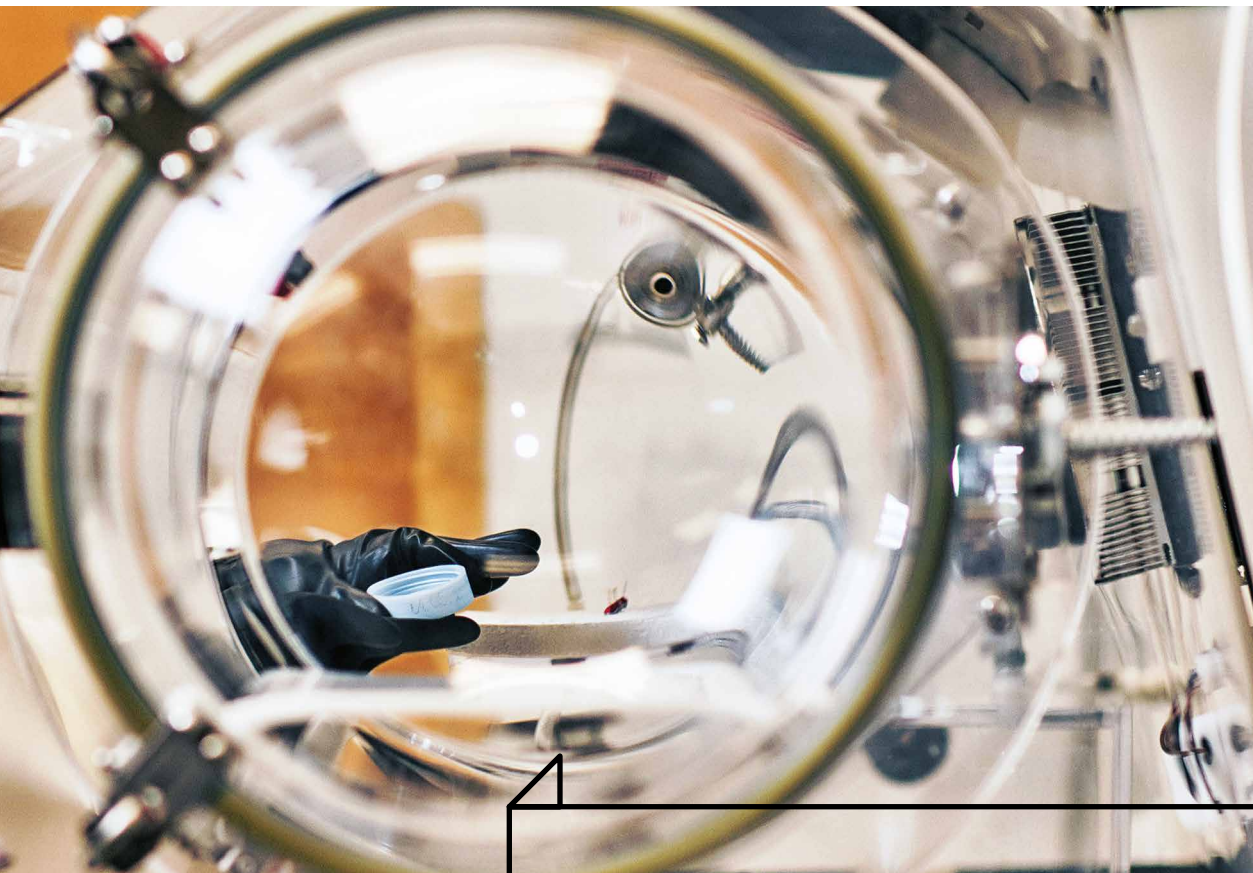




REWOLUCJONIZOWANIE BRANŻY FARMACEUTYCZNEJ



fot. Szymon Nawrat

Szacuje się, że ponad 40% substancji leczniczych dostępnych w aptekach oraz ponad 90% nowych leków charakteryzuje się słabą rozpuszczalnością w wodzie. Oznacza to, że znaczna ich część nie będzie przyswajana przez organizm pacjenta. W efekcie musi on przyjmować silniejsze dawki farmaceutyków, a substancje niewchłonięte zostaną wydalone do środowiska, zwiększając poziom jego zanieczyszczenia.

Związki, o których mowa, występują w tabletkach w postaci krystalicznej i to ona jest głównym czynnikiem ograniczającym proces ich wchłaniania. W związku z tym naukowcy poszukują alternatywnych rozwiązań. Interesującą propozycję stanowią substancje aktywne w postaci amorficznej. Mówi się o nich, że są nadzieją współczesnej farmacji. Charakteryzują się dobrą rozpuszczalnością w wodzie oraz wysoką przenikalnością przez błony komórkowe. Tak zaprojektowane leki będą działać szybciej i skuteczniej w mniejszych dawkach, co ma kluczowe znaczenie dla zdrowia pacjentów. Jest więc o co walczyć.

