

Laborator de cristalizare și polimorfism

Obținerea formelor solide ale compușilor bioactivi prin cristalizare *high-throughput* la scală mică

Cuvinte cheie: forme solide, polimorfi, cristalizare, *high-throughput*

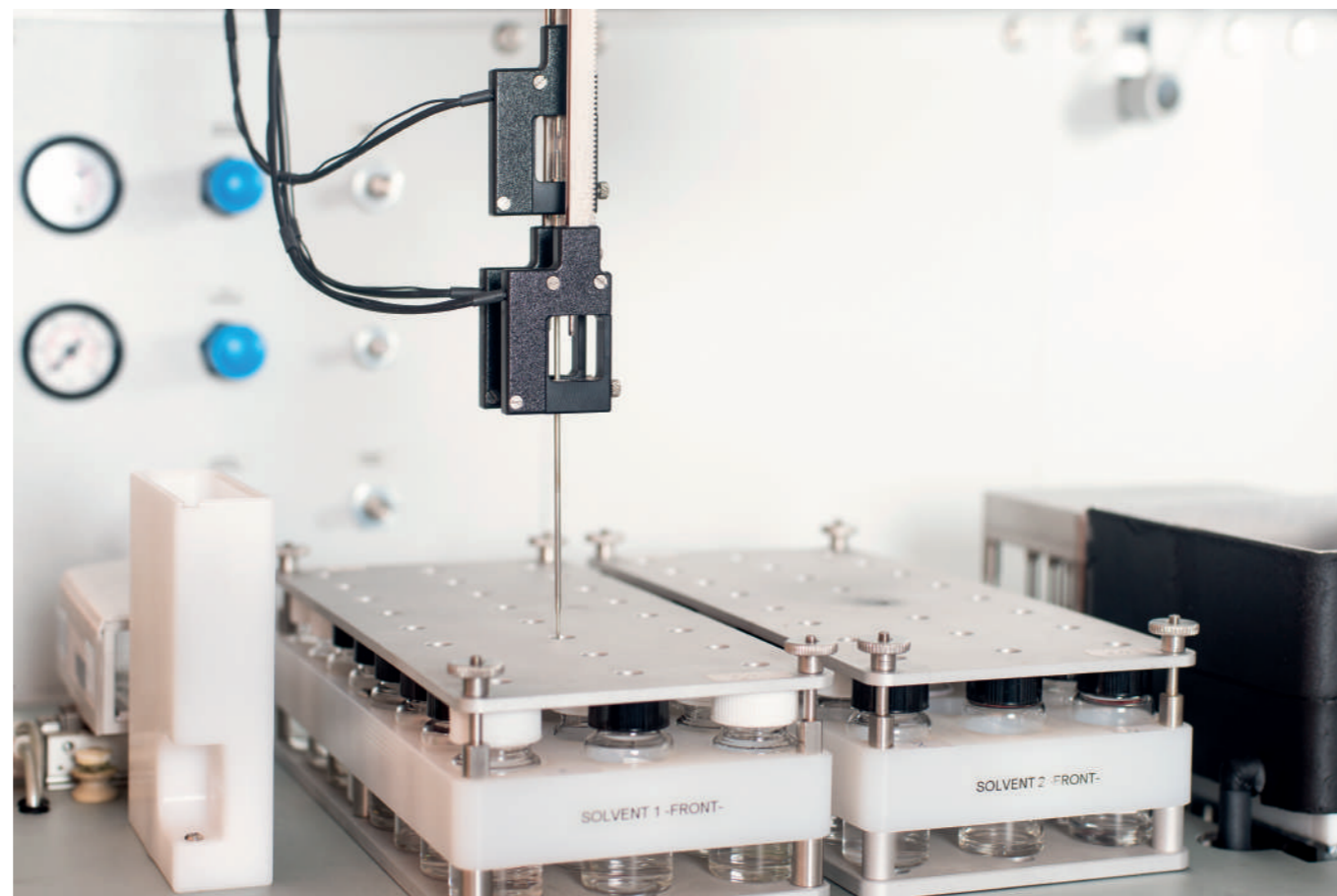
În Laboratorul de Cristalizare și Polimorfism se realizează screeningul de forme solide noi cu tehnici de cristalizare în regim *high-throughput* (paralel). Acestea oferă posibilitatea aplicării unei game variate de metode de cristalizare care să asigure diversitatea experimentală necesară. Astfel crește mult probabilitatea obținerii de forme solide stabile, cu proprietăți fizico-chimice optime pentru procesul de dezvoltare al medicamentului final.

