

[Akceptuje](#)

W ramach naszej witryny stosujemy pliki cookies w celu świadczenia państwu usług na najwyższym poziomie, w tym w sposób dostosowany do indywidualnych potrzeb. Korzystanie z witryny bez zmiany ustawień dotyczących cookies oznacza, że będą one zamieszczone w Państwa urządzeniu końcowym. Możecie Państwo dokonać w każdym czasie zmiany ustawień dotyczących cookies. Więcej szczegółów w naszej [Polityce Prywatności](#)

[Portal](#) [Informacje](#) [Katalog firm](#) [Praca](#) [Szkolenia](#) [Wydarzenia](#) [Porównania międzylaboratoryjne](#)
[Kontakt](#)



Laboratoria.net
Innowacje Nauka
Technologie



[Logowanie](#) [Rejestracja](#) [pl](#)

Zawsze aktualne informacje

Zapisz

Naukowy styl życia

Nauka i biznes

- [Nowe technologie](#)
- [Felieton](#)
- [Tygodnik "Nature"](#)
- [Edukacja](#)
- [Artykuły](#)
- [Przemysł](#)

[Strona główna](#) > [Informacje](#)

Amorfizacja sposobem na poprawę działania leków



Kluczowym wyzwaniem, przed jakim stoi współczesna farmacja, jest kwestia przyspieszenia i poprawy działania leków w tabletkach poprzez zwiększenie ich rozpuszczalności - twierdzi prof. Marian Paluch z Uniwersytetu Śląskiego. Rozwiązaniem mają być tzw. leki amorficzne.

Amorficznymi farmaceutykami prof. Paluch z Zakładu Biofizyki i Fizyki Molekularnej UŚ zajmuje się od kilkunastu lat. "Ponad 35 proc. substancji leczniczych, które obecnie są dostępne na rynku, charakteryzuje się niską biodostępnością, wynikającą ze słabej rozpuszczalności tych leków. Co więcej, szacuje się, że ponad 70 proc. nowych związków, mających ogromny potencjał, aby stać się farmaceutykami, zostanie odrzuconych podczas procesu badawczo rozwojowego właśnie ze względu na ich słabą rozpuszczalność w wodzie" - tłumaczył w rozmowie z PAP.

Chodzi o leki w postaci stałej - czyli tabletek, peletek lub kapsułek. Jedną z efektywniejszych metod, mogącą poprawić biodostępność zawartych w nich substancji aktywnych, jest ich konwertowanie do tzw. formy amorficznej. Ciała amorficzne łączą w sobie pewne cechy ciał stałych i cieczy - substancja będąca w stanie amorficznym jest ciałem stałym, jednak tworzące ją cząsteczki są ułożone w sposób chaotyczny, co bardziej przypomina ciecz.

"W postaciach stałych substancje aktywne występują w formie krystalicznej; tzn. ich molekuly są uporządkowane, tworzą tzw. sieć krystaliczną. Ich rozpuszczalność możemy poprawić poprzez przekształcenie ich do formy nieuporządkowanej - czyli amorficznej, inaczej nazywaną szklistą, gdzie molekuly nie tworzą sieci, lecz są chaotycznie rozmieszczone" - dodał prof. Paluch.

Układy amorficzne mają wyższą energię wewnętrzną, niż ich krystaliczne odpowiedniki; dzieje się tak właśnie ze względu na brak tego wewnętrznego, "dalekozasięgowego" uporządkowania. W efekcie potrzeba mniejszej energii, żeby rozpuścić te substancje, więc tym samym amorfizacja prowadzi do zwiększenia ich rozpuszczalności.

Krystaliczne substancje lecznicze można konwertować do formy amorficznej różnymi metodami. Jak tłumaczył prof. Paluch, najprostszą jest stopienie formy krystalicznej, a następnie szybkie jej schłodzenie; co pozwala uniknąć powrotu farmaceutyku do jego pierwotnej, krystalicznej formy.

Ta metoda nie zawsze jest jednak skuteczna - m.in. ze względu na fakt, że niektóre substancje mają temperaturę topnienia zbliżoną do temperatury degradacji próbki (tymczasem związku, który przed przechłodzeniem zdegraduje, zdecydowanie nie można podać pacjentowi). Innym sposobem amorfizacji jest mielenie substancji aktywnej w niskich temperaturach; dzięki tej metodzie można mechanicznie pozbyć się wewnętrznego uporządkowania farmaceutyku, i doprowadzić do amorfizacji.

