

YENİ İLAÇ TAŞIYICI SİSTEMLER VE İLAÇLARIN HEDEFLENDİRİLMESİ



İlaç Taşıyıcı Sistemler



- Kolloidal ilaç taşıyıcı sistemler
 - Veziküler sistemler
 - Mikro-/Nano-partiküler sistemler
- Hücresel ilaç taşıyıcı sistemler
 - Eritrositler
 - Plateletler
 - Lökositler
- Supramoleküler ilaç taşıyıcı sistemler
 - Miseller
 - Ters miseller
 - Karışık Miseller
 - Polimerik Miseller
 - Svı Kristaller
 - Dendrimerler
- Makromoleküler ilaç taşıyıcı sistemleri
 - Proteinler
 - Lipoproteinler
 - Glikoproteinler
 - Polimer konjugatları

Kolloidal İlaç Taşıyıcı Sistemler



MİKROPARTİKÜLER SİSTEMLER

- Mikroküreler
- Mikrokapsüller
- Magnetik Mikroküreler
- Albumin Mikroküreler
- Mikro/Nanosüngerler

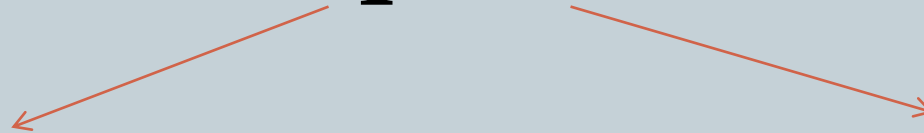
Mikropartiküller



- Hücre, doku ya da organa özgü özel ilaç taşıyıcı sistemlerin ilk örneklerdendir.
- Mikropartiküller sistemler, pasif ve aktif hedeflendirme ile istenen bölgede etkin maddenin toplanmasını ve orada etkin maddenin kontrol edilebilen bir hızla salınmasını sağlamaktadır.



Mikropartiküller



Mikroküreler

Mikrokapsüller

Mikrokapsüller



- Mikropartiküler sistemlerin ilki olarak kabul edilir.
- Katı, sıvı veya gaz formunda bir etkin maddenin inert, polimerik bir madde ile bir film halinde kaplanması ile elde edilir.
- Genellikle etkin madde “çekirdek” , kaplama maddesi “çeper” adını alır.
- Partikül boyutları 5-500 μm arasında değişir.

Mikrokapsüller



Çekirdek maddeler

- Katı, sıvı, gaz, süspansiyon, emülsiyon şeklinde olabilmektedir.
- Antibiotikler
- Analjezikler
- Antihistaminikler
- Vitaminler
- Kardiovasküler ilaçlar
- Sedatifler
- Proteinler
- Peptitler
- Hormonlar, enzimler

Mikrokapsüller



Çeper Maddeleri

- Doğal ve sentetik, hidrofilik ve hidrofobik özellikteki polimerler arasından seçilebilmektedir.

Doğal Polimerler	Sentetik polimerler
Albumin	Akrilik polimerler
Jelatin	Selüloz türevleri (EC, CMC, HPMC, MC)
Kitozan	PEG
Nişasta	PVP
Dekstran	PVA
Aljinat	Silikonlar

Mikrokapsüller



Mikrokapsüllerin Hazırlanma Amaçları

- Sıvıların kolay taşınmasını sağlamak için katı hale getirmek,
- Uçucu maddelerin buharlaşma kaybını önlemek,
- İstenmeyen tat ve kokuyu gizlemek,
- Geçimsizliği gidermek,
- Atmosfer koşullarından korumak,
- Stabilitayı artırmak,
- Kontrollü salım yapan sistemlerin hazırlanması.

Mikrokapsüller



Mikrokapsüllerin Hazırlama Yöntemleri

Kimyasal Hazırlama Yöntemleri	Fizikokimyasal Hazırlama yöntemleri	Mekanik Yöntemler
Yüzeylerarası polimerizasyon	Sulu çözücüden faz ayrışması (basit koaservasyon, kompleks koaservasyon)	Akışkanlaştırılan yatak (Wurster yöntemi)
İn-situ polimerizasyon	Organik çözücüden faz ayrımı	Püskürterek kurutma yöntemi
Delik yöntemi	Kompleks emülsiyon yöntemi	Vakumda kaplama
	Eriyebilir dispersiyon ve	Elektrostatik aerosol



MİKROKÜRELER

Mikroküreler



Mikroküreler içlerindeki etkin maddenin moleküler düzeyde ya da makroskopik partiküller halinde disperse edildiđi, birkaç μm 'den mm boyutlarına kadar deđişen çap dağılımına sahip farklı yapıdaki matrix maddelerinin kullanılması ile geliştirilen kolloidal ilaç taşıyıcı sistemlerdir.

Mikrokürelerin hazırlanmasında kullanılan polimerler



- Doğal matriks maddeleri:
 - *Lipitler,
 - *Aminopolisakkaritler,
 - *Proteinler,
 - *Karbonhidratlar,
- Sentetik matriks maddeleri:
 - *Biyolojik parçalanabilen sentetik polimerler
Polilaktik asit, polianhidritler, polistiren,
polikaprolakton , poli(aminoasitler)
 - *Biyolojik parçalanmayan sentetik polimerler
Polietilen, selüloz asetat, kopoli(etilen-vinil
asetat), silikon

Mikroküreler



- Hem oral, hem de parenteral yolla modifiye salım elde edilmesinde,
- i.m, i.p, s.c, perkütan, intra-artiküler, oftalmik veya nazal yol gibi bölgesel kontrollü etkin madde salımı,
- Etki yerine hedeflendirilme için kullanılırlar.

Mikrokürelerin hazırlama yöntemleri



- Çözücü buharlaştırma yöntemi
- Emülsiyon çözücü difüzyon yöntemi
- Polimerizasyon yöntemi
 - Süspansiyon polimerizasyon yöntemi
 - Emülsiyon polimerizasyon yöntemi
- Protein jelleştirme yöntemi
 - Isı ile denatürasyon
 - Kimyasal yolla çapraz bağ oluşturulması

Mikroküreler



Hedeflendirilmelerindeki Temel Amaç:

- İlaçların istenmeyen yan etkilerini azaltmak,
- İlaçların minimum dozda, maksimum biyoyararlanım sağlamak,

Mikroküreler



Hedeflendirilen mikrokürelerin temel özellikleri:

- ** Sadece istenen hedef dokuya veya organa özgü bir ilaç dağıtımına olanak sağlamalı,
- ** Kapiller içinden geçmeye uygun partiküller şekil ve iriliğe sahip olmalıdır.
- ** Hedef bölgeye ulaşmadan önce önemli bir ilaç sızıntısına yol açmamalıdır.
- ** İlacın plazma enzimleri tarafından inaktive edilmesini önleyebilmelidir.
- ** İlacın doku parankimasına girmesine yardımcı olmalıdır.
- ** Kolay hazırlanabilmelidir.

Mikrokürelerin yüzeylerinin kaplanması



Mikrokürelerin yüzeyleri;

**Yüzey yüklerini,

**Adhezif özelliklerini veya

**İmmün yanıt karakteristiklerini

değiştirecek bir madde ile kaplanarak biyolojik sistemde kontrollü biçimde hareket etmeleri sağlanabilmektedir.



- Ligant-reseptör aracılı hedeflendirme de kullanılan ligantlar:
 - Lektinler
 - Monoklonal antikolar
 - Vitaminler
 - Sitokinler
 - Glikoproteinler
 - Toksinler