

PORINHALÁCIÓS GYÓGYSZERKÉSZÍTMÉNYEK FORMULÁLÁSÁNAK TECHNOLÓGIAI ASPEKTUSAI

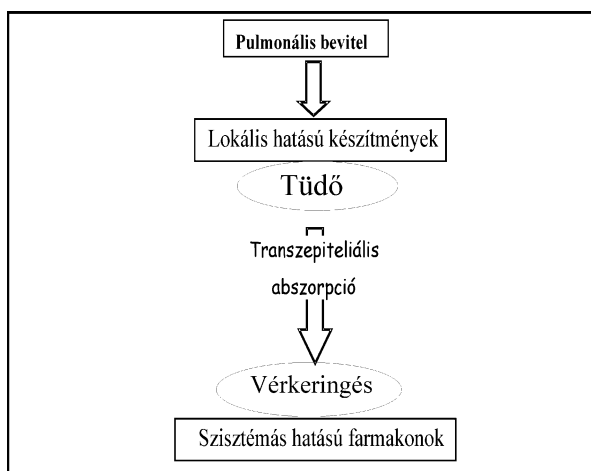
Ambrus Rita¹, Pomázi Anita² és Szabóné Révész Piroska¹

¹ Szegedi Tudományegyetem, Gyógyszertechnológiai Intézet,
6720 Szeged, Eötvös u. 6., E-mail: arita@pharm.u-szeged.hu

² Partner Gyógyszertár, 6000 Kecskemét, Piaristák tere 7

Bevezetés

Az inhalációs gyógyszerformák előállítása a gyógyszertechnológiai fejlesztések fontos feladatai közé tartozik, ugyanis az optimálisan formulált készítményekkel a terápiás célnak megfelelően mind lokális, mind szisztémás hatás elérhető (1. ábra). Az utóbbi időben leginkább a porinhalációs rendszerek (Dry Powder Inhaler: *DPI*) térhódítása figyelhető meg, kiemelkedő stabilitásuk, kedvező előállítási költségük, valamint az egyszerű alkalmazhatóságuk miatt. Ebből adódóan a hordozó rendszerek fejlesztése kitüntetett helyet foglal el a készítmények tervezése során. A korszerű technológiai megoldások és a segédanyagok lehetőséget adnak új típusú hatóanyag hordozó rendszerek fejlesztésére, ami megnövelheti a készítmény kitapadását a tüdő adott szegmensében, ezzel növelve a biológiai hatékonyságot, s csökkentve a mellékhatást. Az előadás keretében a DPI készítmények formulálási lehetőségeit és a fejlesztés első lépéseit mutatjuk be



1. ábra. Pulmonális beviteli kapun keresztüli lokális és szisztémás hatás kiváltása

DPI formulálási lehetőségek, kritériumok és alkalmazható segédanyagok

A porinhalációs készítmények tervezése során 4 lehetőség adódik:

- hatóanyag fizikai-kémiai sajátságainak módosítása, hordozó és segédanyagok alkalmazása nélkül,
- hatóanyag-segédanyag kombináció,
- hatóanyag hordozó alapú formulálása,
- hatóanyag-segédanyag-hordozó összetett rendszer előállítása.

Közös sajátságuk, hogy a szemcsehalmozat a belélegzés energiája egyedi részecskékre bontja, melyek a DPI szemcseméret követelményeinek megfelelnek.

A fejlesztés során az egyik legfontosabb szempont a megfelelő segédanyag körültekintő megválasztása. Az alkalmazástól függően ugyanis többféle funkciót is betölthetnek a formulálás, az alkalmazás, valamint a tárolás során:

- a hatóanyagot bevonja, ezzel védi a készítményt: az aggregációtól, a nedvesség felvételtől.
- a hidrophil karakterű anyagok a hatóanyag gyors kioldását biztosítják;
- a mukoadhezív anyagok a mucinhoz, a tüdőepithél sejteket borító folyadékhoz való kiapadást segítik elő.

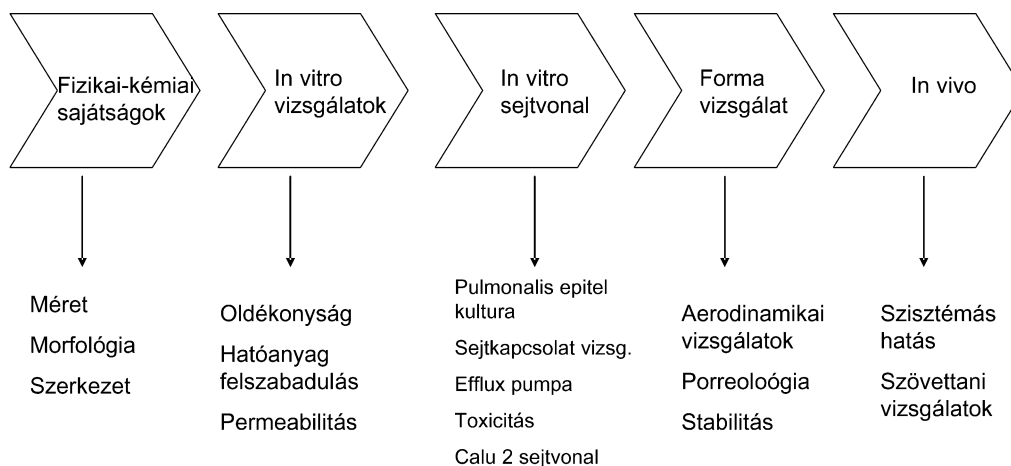
A hordozó szerepe is sokrétű a DPI-ek formulálásakor:

- töltőanyag a kis mennyiségben alkalmazott hatóanyag mellett,
- a hatóanyagot a felületre kötve meggátolja annak összetapadását,
- a készítmény porkapszulába való töltését is elősegíti.

A formával szemben támasztott követelmények közül kiemelendő a méret, méreteloszlás és a megfelelő aerodinamikai tulajdonságok.

DPI készítmények preformulációs és formavizsgálatai

Az SZTE Gyógyszertechnológiai Intézet „Nanotechnológiai” kutatócsoportjának tagjai a pulmonális alkalmazási utat vizsgálják, elsősorban DPI fejlesztésével. Célunk olyan mikrokompozitok előállítása, amelyek a hatóanyagot nano/mikrokristályos formában tartalmazzák. Az előadás keretében mutatjuk be azokat a vizsgálatokat, amelyekkel fizikai-kémiai és biofarmáciai szempontok alapján jellemezhetjük a pulmonáris formákat (2. ábra).



2. ábra. Porinhalációs készítmények vizsgálati protokollja

Köszönetnyilvánítás

A kutatás a Bolyai János kutatási ösztöndíj (2014-2017) támogatásával valósult meg.

Irodalom

- Pomázi, A., Ambrus, R., Szabó-Révész, P. 2014. Physicochemical stability and aerosolization performance of mannitol-based microcomposites. *J. Drug Deliv. Sci. Techn.*, 24, 397-403.
- Pomázi, A., Chvatal, A., Ambrus, R., Szabóné Révész P., 2014. Porinhalációs készítmények formulálásának lehetőségei és gyógyszerforma vizsgálata. *Gyógyszerészet*, 58, 1-9.