Substancje w fazie amorficznej wykazują ciekawe właściwości, które sytuują je gdzieś pomiędzy ciałami stałymi a cieciami. Wyobraźmy sobie, że obniżamy temperaturę „klasycznej” cieczy. Gdy zbliżymy się do właściwej jej temperatury krzepnięcia, rozpocznie się proces krystalizacji. Otrzymana w ten sposób struktura to sieć uporządkowanych cząsteczek. Istnieją jednak pewne związki, które, mimo iż utrzymane są w temperaturze poniżej granicy krzepnięcia, nie ulegają krystalizacji. Ich nieuporządkowana struktura pozostaje właściwa ciecicom. Znajdują się wówczas w fazie amorficznej, przypominając miód – gęsty, lepki, w którym cząsteczki poruszają się wolniej. Typowym przykładem takiego związku jest szkło, nazywane czasem zamrożoną cieczą.

– Wyobraźmy sobie, że patrzymy na zdjęcie struktury zwykłej cieczy. Mielibyśmy przed sobą pewien chaotyczny układ atomów. Takie samo zdjęcie cieczy w odpowiednio niskiej temperaturze poniżej progu zeszklenia również da nam obraz nieuporządkowanych atomów. Oko przeciętnego obserwatora nie dostrzeże różnicy, a przecież mamy przed sobą dwa różne stany skupienia! – mówi fizyk prof. dr hab. Marian Paluch z Uniwersytetu Śląskiego,

k który od wielu lat zajmuje się badaniem właściwości struktur amorficznych i ich wykorzystaniem w przemyśle farmaceutycznym.

Niezwykle interesujący jest także ruch molekuł w takiej fazie. Prof. Marian Paluch porównuje go do tokijskiego metra w godzinach szczytu. Ludzie wciąż przybywają, zmęczeni pracą, pragnący jak najszybciej dotrzeć do domu. Zaczynają jednak zwalniać w rosnącym tłumie, choć ich ruch wciąż przecież jest możliwy. Muszą jednak wcześniej zaplanować swoją ścieżkę, nie przemieszczają się swobodnie, lecz uwzględniają obecność każdego ze swoich sąsiadów. Ruch ten ma więc charakter kolektywny: moje działanie nie zależy już tylko ode mnie, lecz przede wszystkim od możliwości, jakie daje mi otoczenie. W procesie przechładzania cieczy molekuły zaczynają się poruszać w podobny sposób. Nie obserwujemy tego ani w klasycznych ciecicach, ani w kryształach.

Wiadomo już, że substancje aktywne w fazie amorficznej są lepiej przyswajalne i charakteryzują się wysoką przenikalnością przez błony komórkowe. Ich zastosowanie w branży farmaceutycznej wiąże się jednak z wieloma wyzwaniami. Po pierwsze, nie wszystkie związki można łatwo przekształcać do postaci amorficznej. Proces ten wymaga niejednokrotnie skomplikowanej aparatury i odkrywania nowych metod konwertowania.

Po drugie, istnieje wiele czynników determinujących fizyczną stabilność formy amorficznej, która musi być utrzymana co najmniej w okresie ważności leku.

Po trzecie, właściwości substancji w fazie amorficznej zmieniają się z czasem, dlatego naukowcy badają te zmiany i przebieg całego procesu.

Prof. Marian Paluch podkreśla jednak,

że współpracujący z nim naukowcy znaleźli już kilka interesujących rozwiązań stanowiących odpowiedź na każde z powyższych wyzwań.

– Mamy jedno z najlepszych laboratoriów na świecie do prowadzenia badań w warunkach wysokiego ciśnienia. Co więcej, brałem udział w konstruowaniu podobnych stanowisk w wielu jednostkach badawczych w Europie, Azji i Ameryce Północnej. Opracowaliśmy również różne metody stabilizowania całego układu, aby utrzymać i kontrolować właściwości substancji w fazie amorficznej. To przybliży nas do wprowadzenia leków amorficznych na rynek. Jesteśmy otwarci zarówno na współpracę z innymi ośrodkami naukowymi, jak również z przedstawicielami przemysłu farmaceutycznego – deklaruje naukowiec z Uniwersytetu Śląskiego.



fot. Szymon Nawrat