

KARTA TECHNOLOGICZNA

SPOSÓB OTRZYMYWANIA  
BEZWODNEGO  
BOSENTANU W STABILNEJ  
FORMIE AMORFICZNEJ



Śląski  
Uniwersytet  
Medyczny  
w Katowicach



## OPIS ROZWIĄZANIA

Celem procesu jest przekształcenie krystalicznej formy bosentanu, będącej monohydratem, w stabilną niewodnioną formę amorficzną. Taka postać charakteryzuje się dużą trwałością fizykochemiczną, a także zwiększoną dostępnością biologiczną.

Opisany w patencie proces zachodzi następująco: próbka jest umieszczana w komorze kulowego młyna kriogenicznego, gdzie jest schładzana do temperatury wrzenia ciekłego azotu (około 77-78 K). Następnie próbka jest poddawana co najmniej pięciu cyklom mielenia trwającym od kilku do kilkunastu minut. Warto zauważyć, że korzystne są dziewięciominutowe do dwunastominutowe cykle mielenia. Pomiędzy cyklami mielenia stosuje się przerwy, w trakcie których próbkę każdorazowo dochładza się do temperatury wrzenia ciekłego azotu.

Efektem tego procesu jest uzyskanie bezwodnego bosentanu w formie amorficznej o rzadko spotykanej, wysokiej stabilności. W rezultacie oczekuje się, że substancja aktywna będzie charakteryzować się trwałością porównywalną do postaci krystalicznej, ale znacznie lepszymi parametrami farmakokinetycznymi i zwiększoną biodostępnością.

### TWÓRCY:

dr hab. Ewa Ozimina-Kamińska, prof. SUM. - SUM,  
dr n.farm. Aldona Minecka - SUM,  
prof. zw. dr hab. Marian Paluch - UŚ,  
prof. dr hab. Kamil Kamiński - UŚ,  
dr hab. Magdalena Tarnacka, prof UŚ- UŚ,  
dr hab. Barbara Hachuła, prof. UŚ - UŚ,  
dr inż. Karolina Jurkiewicz - UŚ,

mgr Wojciech Borówka  
Broker Technologii SUM  
transfer technologii / komercjalizacja  
tel. (+48 32) 208-36-40/92  
[wojciech.borowka@sum.edu.pl](mailto:wojciech.borowka@sum.edu.pl)



### PRZEWAGI

- zwiększona odporność substancji aktywnej na warunki środowiskowe, co przekłada się na pożądaną trwałość i stabilność produktu farmaceutycznego,
- przekształcenie bosentanu w formę amorficzną poprawia rozpuszczalność i kinetykę rozpuszczania, a w dalszych etapach poprawia wchłanianie, co w konsekwencji pozwala na zastosowanie mniejszych dawek leku,
- dobór parametrów procesu, takich jak temperatura i czas mielenia, ma wpływ na ostateczne właściwości produktu.

### OBSZAR WDROŻENIOWY

- zastosowanie do produkcji amorficznych substancji czynnych z różnych grup, gdzie wyjściową formą jest krystaliczny hydrat.

### POZIOM GOTOWOŚCI (TRL): 8

### TYP OCHRONY PRAWNEJ

Patent P.437838