

Samoemulgująca kompozycja farmaceutyczna w postaci ciekłej zawierająca jako substancję aktywną substancję leczniczą nietrwałą w środowisku wodnym



www.mug.edu.pl

Innowacyjna technologia farmaceutyczna umożliwiająca produkcję płynnej formy leku, gotowej do użycia, w przypadku substancji leczniczych nietrwałych w środowisku wodnym i wymagających przygotowania roztworu ex tempore z proszku, np. w przypadku niektórych antybiotyków czy cytostatyków. Opracowana kompozycja w formie samoemulgującego nośnika (SEDDS) po kontakcie z wodą in vivo tworzy emulsję, zapewniając wysoką biodostępność i dobrą tolerancję przez pacjentów. Rozwiązanie otwiera nowe możliwości dla rozwoju preparatów okulistycznych, doustnych i pozajelitowych.

Twórcy: prof. dr hab. Małgorzata Sznitowska, Aleksandra Sych, prof. dr hab. Tomasz Bączek, Katarzyna Krzemińska

Proponowane rozwiązanie

Kompozycja to stabilny nośnik dla substancji leczniczych rozpuszczalnych w wodzie, lecz nietrwałych w roztworach wodnych (np. antybiotyków, leków przeciwgrzybiczych, cytostatyków, białek, peptydów czy kwasów nukleinowych). Kluczową innowacją jest zastosowanie układu **SEDDS** (Self-Emulsifying Drug Delivery System) opartego na mieszaninie oleju i niewielkiej ilości surfaktanta, w którym hydrofilowa substancja czynna występuje w formie zawiesiny. Po aplikacji i kontakcie z płynami fizjologicznymi (np. łzami, sokami trawiennymi) preparat samoistnie tworzy emulsję olej/woda, a substancja aktywna szybko rozpuszcza się i osiąga wysokie stężenie w miejscu działania.

Kompozycja składa się z trzech kluczowych komponentów w ściśle określonych proporcjach wagowych:

- **Substancja aktywna** (0,5-10% wag.): Jest substancją rozpuszczalną w wodzie, lecz nietrwałą w tym środowisku, jak np. antybiotyki (wankomycyna, cefuroksym), witaminy (kwas askorbowy), peptydy czy białka.
- **Olej** (84-99% wag.): Stanowi fazę rozpraszającą, w której substancja aktywna jest zawieszona. Wynalazek dopuszcza stosowanie różnych olejów, np. naturalnych (olej sojowy, arachidowy), półsyntetycznych (olej MCT, olej rycynowy), mineralnych czy silikonowych.
- **Surfaktant** (0,5-6% wag.): Kluczowy składnik odpowiadający za proces samoemulgowania. Przykłady surfaktantów to polisorbaty, estry kwasów tłuszczowych z sorbitanem (np. Span 80) czy poloksamery.

Opracowane rozwiązanie nie wymaga wysokich stężeń surfaktantów ani kosurfaktantów, co zwiększa bezpieczeństwo i poprawia tolerancję, zwłaszcza w zastosowaniach okulistycznych. Preparat w swojej podstawowej formie jest **bezwodną zawiesiną**, co zapewnia długoterminową stabilność chemiczną substancji aktywnej.

Status własności intelektualnej:

