



BIURO WSPÓŁPRACY
Z GOSPODARKĄ

12.

SPOSÓB
OTRZYMYWANIA
AMORFICZNEGO
INDAPAMIDU

SPOSÓB OTRZYMYWANIA AMORFICZNEGO INDAPAMIDU

SPOSÓB OTRZYMYWANIA AMORFICZNEGO INDAPAMIDU STOSOWANEGO JAKO LEK MOCZOPĘDNY, A TAKŻE OBNIŻAJĄCY CIŚNIENIE TĘTNICZE, JEST ODPOWIEDZIĄ NA POTRZEBY RYNKU FARMACEUTYCZNEGO, ZWIĄZANE Z BIODOSTĘPNOŚCIĄ I AKTYWNOŚCIĄ FARMAKOLOGICZNĄ LEKARSTW.

STAN OBECNY

Indapamid należy do grupy leków moczopędnych, działających na kanałik kręty drugiego rzędu. Poza działaniem moczopędnym indapamid jest lekiem rozkurczającym naczynia krwionośne, powodując tym samym obniżenie oporów naczyniowych, czyli ciśnienia tętniczego krwi. Indapamid dostępny obecnie na rynku, podawany jest w dawce 1.5 mg na dobę w formie tabletek, działa przy tym bardzo słabo moczopędnie. Powodem jest jego słaba rozpuszczalność (75 mg/l). Polepszenie rozpuszczalności poprzez amorfizację, a w konsekwencji lepszą biodostępność i aktywność farmakologiczną indapamidu do tej pory nie zostało opracowane.

NOWE PODEJŚCIE

Skuteczne a jednocześnie bezpieczne otrzymanie stabilnej formy amorficznego indapamidu udało się osiągnąć dzięki zastosowaniu innowacyjnej metody otrzymywania leku. Uzyskany materiał poddany został analizie fizykochemicznej mającej na celu potwierdzenie jego amorficzności, określeniu wartości temperatury zeszklenia oraz oznaczeniu zawartości wody. Została również zbadana stabilność otrzymanej formy amorficznej. Poprawa dostępności biologicznej po podaniu doustnym słabo rozpuszczalnych w wodzie substancji leczniczych pozostaje jednym z najważniejszych aspektów badań rozwojowych nad postacią leku. Produkcja stałych form leków – tabletek i kapsułek, w których substancja lecznicza występuje w formie amorficznej stanowi jedno z ważniejszych zadań, jakie stawia przed sobą nowoczesny przemysł farmaceutyczny. Powodem tego są najnowsze doniesienia naukowe, które pokazują, że amorfizacja substancji leczniczej, umożliwiła znaczną poprawę jej rozpuszczalności. Dodatkowo reaktywność chemiczna substancji leczniczej jest również większa, co daje możliwość stosowania mniejszych dawek leku. Skraca się również czas wchłaniania lekarstwa z przewodu pokarmowego, co stanowi szczególną korzyść w przypadku leków przeciwbólowych.

OBSZARY ZASTOSOWANIA

Wynalazek w postaci sposobu otrzymywania amorficznego indapamidu może znaleźć zastosowanie w medycynie i przemyśle



ZALETY ROZWIĄZANIA:

Przedstawiona metoda otrzymywania amorficznej formy indapamidu posiada wiele zalet, spośród których najważniejsze to:

- brak konieczności użycia dodatkowych rozpuszczalników, jak w przypadku amorfizacji metodą liofilizacji;
- w odróżnieniu od wityfikacji mielenie kriogeniczne nie prowadzi do termicznej degradacji leku – całkowicie bezpieczna metoda amorfizacji indapamidu;
- wysoka stabilność fizykochemiczna (nawet kilka miesięcy) i czystość;
- zwiększona rozpuszczalność formy amorficznej w porównaniu z substancją krystaliczną. Dzięki temu możliwe będzie zmniejszenie dawki przyjmowanego leku, bądź też uzyskanie lepszego efektu terapeutycznego i ewentualne ograniczenie efektów ubocznych przy zachowaniu dotychczas stosowanych dawek indapamidu.

farmaceutycznym zwłaszcza jako bardziej biodostępne i aktywniejsze farmakologicznie lekarstwo.

TWÓRCY

M. Paluch, Ż. Wojnarowska, K. Grzybowska, Ł. Hawetek, W. Sawicki, T. Bączek, K. Pieńkowska.

OCHRONA PATENTOWA

Sposób otrzymywania amorficznego indapamidu został zgłoszony jako wynalazek do Urzędu Patentowego RP w dniu 16.09.2011 r. roku pod numerem P.396354 w celu zapewnienia ochrony patentowej.

DANE KONTAKTOWE

Biuro Współpracy z Gospodarką
tel. +48 32 359 22 71
e-mail: transfer@us.edu.pl
www.transfer.us.edu.pl