

[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

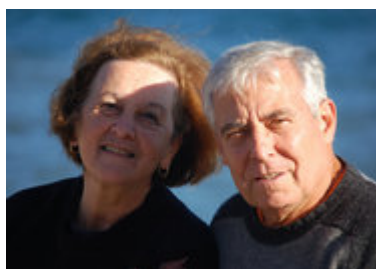
<http://laboratoria.net/aktualnosci/27077.html>



16-02-2018

Bieganie łagodzi wpływ stresu na mózg

Naukowcy z Brigham Young University (stan Utah) wykazali w badaniach na myszach, że bieganie łagodzi negatywny wpływ przewlekłego stresu na hipokamp.



16-02-2018

Pozytywne nastawienie chroni przed

demencją

Poczucie własnej wartości oraz zadowolenie z życia chronią seniorów przed demencją. Nawet tych, którzy są genetycznie do niej predysponowani.



16-02-2018

Zaawansowane technologie do produkcji szczepionek

W dobie nieustającej walki z chorobami naukowcy opracowali nowe technologie immunizacji.



16-02-2018

Tkanka nerki z... laboratorium

Korzystając z ludzkich komórek macierzystych naukowcy uzyskali tkankę nerki, która po wszczępieniu myszom filtrowała krew.



16-02-2018

NCN: ponad 326 mln zł na badania podstawowe

Narodowe Centrum Nauki rozstrzygnęło konkursy SONATA 13, SONATA BIS 7, MAESTRO 9 i

HARMONIA 9.



16-02-2018

Już w 2025 roku możliwe załogowe misje na Marsa

W 2018 roku eksploracja kosmosu nabierze tempa - ocenia Aleksandra Przegalińska z Massachusetts Institute of Technology.



16-02-2018

Na ZUT powstaje "dźwig przyszłości"

Naukowcy z Zachodniopomorskiego Uniwersytetu Technologicznego w Szczecinie razem z badaczami z Koszalina i Poznania budują "dźwig przyszłości".



16-02-2018

Odkryto nową grupę antybiotyków

Odkryte w próbkach gleby nowe antybiotyki mogą okazać się pomocne w przypadku trudnych do leczenia infekcji.

Informacje dnia: [Bieganie łagodzi wpływ stresu na mózg](#) [Pozytywne nastawienie chroni przed demencją](#) [Zaawansowane technologie do produkcji szczepionek](#) [Tkanka nerki z... laboratorium NCN: ponad 326 mln zł na badania podstawowe](#) [Już w 2025 roku możliwe załogowe misje na Marsa](#)

[Bieganie łagodzi wpływ stresu na mózg Pozytywne nastawienie chroni przed demencją](#)
[Zaawansowane technologie do produkcji szczepionek Tkanka nerki z... laboratorium NCN: ponad 326 mln zł na badania podstawowe Już w 2025 roku możliwe załogowe misje na Marsa](#)
[Bieganie łagodzi wpływ stresu na mózg Pozytywne nastawienie chroni przed demencją](#)
[Zaawansowane technologie do produkcji szczepionek Tkanka nerki z... laboratorium NCN: ponad 326 mln zł na badania podstawowe Już w 2025 roku możliwe załogowe misje na Marsa](#)

Partnerzy