- Patent PCT
- Patent UPRP

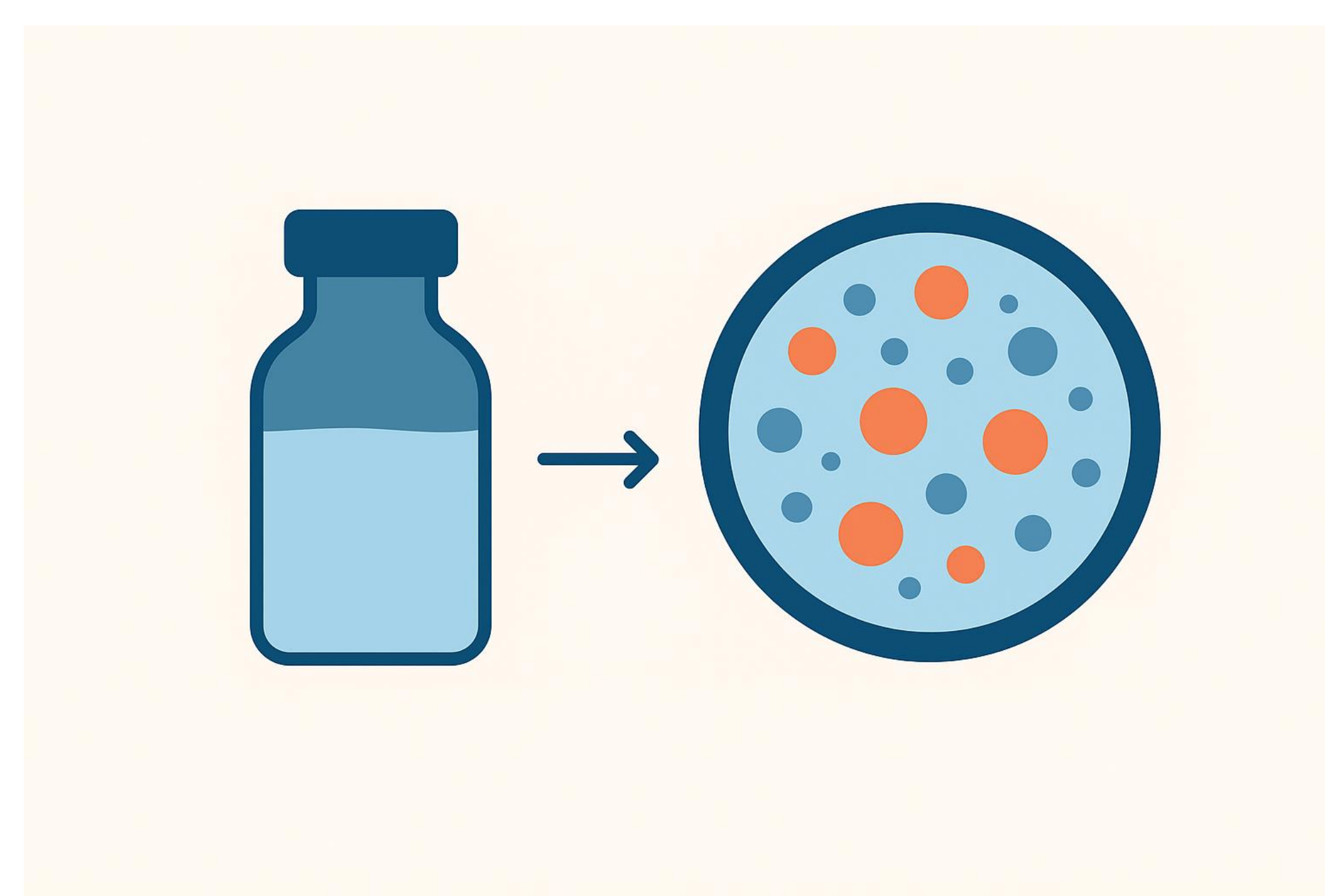
Zastosowanie rynkowe:

- Przemysł farmaceutyczny

Technology Readiness Level 3

Przewagi konkurencyjne

- **Zwiększona stabilność chemiczna:** Bezwodna formuła chroni substancje aktywne nietrwałe w wodzie przed hydrolizą i rozkładem. To kluczowa przewaga nad tradycyjnymi roztworami, które często wymagają przygotowania ex tempore, co jest niepraktyczne dla pacjenta.
- **Wysoka tolerancja i komfort stosowania:** W przeciwieństwie do czystych roztworów olejowych, które zaburzają widzenie lub są nieprzyjemne w smaku, nasz preparat, dzięki procesowi emulgowania, jest doskonale tolerowany. Badania in vivo w przypadku kropli do oczu wykazały brak lub tylko minimalne i przejściowe działanie drażniące.
- **Wszelstronność zastosowania:** Wynalazek umożliwia dostarczanie leków różnymi drogami (do oka, doustnie, na błony śluzowe, pozajelitowo), wszędzie tam, gdzie nośnik ma kontakt z płynami ustrojowymi. To otwiera szerokie perspektywy dla wielu grup leków.
- **Ułatwiona rejestracja leku:** Prosty skład. Substancje lecznicze o ugruntowanym zastosowaniu w lecznictwie. Użyte substancje pomocnicze są powszechnie stosowane do celów farmaceutycznych i są dostępne w jakości farmakopealnej.
- **Prosta produkcja:** Sposób wytwarzania preparatu jest nieskomplikowany, oparty na standardowych metodach farmaceutycznych, takich jak mieszanie i homogenizacja, co obniża koszty i ułatwia skalowanie produkcji.
- **Optymalna biodostępność:** Dzięki procesowi rozpuszczania substancji w płynach ustrojowych w miejscu docelowego działania, preparat zapewnia efektywne wchłanianie i wysoką skuteczność terapeutyczną, bez ryzyka utraty aktywności leku.
- **Eliminacja dodatkowych składników:** Kompozycja nie wymaga stosowania kosurfaktantów (w przeciwieństwie do SMEDDS), co zmniejsza ryzyko podrażnień. Minimalna ilość surfaktanta zapewnia skuteczne emulgowanie, jednocześnie nie wywołując niepożądanych efektów.



Centrum Transferu Technologii

Gdański Uniwersytet Medyczny

Dębinki 7, budynek nr 5, I piętro, 80-952 Gdańsk, (58) 349 10 09,

ctt@gumed.edu.pl

<https://ctt.gumed.edu.pl/>