Etape principale ale screeningului de forme solide sunt:

- ✓ **determinarea profilului de solubilitate** – este importantă atât pentru design-ul experimentelor de cristalizare paralelă, cât și pentru scalarea procesului de obținere a formei solide optime.
- ✓ **selectarea solvenților de cristalizare** – se urmărește popularea domeniilor de solubilitate, ținând cont de proprietățile substanței bioactive și de proprietățile solvenților.
- ✓ **selectarea coformerilor pentru obținerea de cocristale sau săruri** – se are în vedere: natura chimică a substanței bioactive, afinitatea chimică a coformerilor, toxicitatea coformerilor (acceptabilitatea farmacologică)
- ✓ **selectarea metodelor de cristalizare** – se ține cont de compatibilitatea solvenților cu particularitățile metodelor de cristalizare, cantitatea de substanță/solvent necesară, durata experimentului

Expertiza grupului de cercetare a fost dobândită în cadrul unui proiect finanțat prin fonduri europene, care a permis obținerea unui număr mare de forme solide, stabile și cu solubilitate îmbunătățită.

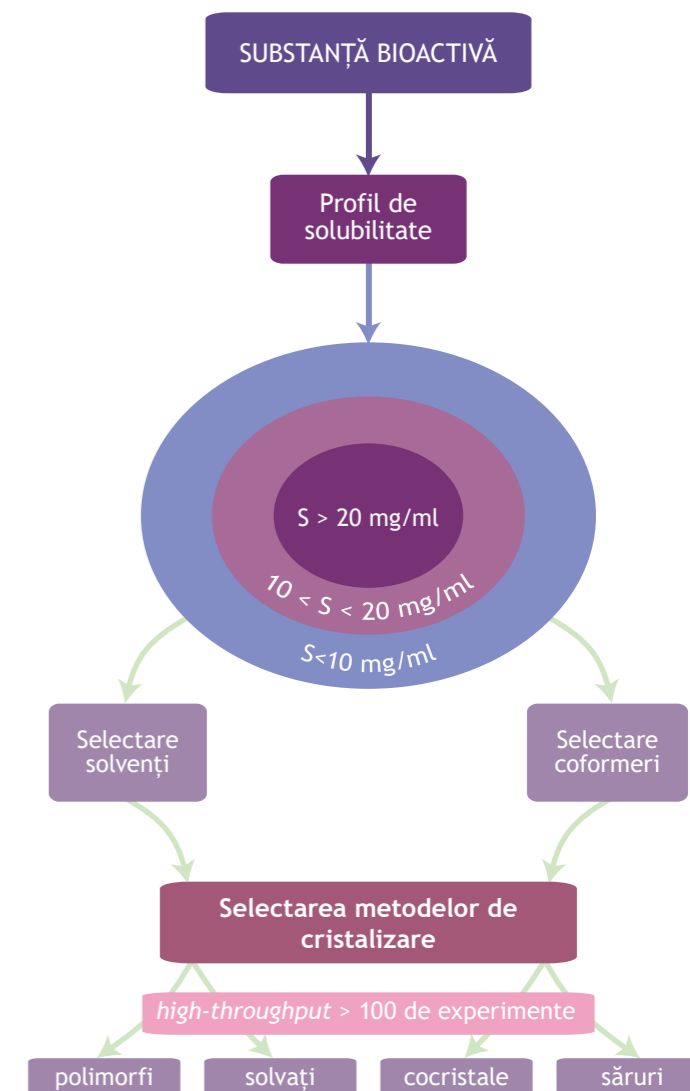
În urma unui studiu sistematic de inginerie cristalină a compusului Ketoconazol în vederea îmbunătățirii solubilității acestuia, am obținut rezultate spectaculoase în cazul unei serii de sisteme cristaline binare cu acizi dicarboxilici. Dintre acestea, sarea Acidului oxalic cu Ketoconazol și cocristalul Ketoconazol - Acid fumaric au o solubilitate de 50 de ori, respectiv de peste 100 de ori mai mare decât Ketoconazolul.



Zinsser Crissy Light XL - platforma de cristalizare paralelă în regim *high-throughput* la scala mică



Memmert HCP10 - cameră climatică de temperatură și umiditate ridicată



Etapele procesului de de selecție a metodelor de cristalizare în funcție de solubilitatea compusului

CONTACT



Dr. Irina Kacsó
Cercetător științific III
Departamentul de Fizică Moleculară și Biomoleculară, C1.04
☎ (+4)0264-584037, int 221, 214
✉ irina.kacso@itim-cj.ro
🌐 www.itim-cj.ro