

АЭРОГЕЛИ — НОВОЕ СЛОВО В НАУКЕ И ФАРМАЦЕВТИКЕ

■ Н.В. Меньшутина,
 ■ Д.Д. Ловская,
 ■ Е.А. Лебедев

Российско-Швейцарский центр трансфера фармацевтических и биотехнологий

В настоящее время особое внимание уделяется развитию фармацевтической отрасли в России. Основная задача на данном этапе – это переход фармацевтической и медицинской промышленности на новый, более высокий уровень, который может быть достигнут внедрением на рынок собственных инновационных разработок в области лекарственных средств. Не секрет, что на данный момент российский фармацевтический рынок импортно-ориентирован и большую часть российского фармацевтического рынка составляют дженерики. Это связано с тем, что в нашей стране почти не производятся оригинальные препараты в силу больших затрат на доклинические и клинические исследования. Аэрогели – это новый класс веществ, которые могут быть использованы в качестве матриц-носителей активных фармацевтических ингредиентов, а это значит, что с их помощью возможно создание новых улучшенных лекарственных форм, которые смогут составить здоровую конкуренцию импортным лекарствам. Уникальность аэрогеля в том, что в него можно инкапсулировать множество различных веществ, начиная от против аллергенных веществ, заканчивая цитотоксическими веществами. Это открывает двери для множества направлений.

Аэрогель представляет собой макроскопический кластер, который состоит из микро- и наночастиц. Важно отметить, что возможно получение как монолитов аэрогелей, так и частиц. Размер частиц аэрогеля можно варьировать от 200 нм до 50 мкм. Уникальность аэрогеля заключается еще и в том, что при высокой пористости (вплоть до 99%) площадь удельной поверхности аэрогеля также очень высока и может варьироваться от 500 м²/г до 1500 м²/г. При этом диаметр пор составляет от 4 до 10 нм. Эти характеристики позволяют использовать аэрогели в качестве носителей для лекарственных веществ. Важно отметить, что аэрогели на основе органических веществ являются биодоступными и биodeградируемыми, что обеспечивает безопасность получаемых лекарственных форм.

Аэрогели получают путем сверхкритической сушки в установке реактора высокого давления (рис. 2). Температура процесса



Рис. 1. Монолит аэрогеля на основе диоксида кремния

может варьироваться от 40 до 100°C, а давление от 120 до 200 атм. Структура и физико-химические свойства аэрогелей напрямую зависят от условий проведения каждой стадии, от выбранных прекурсоров, растворителей и катализаторов.

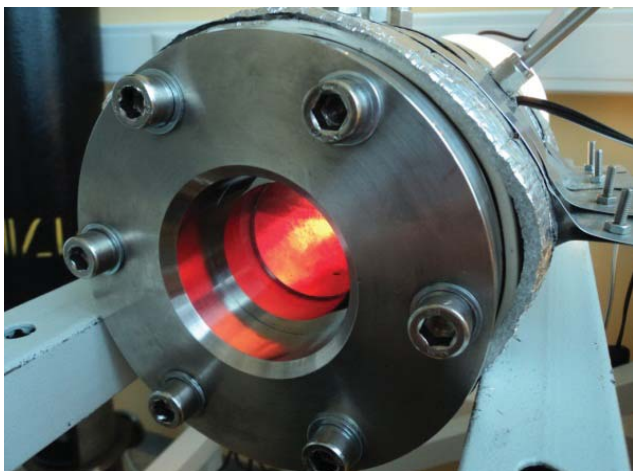


Рис.2. Внешний вид сверхкритического реактора

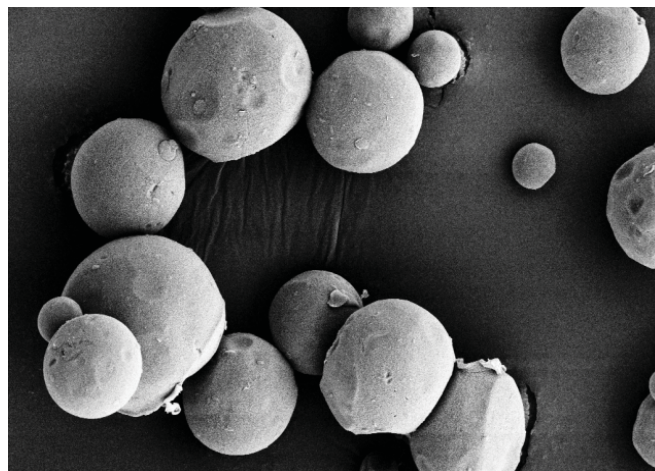


Рис. 3. Фотография сканирующей электронной микроскопии частиц аэрогеля на основе альгината

Загрузка активных фармацевтических ингредиентов осуществляется путем сверхкритической адсорбции в том же реакторе высокого давления. Степень адсорбции зависит в первую очередь, от растворимости активного вещества в сверхкритическом флюиде. Немало важна и степень сродства активного вещества к матрице аэрогеля. Наиболее перспективной задачей является изготовление лекарственных форм на основе органических полисахаридных аэрогелей. Создание полисахаридных аэрогелей отвечает современным требованиям и уровню развития науки, а также основной плюс – это относительно низкая стоимость прекурсоров. На данный момент описан широкий спектр полисахаридов с различными функциональными группами (карбоксильная – пектин, сульфониевая – каррагенан, гидроксильная – формы агара) и ионическими группами (анион – альгинат, катион – хитозан, не ионическая - крахмал) – все это можно считать отправной точкой для развития и создания аэрогельных матриц с заданными свойствами. Создание материалов с заданными характеристиками из биodeградируемых и биосовместимых прекурсоров является очень привлекательной и перспективной задачей.

Инкапсуляция активных веществ в аэрогели улучшает их фармакокинетические свойства. Экспериментально доказано, что растворимость активных веществ возрастает после адсорбции в аэрогель. Это объясняется тем, что активное вещество адсорбируется не в кристаллической, а в аморфной форме. Таким образом, мы получаем безопасную лекарственную форму,

которая может обеспечить быстрый терапевтический эффект. Создание пролонгированной лекарственной формы также возможно, благодаря разнообразию свойств органических соединений. В настоящее время в нашем центре ведутся работы по созданию органических аэрогелей на основе крахмала, хитозана и альгината натрия (рис.1). Вышеперечисленные полисахариды являются нетоксичными, биоразлагаемыми и безопасными для человека, что делает их идеальными материалами для использования в качестве матриц-носителей.

Были проведены исследования по адсорбции активных веществ лоратадина (блокатор H1-гистаминовых рецепторов) и ибупрофена (нестероидный противовоспалительный препарат). Начаты доклинические исследования на лабораторных мышцах. Полученные результаты доказывают эффективность изготовленных лекарственных форм.

На данный момент во всем мире учеными ведутся работы по созданию лекарственных форм с использованием аэрогелей для создания мазей, порошков для ингаляций, а также создания лекарственных форм в капсулах. Использование аэрогелей для ингаляций может обеспечить быструю доставку в легкие через кровоток с сопутствующим терапевтическим эффектом. Возможно использовать аэрогели для регенеративной медицины, так как в порах аэрогеля можно создать комфортную среду для выращивания клеток ткани. Таким образом, аэрогели можно назвать перспективными материалами для использования в фармацевтической промышленности.