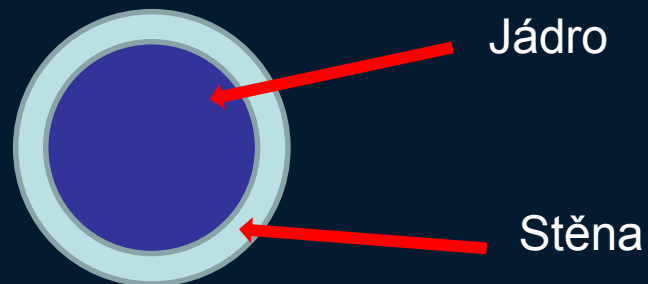


Mikročástice jako léková forma

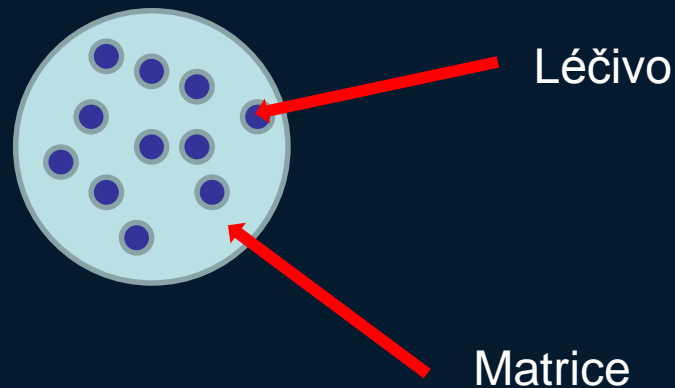
Co jsou to mikročástice?

- Sférické částice o velikosti 1-1000 μm

- Mikrokapsle



- Mikrosféry



Historie

- 1929 B. de Jong: enkapsulace látek do koacervátů
- 1955 B. K. Green: mikroenkapsulace procesem fázové separace-koacervace
- 1989 Lupron Depot®: první registrovaný přípravek na bázi mikročástic

Metody přípravy

- Chemické
 - Koacervace
 - Polymerizace
 - Polykondenzace
 - Iontová gelace

Metody přípravy

- Fyzikálně-mechanické
 - Extruze a sferonizace
 - Sprejové sušení a chlazení
 - Fluidní obalování
 - Odpaření rozpouštědla

Benefity

- Řízené uvolňování
- Snížení nežádoucích účinků
- Maskování chuti
- Ochrana léčiva
- Snížení dávky a frekvence užívání

Potenciální nevýhody

- Parenterální přípravky – suché suspenze
- Degradace léčiva pomocnými látkami
- Odpadní organická rozpouštědla
- Cena

