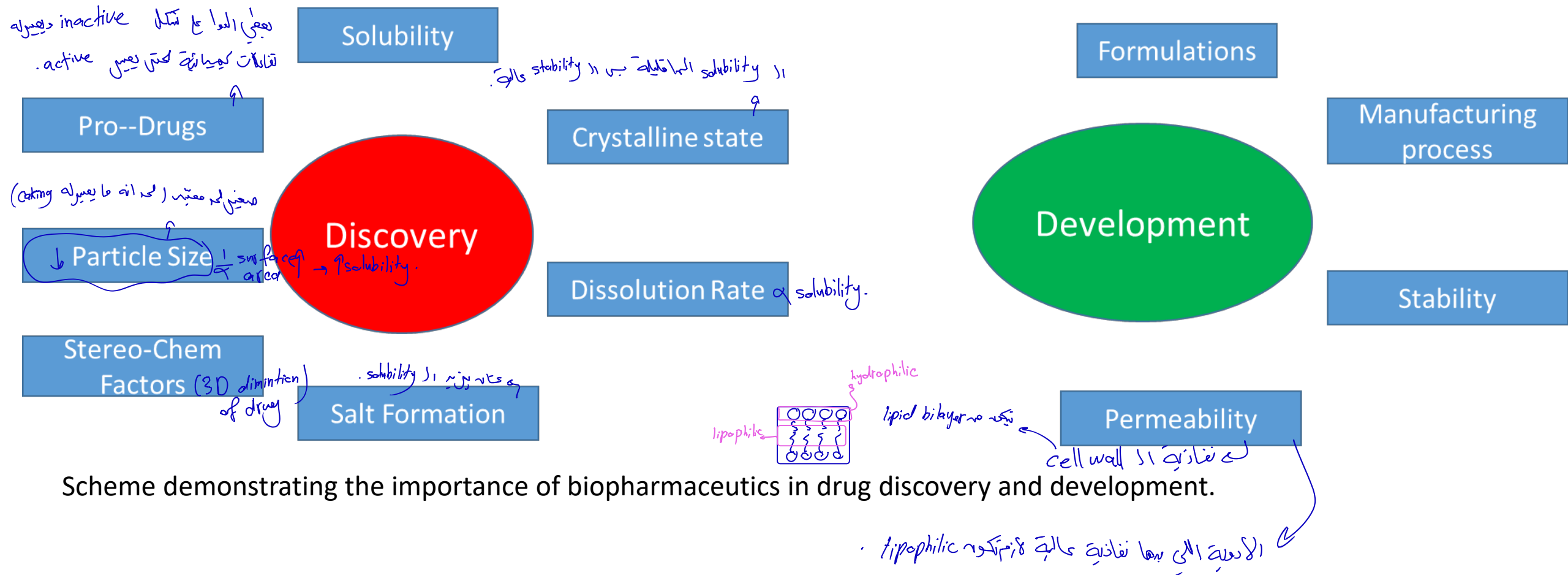
- Duration of action $\downarrow$ → قد نحتاج إلى Frequency $\uparrow$.
- Duration of action $\uparrow$ → قد نحتاج إلى Frequency $\downarrow$.

لقيت هـول الصورتين عالنت حسيتهم شاملين بشكل أوضـح



Introduction to biopharmaceutics

Biopharmaceutical considerations in drug discovery and development



Introduction to biopharmaceutics

استیاء به لك قطعها بحی
الماعتبار بی لغتو ادویه :-

TABLE 1-1 Biopharmaceutic Considerations in Drug Product Design

Items	Considerations
Therapeutic objective	Drug may be intended for <u>rapid relief</u> of symptoms, slow <u>extended action</u> given once per day, or longer for chronic use; some drug may be intended for <u>local action</u> or <u>systemic action</u>
Drug (active pharmaceutical ingredient, API)	Physical and chemical properties of API, including <u>solubility</u> , <u>polymorphic form</u> , <u>particle size</u> ; <u>impurities</u>
Route of administration	Oral, topical, parenteral, transdermal, inhalation, etc
Drug dosage and dosage regimen	Large or small drug dose, frequency of doses, patient acceptance of drug product, patient compliance
Type of drug product	Orally disintegrating tablets, immediate release tablets, extended release tablets, transdermal, topical, parenteral, implant, etc
Excipients	Although very little pharmacodynamic activity, excipients may affect drug product performance including <u>release of drug from drug product</u>
Method of manufacture	Variables in manufacturing processes, including <u>weighing accuracy</u> , <u>blending uniformity</u> , <u>release tests</u> , and <u>product sterility for parenterals</u>

Bioavailability $\xrightarrow{\text{بعد الامتصاص}}$ Distribution

Introduction to biopharmaceutics

rate drug absorption

extent drug absorption

إذا كانت الدواء بتركيز مناسب في الدم، لن يمتص، لأن الجسم مع

❑ Poor biopharmaceutical properties that impact the rate and extent of drug absorption may result in:

- poor and variable bioavailability;
- poor therapeutic outcomes
- the need for multiple daily dosing;
- long and costly development times for industry; and high cost of products.

مع زيادة تركيز الدواء في الدم، لن يمتص، لأن الجسم مع
excipients، لا.

#