

ТВЕРДЫЕ МОНОФАЗНЫЕ СИСТЕМЫ ДИГИДРОКВЕРЦЕТИНА

Терехов Р.П., Селиванова И.А.

ФГАОУ ВО Первый МГМУ им. И.М. Сеченова Минздрава России (Сеченовский университет),
119991, Москва, ул. Трубецкая 8-2,
e-mail: r.p.terekhov@yandex.ru

Дигидрокверцетин (ДКВ) производится индустриально как фармацевтическая субстанция¹. Основная задача при разработке новых фитопрепаратов на его основе – повышение биодоступности, например за счет увеличения растворимости в воде при комнатной температуре².

Нами были применены методы инженерии кристаллов для синтеза твердых бинарных монофазных систем ДКВ с различными коформерами. В результате скрининговых исследований получено 12 форм в виде кокристаллов и аморфных систем, растворимость которых повысилась в интервале от 10 до 5500 раз по сравнению с исходной субстанцией (0,2 мг/мл). Однако образцы с высокой растворимостью, например лиофилизаты ДКВ с ванилином и мочевиной, были не стабильны при обычных условиях на воздухе, что коррелировало с их низкими температурами плавления (табл.1). По совокупности физико-химических характеристик наиболее перспективными объектами для создания новых лекарственных препаратов можно считать аморфный лиофилизат ДКВ с никотиновой кислотой и кокристаллы ДКВ с ванилином, полученные путем сонокристаллизации.

Таблица 1. Физико-химические параметры монофазных систем ДКВ

Способ получения	Коформер	Физико-химические параметры	
		Растворимость, мг/мл	Т. пл., °С
Лиофилизация	ванилин	500,0	46,0
	мочевина	1100,0	54,0
	никотиновая кислота	20,0	102,0
Сонокристаллизация	ванилин	70,0	60,1

Литература

1. Плотников М.Б., Тюкавкина Н.А., Плотникова Т.И. Лекарственные препараты на основе диквертина. – Томск: Издательство Томского университета, 2005. – 228с.
2. Zu S., Yang L., Huanq J., Ma C., Wang W., Zhao C., Zu Y. Int. J. Mol. Sci., 2012, 13(7), 8869-8881.

Поддерживается «Проектом повышения конкурентоспособности ведущих российских университетов среди ведущих мировых научно-образовательных центров».