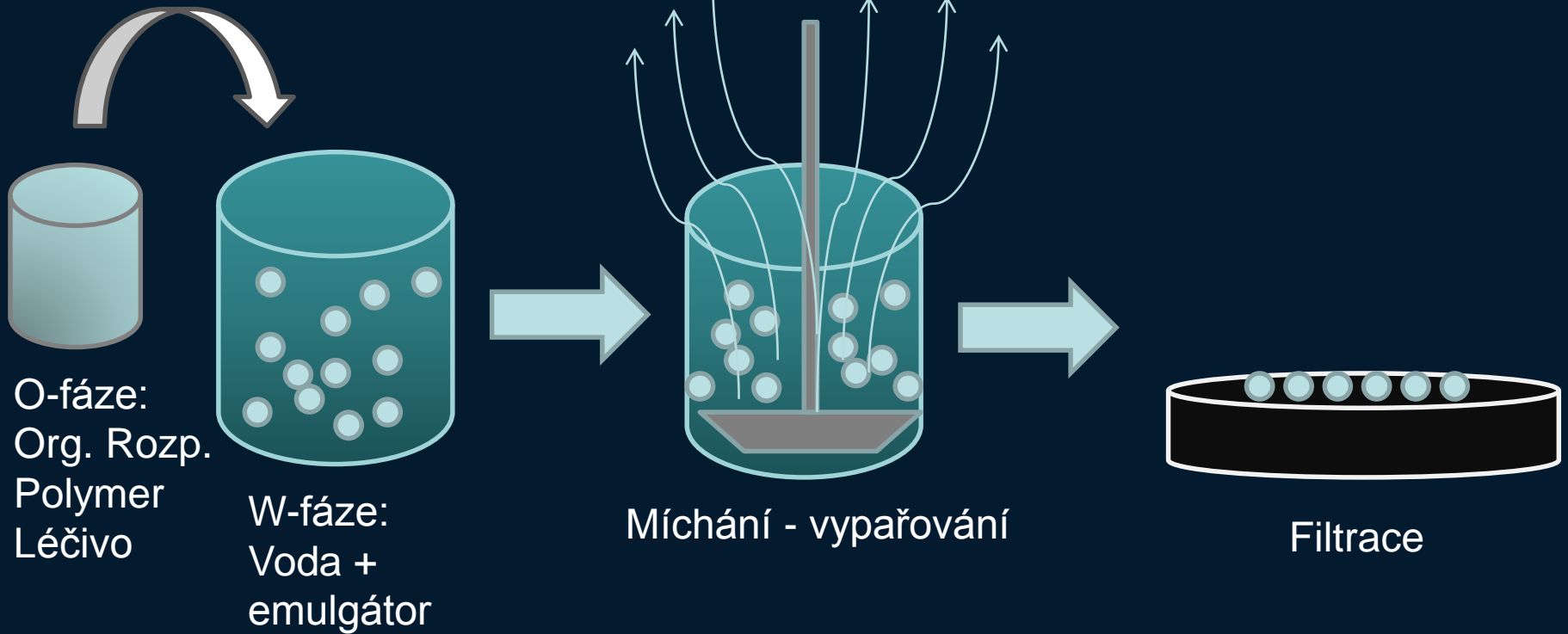
Farmaceutické přípravky

- Lupron Depot[®] - leuprorelin
- Decapeptyl Depot[®] - triptorelin
- Sandostatin LAR[®] - octreotid
- Parlodel LAR[®] - bromocriptine



Metoda odpaření rozpouštědla

Princip



Modifikace

- O/W
 - 1979; první modifikace
 - Enkapsulace prakticky nerozpustných léčiv
- W/O/W
 - Enkapsulace léčiv rozpustných ve vodě
 - O-fáze přestupová bariéra

Modifikace

- O/O
 - Hydrofilní léčiva
- O/W/O
 - Prakticky ve vodě nerozpustná léčiva
- W/O/O
 - Hydrofilní léčiva
- W/O/O
 - Emulze W/O v matrici – multifazické mikročástice

Pomocné látky

- Polymery
 - Polymléčná kyselina (PLA)
 - Kopolymer polymléčné a polyglykolové kyseliny (PLGA)
 - Poly(3-hydroxybutyrát) (PHB)
 - Poly- ϵ -caprolactone (PCL)

Pomocné látky

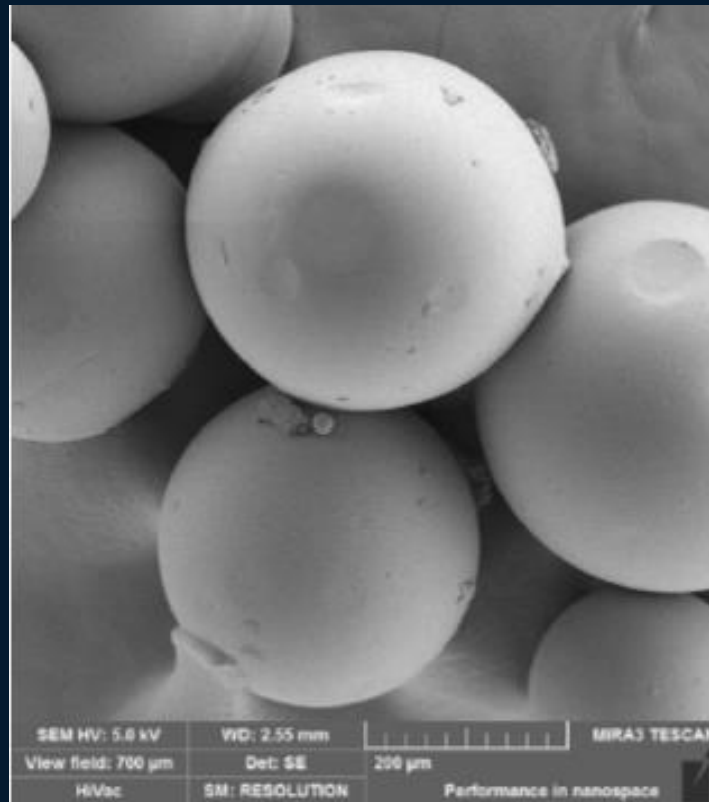
- Organické rozpouštědla
 - Chloroform
 - Dichlormethan
 - Ethyl acetát
 - Ethyl formát

