

БИОЭКВИВАЛЕНТНОСТЬ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

В большинстве случаев различия в терапевтической эффективности препаратов, содержащих одни и те же активные вещества, обусловлены изменением их биодоступности – количества лекарственного вещества, которое попадает в системный кровоток, и скорости, с которой этот процесс происходит. В связи с этим возникло новое понятие – биоэквивалентность.

Два лекарственных препарата считают биоэквивалентными, если они фармацевтически эквивалентны, имеют одинаковую биодоступность и после назначения в одинаковой дозе являются сходными, обеспечивая должную эффективность и безопасность.

Оценку биоэквивалентности лекарственных средств в настоящее время считают одним из основных методов медико-биологического контроля качества генерических препаратов, т.е. таких лекарственных средств, которые содержат одно и то же активное вещество в одинаковой дозе и в той же лекарственной форме, что и соответствующее оригинальное средство [1].

ВОЗ рекомендует определять биоэквивалентность с использованием следующих сравнительных испытаний: *in vivo* (фармакокинетические и фармакодинамические испытания на людях, клинические испытания) и *in vitro* (тест «растворение»). Все исследования проводятся путем сопоставления соответствующих параметров испытуемого препарата и препарата сравнения.

Фармакокинетические испытания являются достаточно дорогостоящими и продолжительными. Поэтому в последние годы активно обсуждается вопрос о применимости для установления биоэквивалентности генериков хорошо известного из фармакопейного анализа теста «растворение».

Конечно, существует проблема корреляции между результатами экспериментов, проводимых *in vitro* и *in vivo*, поскольку такую корреляцию выявить удастся не всегда. Более того, несмотря на явные различия в скорости высвобождения *in vitro*, значимые различия в биодоступности могут не выявляться, и наоборот – одинаковые показатели теста «растворение» не всегда обуславливают биоэквивалентность генериков. Тем не менее, известно, что в случае терапевтической неэквивалентности лекарственных препаратов часто имеет место различие в скорости высвобождения действующего вещества из лекарственной формы, что и дает основание применять тест «растворение» в качестве альтернативы фармакокинетическим испытаниям.

Для твердых пероральных лекарственных форм (таблетки, драже, капсулы, гранулы) тест «растворение» является одним из важнейших критериев качества. Его использование при анализе лекарственного препарата и есть попытка ввести в нормативные документы испытание, которое наряду с оценкой фармацевтической эквивалентности позволяло бы проводить хотя бы приблизительную оценку биоэквивалентности.

При использовании теста «растворение» для оценки биоэквивалентности следует получать несколько временных точек, на основании которых строится кривая высвобождения, и проводить исследование испытуемого препарата и препарата сравнения в одинаковых условиях. В некоторых случаях сравнение профилей растворения испытуемого и оригинального препаратов может служить основанием для заключения об их биоэквивалентности.

ЛИТЕРАТУРА

1. Правила проведения исследований биоэквивалентности лекарственных средств. Часть 1. Фармакокинетические аспекты / А. А. Фирсов [и др]. – Москва: Академия, 1995. – 285 с.
2. Арзамасцев А. П. Эквивалентность воспроизведенных лекарственных средств: фармацевтические аспекты / А. П. Арзамасцев, В. Л. Дорофеев. – Москва: ММА им. Сеченова, 2003. – 203 с.