"Problem zaczyna się jednak dopiero po wspomnianej transformacji, ponieważ nieuporządkowana forma amorficzna jest fizycznie niestabilna. To oznacza, że substancje w takiej formie mogą powrócić do pierwotnej, krystalicznej formy, tracąc swoje wspaniałe własności. Opisany efekt rekrystalizacji

amorficznych materiałów można porównać do miodu, który po jakimś czasie wykryształizowuje. Badania nad amorficznymi farmaceutykami koncentrują się więc na określeniu czasu ich fizycznej stabilności oraz na tym, by jak najdłużej utrzymać je w nieuporządkowanej formie. Ponieważ musimy mieć pewność, że przez okres ważności leku - standardowe trzy lata - lek nie straci swych właściwości" - mówił fizyk.

Właśnie ta ostatnia kwestia - utrzymanie formy amorficznej przez długi czas - jest obecnie dla prof. Palucha największym wyzwaniem badawczym.

Naukowiec ocenia, że zainteresowanie tematyką tzw. leków amorficznych na świecie jest duże. Dowodzą tego poświęcone tej tematyce konferencje naukowe, w których prof. Paluch regularnie bierze udział.

Profesor podkreślił jednak, że nie uda się wprowadzić na rynek leków amorficznych bez współpracy fizyków, chemików i farmaceutów. "To cała droga, wymaga współdziałania - od pomysłu, sposobu na zamorfizowanie substancji, przez wykonanie badań, jakie czynniki determinują fizyczną stabilność, znalezienie sposobu stabilizacji tej formy - aż do zbadania farmaceutycznych własności, czyli rozpuszczalności, szybkości uwalniania itd." - tłumaczył badacz. Dodał, że wprowadzenie tych leków na rynek nie jest daleką perspektywą czasową. Konieczne są jednak fundusze.

Źródło: www.naukawpolsce.pap.pl

<http://laboratoria.net/aktualnosci/27077.html>



21-09-2017

[Zrób coś z 99% niczego](#)

Tegorocznym tematem przewodnim zajęć będą aerozele, najlepsze izolatory termiczne i najlżejsze ze znanych na świecie materiałów, składające się w blisko stu procentach z powietrza.



21-09-2017

[Probiotyki hamują rozwój raka jelita grubego](#)

Probiotyki wytwarzające histaminę redukcją stan zapalny oraz hamują rozwój raka jelita grubego u myszy.



21-09-2017

[Tworzenie mapy 3D Drogi Mlecznej](#)

Finansowany ze środków UE projekt stworzył archiwum zawierające niektóre z najbardziej precyzyjnych i dokładnych pomiarów Drogi Mlecznej, jakie zostały dokonane.



21-09-2017

[Robot z DNA samodzielnie sortuje cząsteczki](#)

Molekularnego robota, który chwyta wyznaczone cząsteczki, po czym przenosi je w odpowiednie miejsce opracowali naukowcy z California Institute of Technology.



21-09-2017

[Zastosowanie przełomowej metody obrazowania](#)

Naukowcy zapoczątkowali technologię obrazowania rentgenowskiego, która mogłaby doprowadzić do znaczącego postępu w medycynie.



21-09-2017

[Antydepresanty zwiększają ryzyko zgonu](#)

Popularne leki przeciwdepresyjne (selektywne inhibitory zwrotnego wychwytu serotoniny) zwiększają ryzyko zgonu.



21-09-2017

[Nowe przeciwcało terapeutyczne dla serca](#)

Naukowcy z UE opracowali lek, który blokuje zapalenie naczyń, zmniejszając ryzyko chorób sercowo-naczyniowych (CVD) u pacjentów.



21-09-2017

[Polscy naukowcy tworzą technologie na światowym poziomie](#)

W badaniu NCBI-R wskazano, że w ciągu kilku ostatnich lat nastąpiły istotne zmiany, które zwiastują świetlaną przyszłość innowacji w Polsce.

Informacje dnia: [Zrób coś z 99% niczego](#) [Probiotyki hamują rozwój raka jelita grubego](#) [Tworzenie mapy 3D Drogi Mlecznej](#) [Robot z DNA samodzielnie sortuje cząsteczki](#) [Zastosowanie przełomowej metody obrazowania](#) [Antydepresanty zwiększają ryzyko zgonu](#) [Zrób coś z 99% niczego](#) [Probiotyki hamują rozwój raka jelita grubego](#) [Tworzenie mapy 3D Drogi Mlecznej](#) [Robot z DNA samodzielnie sortuje cząsteczki](#) [Zastosowanie przełomowej metody obrazowania](#) [Antydepresanty zwiększają](#)

[ryzyko zgonu](#) [Zrób coś z 99% niczego](#) [Probiotyki hamują rozwój raka jelita grubego](#) [Tworzenie mapy 3D Drogi Mlecznej](#) [Robot z DNA samodzielnie sortuje cząsteczki](#) [Zastosowanie przełamowej metody obrazowania](#) [Antydepresanty zwiększają ryzyko zgonu](#)

Partnerzy