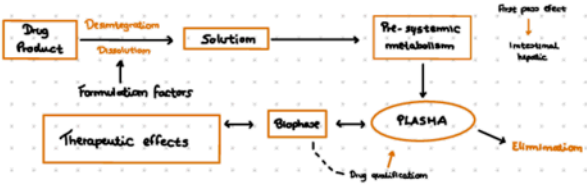
Biodisponibilidade e bioequivalência

Biodisponibilidade: conceito farmacocinético que descreve a velocidade e o grau (extensão) com que uma substância ativa ou a parte terapeuticamente ativa da molécula é absorvida a partir de um medicamento e se torna disponível no local de ação.



A eficácia terapêutica de um fármaco depende da capacidade da forma farmacêutica em ceder o fármaco no local de absorção, e na consequente absorção e distribuição do fármaco até o local de ação, numa velocidade e quantidade suficiente que permita desencadear o efeito farmacológico desejado.

Objetivos dos estudos de biodisponibilidade:

- ✓ Determinação da melhor via de administração → BIODISPONIBILIDADE ABSOLUTA
- ✓ Determinação da melhor formulação → BIODISPONIBILIDADE RELATIVA ou BIOEQUIVALÊNCIA

O valor da biodisponibilidade depende de:

Nota: Via IV → BD = 100%
Via não IV → BD ≤ 100%

- Via de administração
- Tipo de formulação (facilmente controlados / corrigidos)
- Fatores fisiológicos (próprios do indivíduo, dificilmente controláveis / corrigidos)

Fatores que influenciam a absorção / biodisponibilidade oral:

Relacionados com a forma farmacêutica:

Propriedades físico-químicas do fármaco
- Dimensão da partícula;
- Estrutura cristalina;
- Grau de hidratação do cristal;
- Forma de sal ou éster;
- pKa;
- Solubilidade total ou intrínseca.

Variáveis da formulação e produção:
- Desintegrante;
- Lubrificante;
- Diluente;
- Tensioativo;
- Revestimento
- Força e velocidade de compressão;
- Armazenamento.

Relacionados com o indivíduo:

Fatores fisiológicos
- Diferente capacidade de absorção no trato GI;
- Área disponível para a absorção;
- pH do líquido gastrointestinal;
- Velocidade de esvaziamento gástrico;
- Motilidade intestinal;
- Perfusão do trato GI;
- Metabolismo pré-sistémico e de primeira passagem hepático;
- Idade, sexo e peso;
- Estados de doença.

Interações:
- Alimentos;
- Volume de líquidos;
- Outros fármacos;
- Substâncias presentes no trato GI.

Tipos de Biodisponibilidade:

Biodisponibilidade relativa ou farmacêutica (F) → Depende da forma farmacêutica. → absorvida

Biodisponibilidade absoluta ou farmacológica (F*) → Depende da biotransformação. → sobrevive à biotransformação

Biodisponibilidade oral = FF*