

ИЗУЧЕНИЕ ВЛИЯНИЯ РАСТИТЕЛЬНЫХ МАСЕЛ НА СВОЙСТВА ЭМУЛЬСИИ БЕТУЛИНА

Шайкенов Р. О. (Университет ИТМО)

Научный руководитель — кандидат химических наук, Туктарова Р. А. (ИТМО)

Введение. Наиболее частые причины низкой биодоступности лекарств, особенно при пероральном способе приема, связаны с плохой растворимостью и низкой проницаемостью через биологические мембраны [1]. По некоторым подсчетам, около 40% продаваемых лекарственных средств и до 75 % соединений, находящихся в настоящее время на стадии разработки, плохо растворимы в воде (растворимость менее 0,1 мг/мл) [2]. Между двумя критическими параметрами — плохой растворимостью и низкой проницаемостью, влияющими на биодоступность препарата, плохая растворимость считается более существенным ограничением, имеющим большое значение в фармацевтической области с практической и теоретической точек зрения [3]. Существует несколько наиболее часто используемых подходов для повышения растворимости фармацевтических препаратов, среди которых эмульсии и микроэмульсии нашли широкое применение [4,5].

Основная часть. Эмульсии — жидкие лекарственные формы, представляющие собой гетерогенную двухфазную дисперсную систему с жидкой дисперсной фазой и жидкой дисперсионной средой. Эмульсионная основа позволяет легко включать в состав как водо-, так и жирорастворимые компоненты, корректировать вкус лекарственного препарата, повышает биосовместимость, пролонгирует действие лекарственного препарата, снижает побочные эффекты [6]. Исходя из вышеизложенного, производство эмульсионных фармацевтических препаратов, являющихся своего рода системой доставки лекарственных средств, можно рассматривать как перспективное направление развития фармацевтической промышленности.

В данной работе были получены эмульсионные препараты на основе растительных масел, содержащих средне- (пальмоядровое, зародышей пшеницы, рисовых отрубей) и длинноцепочечные жирные кислоты (касторовое, виноградной косточки) [7]. Полученные эмульсии были исследованы на стабильность центрифугированием, а также на долгосрочную стабильность после продолжительного хранения. Кроме того, были изучены реологические свойства эмульсий и распределение капель по размеру с помощью световой микроскопии.

В качестве модельного биологически активного вещества использовался бетулин. Бетулин — пентациклический тритерпен и вторичный метаболит растений, содержащийся в достаточно большом количестве (от 10 % до 40 %) в наружной коре березы *Betulaceae* sp.

Многочисленные исследования продемонстрировали, что бетулин проявляет широкий спектр биологических и фармакологических свойств, таких как: антибактериальная, противогрибковая, противовирусная, противоопухолевая активность [8]. Однако низкая растворимость ограничивает его терапевтическое применение.

Выводы. В результате проделанной работы определены оптимальные технологические параметры получения стабильных эмульсионных систем, приготовленных на основе пальмоядрового, касторового масел, масла зародышей пшеницы, рисовых отрубей и виноградной косточки с использованием смеси неионогенных ПАВ.

Список использованных источников:

1. Vieth M., et al. Characteristic physical properties and structural fragments of marketed oral drugs// J. Med. Chem. 2004. 47, 224–232.
2. Tinworth C. P., Young R.J. Facts, patterns, and principles in drug discovery: appraising the rule of 5 with measured physicochemical data// J. Med. Chem. 2020. 63, 10091–10108.
3. Lipinski C. Poor aqueous solubility—an industry wide problem in drug discovery// Am Pharm Rev. 200. 5, 82–85.
4. Hart M. L., et al. Brief Overview of Various Approaches to Enhance Drug Solubility// J Develop Drugs. 2013. 2, 115.
5. Lopes. L.V., Overcoming the cutaneous barrier with microemulsions// Pharmaceutics, 2014. 6, 52–77.
6. Thakur R., et al. A review on pharmaceutical emulsion// Asian Journal of Pharmaceutical Research and Development. 2023. 11, 168–172.
7. Orsavova J. et al. Fatty acids Composition of vegetable oils and its contribution to dietary energy intake and dependence of cardiovascular mortality on dietary intake of fatty acids// International Journal of Molecular Sciences. 2015. T. 16. № 6. С. 12871–12890.
8. Adepoju F. O. et al. Pharmacological potential of betulin as a multitarget compound// Biomolecules. 2023. 13, 1105.