

**ВЗАЄМОВІДНОСИНИ ФАРМАКОКІНЕТИЧНИХ ТА
ФАРМАКОДИНАМІЧНИХ ХАРАКТЕРИСТИК ЛІКІВ НА ЕТАПІ ЇХ
БІОТРАНСПОРТУ.**

Бухтіарова Т.А., Лук'янчук В.Д.

ДУ “Інститут фармакології та токсикології НАМН України”

Взаємодія з білками сироватки крові є центральним етапом фармакокінетики лікарських засобів. Утворення зворотніх комплексів транспортного протеїну з ліками чинить вплив на характер розподілу, а отже й на тривалість та інтенсивність їх фармакотерапевтичної дії. При аналізі інтегральної біологічної ролі зворотнього комплексоутворення ксенобіотика з сироватковими білками варто виходити із припущення про те, що проникати в тканини та проявляти фармакодинамічні ефекти або токсичну дію здатні лише вільні не зв'язані з протеїном його молекули. З огляду на це, визначення такого ключового параметру фармакокінетики, як об'єм розподілу необхідно здійснювати виходячи не із загальної концентрації препарату в крові, а лише із рівня його вільної концентрації. Такий підхід ґрунтується на твердженні, що інтенсивність фармакотерапевтичної ефективності ліків зворотно пропорційна ступеню їх зв'язування з транспортним білком. По мірі переходу вільної фракції лікарського засобу з крові в тканини відбувається зміщення рівноваги, що призводить до постійної дисоціації комплексів (білок – ліганд), збільшуючи, таким чином, вільну (не зв'язану з протеїном) фракцію.

Таким чином, молекули ліків, що зворотно фіксовані протеїном представляють собою свого роду циркулюючий резерв препарату в організмі. Важливо, що при підвищенні спорідненості білка до ліків швидкість переходу в тканини, а отже й інтенсивність реалізації складових їх фармакодинамічного профілю будуть зменшуватись, а час циркуляції, зокрема величина періоду напівелімінації та тривалість фармакотерапевтичної дії – збільшуватись.