

KOMPOZITY GLUKANOVÝCH ČÁSTIC A LÉČIVA, PŘIPRAVENÉ POMOCÍ SPREJOVÉHO SUŠENÍ

MOTIVACE

Až 90 % léčiv nacházejících se ve fázi objevu a více než 40 % léčiv schválených pro trh je ve vodě nerozpustných nebo špatně rozpustných, což představuje jednu z velkých výzev, kterým farmaceutický průmysl v současnosti čelí. Špatná rozpustnost léčiv, a s tím související nízká rychlost rozpouštění ve vodných gastrointestinálních tekutinách, je jednou z nejčastějších příčin nízké biologické dostupnosti, hlavně v případě lékových forem pro orální aplikaci, což je nejčastější a nejpohodlnější způsob podávání.

POPIS

Kvasnicové beta-glukanové částice jsou duté a porézní mikrosféry získané z buněčné stěny *Saccharomyces cerevisiae* (pekařské kvasnice). Tyto částice jsou použity jako nosiče pro enkapsulaci a amorfizaci nerozpustných nebo ve vodě špatně rozpustných léčiv. Amorfní formulace obecně vykazují rychlejší rychlosti rozpouštění a v důsledku toho zlepšenou biologickou dostupnost léčiva. Kompozity glukanových částic a léčiva se připravují sprejovým sušením, což je technika, která přináší řadu dalších výhod.

Výhody technologie jsou:

- Je možné vyrábět zcela amorfní kompozity s vysokou účinností enkapsulace a vykazující rychlejší kinetiku rozpouštění účinné látky.
- Kompozity mohou vykazovat různé stupně krystalinity v závislosti na parametrech sprejového sušení a v důsledku toho lze řídit kinetiku rozpouštění.
- Sprejové sušení je snadno škálovatelná a široce používaná technika a podporuje zlepšení i dalších vlastností kompozitu (např. dispergovatelnost).
- Kompozity připravené touto technologií vykazují velikost částic příznivou pro fagocytózu, na rozdíl například od beta glukanových částic rozprašovaných z vody.
- Kompozity vykazují lepší dispergovatelnost, což přispívá k lepší kinetice rozpouštění enkapsulované účinné látky a díky tomu je technologie vhodná také pro formulace různých dalších forem, jako jsou gely a krémy.
- Kompozity vykazují lepší tokové vlastnosti, což umožňuje snadnější zpracovatelnost s použitím méně pomocných látek. To vede k nižším výrobním nákladům (všestrannost formulace).
- Je možné enkapsulovat 2 nebo více různých účinných látek a také vytvářet kompozity s použitím různých rozpouštědel a jejich kombinací.

KOMERČNÍ VYUŽITÍ

Vyvinuli jsme technologii, jak pomocí sprejového sušení připravovat kompozity glukanových částic a špatně rozpustných léčiv. Kompozity vykazují zlepšené vlastnosti, jako je rychlejší kinetika rozpouštění účinné látky, zlepšená dispergovatelnost a tokové vlastnosti. Dosud jsme testovali kompozity glukanových částic s ibuprofenem, kurkuminem, atorvastatinem, diplakonem, artemisininem, morusinem, epigalokatechin galátem, resveratrolem, kyselinou acetylsalicylovou, nilotinibem, kyselinou ellagovou, kyselinou acetylboswellovou a amlodipinem. V současné době hledáme obchodního partnera, který by se zajímal o společné komerční využití této technologie.

STATUS IP OCHRANY

Český patent podán 2019, udělen 05/2020.
Mezinárodní patentová přihláška podána 04/2020.

FÁZE VÝVOJE TECHNOLOGIE

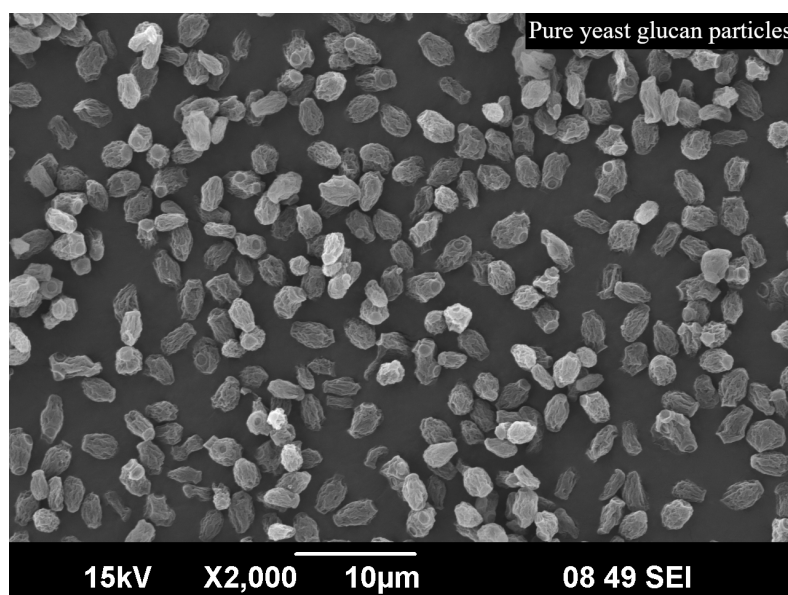
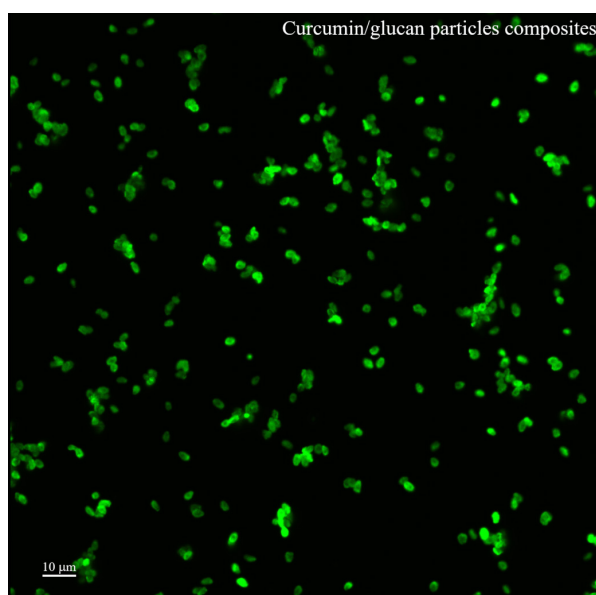
Fáze 2

Odpovídá TRL 3 a TRL 4

Výzkum proveditelnosti. Dochází k reálnému návrhu technologie a k prvotním testům v laboratoři vedoucím k upřesnění požadavků na technologii a jejích schopnostech.

- **TRL 3** představuje ucelenou představu na technologii s návrhem konkrétních kroků, testů a experimentů, které bude třeba uskutečnit, aby se ověřilo, že je nápad reálný
- **TRL 4** je ověření funkčnosti v laboratoři. Výsledkem TRL 4 představuje tzv. Proof-of-Concept. Technologie je tedy navržena a je ověřena její funkčnost v omezených podmínkách

ILUSTRÁČNÍ OBRÁZKY



DALŠÍ INFORMACE

Ruphuy G., Saloň I., Tomas J., Šalamúnová P., Hanuš J., Štěpánek F., “Encapsulation of poorly soluble drugs in yeast glucan particles by spray drying improves dispersion and dissolution properties”, Int. J. Pharm. 576, 118990 (2020)