Pomocné látky

- Emulgátory
 - Natrium oleát
 - Natrium dodecyl sulfát
 - Želatina
 - Polyvinylalkohol
 - Povidon

Foto

PLGA mikročástice s obsahem mirtazapinu



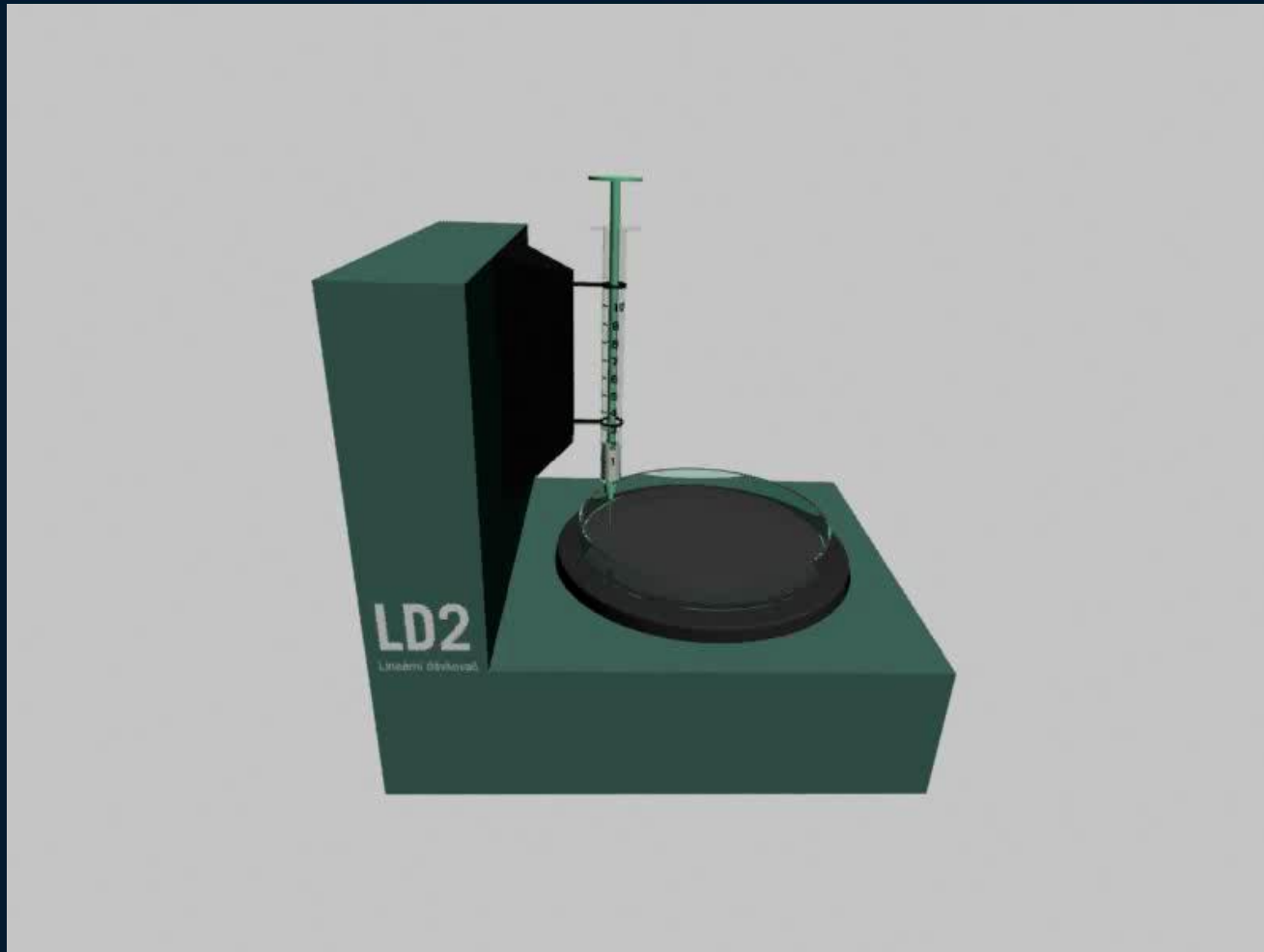
Vnější iontová gelace

Princip

- Síťovací metoda:

Schopnost polyelektrolytu (polymer) tvořit v přítomnosti opačně nabitých iontů gel

Princip



