

[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](#)
[Przetargi](#) [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>



22-06-2017

[Czekają nas zabójcze upały](#)

Jeśli emisje gazów cieplarnianych będą rosły w niezmiennym tempie, aż 74% światowej populacji będzie musiała zmierzyć się w tym stuleciu z zagrażającymi ludzkiemu życiu falami...



21-06-2017

[Bioaktywne implanty pomogą milionom](#)

kobiet

Innowacyjne bioaktywne implanty polimerowe, które mają posłużyć do leczenia operacyjnego zaburzeń statyki narządów płciowych kobiet.



21-06-2017

Trójwymiarowe materiały do zastosowań w elektronice

Finansowani z funduszy UE naukowcy otwarli nową drogę w kierunku opracowania metod femtosekundowej kontroli właściwości materiałów.



21-06-2017

Protezy prącia ratunkiem dla mężczyzn

Protezy prącia to rozwiązanie dla mężczyzn, którym nie pomagają preparaty na erekcję w postaci tabletek, zastrzyków czy kremu.



20-06-2017

Bakteria przyzębia obniża płodność kobiet

Powszechnie występująca bakteria przyzębia może przyczyniać się do problemów z płodnością u młodych kobiet.



20-06-2017

[Nowe metody mapowania genetycznego](#)

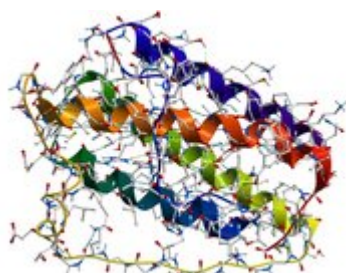
Pojawienie się technologii opartych na genomice wymaga zastosowania metod przetwarzania dużych ilości informacji.



20-06-2017

[Lek na trądzik wyleczy stwardnienie rozsiane?](#)

Często stosowany w leczeniu trądziku młodzieńczego antybiotyk - minocyklina, może pomóc także chorym na stwardnienie rozsiane.



20-06-2017

[Białkowe polimery przewodzące elektryczność](#)

Europejscy badacze wykorzystali podręcznikowy przypadek białkowych polimerów, by zrobić z niego użytek w kontekście biomedycznym.

Informacje dnia: [Czekają nas zabójcze upały](#) [Bioaktywne implanty pomogą milionom kobiet](#) [Trójwymiarowe materiały do zastosowań w elektronice](#) [Protezy prącia ratunkiem dla mężczyzn](#) [Bakteria przyzębia obniża płodność kobiet](#) [Nowe metody mapowania genetycznego](#) [Czekają nas zabójcze upały](#) [Bioaktywne implanty pomogą milionom kobiet](#) [Trójwymiarowe materiały do zastosowań w elektronice](#) [Protezy prącia ratunkiem dla mężczyzn](#) [Bakteria przyzębia obniża](#)

[płodność kobiet](#) [Nowe metody mapowania genetycznego](#) [Czekają nas zabójcze upały](#) [Bioaktywne implanty pomogą milionom kobiet](#) [Trójwymiarowe materiały do zastosowań w elektronice](#) [Protezy](#) [prącia ratunkiem dla mężczyzn](#) [Bakteria przyzębia obniża płodność kobiet](#) [Nowe metody mapowania genetycznego](#)

Partnerzy