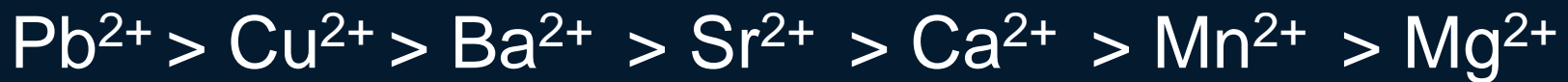
Pomocné látky

- Polymery
 - Alginát sodný
 - Chitosan
 - Karboxymethylcelulóza
 - Oxycelulóza
 - Karagenan

Pomocné látky

- Ionty

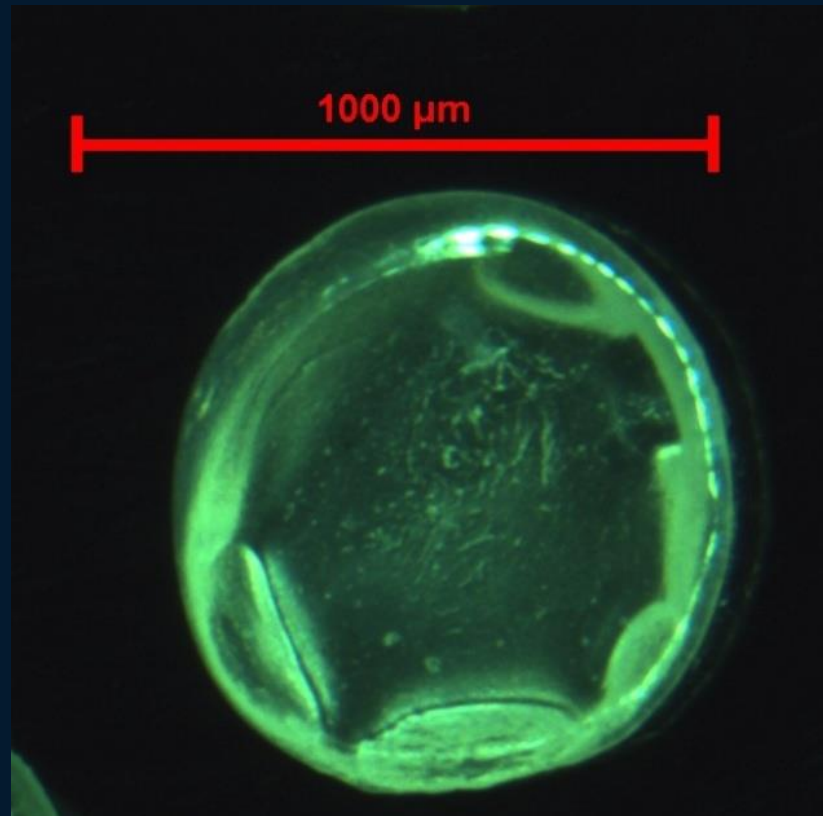
- např. afinitní řada pro alginát sodný:



- Al^{3+} , tripolyfosfát sodný

Foto

Alginátová mikročástice, Ca^{2+}



Konec?

Konec!