

Expose

Projekttitlel	Entwicklung neuartiger Filmbildner für Wirkstoff-Carrier auf Basis PEGylierter Phospholipide
Kurztitel	PEGPHOS
Teilprojekt an der Beuth HS	Untersuchung des Carrierpotenzials PEGylierter Phospholipide für Modellwirkstoffe
Kooperationspartner	celares GmbH, Berlin
Mittelgeber	Das Zentrale Innovationsprogramm Mittelstand (ZIM), Bundesministerium für Wirtschaft und Technologie
Laufzeit	Laufzeit: 01.10.2011 – 30.09.2013

1. Wissenschaftlich-technologische Entwicklungsziele

Das Verbundvorhaben dient der Entwicklung neuartiger Filmbildner zum sicheren Einschluss und zur gezielten Freigabe („Verkapselung“) von Wirkstoffen im Pharma- und Foodbereich („Drug-Carrier-Systeme“). Durch Pegylierung sollen Phospholipide derart verändert werden, dass die Bildung neuartiger Carriersysteme möglich wird.

2. Angestrebte technologische Funktionalität und relevante Parameter

Drug-Carrier-Systeme (DCS) z.B. in Form von Emulsionen, Gelen oder Liposomen weisen einen erheblichen Wachstumsmarkt aus. In den nächsten 10-15 Jahren wird allein der US-Markt auf 180 Mrd. \$ geschätzt, von dem DCS ca. 50% ausmachen. DCS bedeutet, dass ein Wirkstoff durch einen Filmbildner in einer „Kapsel“ eingeschlossen wird. Die Kapsel kann sehr unterschiedliche Eigenschaften haben: vom Film über weiche bis hin zu harten Oberflächen. Die Barrierewirkung gegen Diffusion verschiedenster Moleküle und das Wechselwirkungsverhalten der Kapsel mit anderen Teilchen definieren letztlich die Erfolgsaussichten der Wirkstoffformulierung auf dem Markt.

Dabei spielt die Teilchengröße eine nicht unerhebliche Rolle für eine gezielte Einstellung von Eigenschaften. Insbesondere im Teilchengrößenbereich um 100 nm (Nanoteilchen) dominieren kolloidale Eigenschaften, die neuartige Stabilitäts- und Wechselwirkungspotenziale aufweisen. Dazu sind jedoch spezielle Herstellungstechniken und Filmbildner notwendig.

Bildung und Eigenschaften der Verkapselung stellen somit hohe Anforderungen an den Filmbildner. Des Weiteren ist ein klarer Trend zu natürlichen Materialien zu beobachten. Gerade natürliche Materialien wie Stärke, Proteine oder Lipidderivate zeigen selten die gewünschten Verkapselungseigenschaften und z.T. erhebliche Schwankungen in der Qualität. Deshalb wird versucht, durch gezielte Veränderungen der natürlichen Moleküle, maßgeschneiderte Filmbildner zu entwickeln.

Phospholipide (PL) sind Lipide, die polare Gruppen (Phosphatreste) enthalten. Die meisten Phospholipide gehören zur Gruppe der Phosphoglyceride. Hier sind an einem Glycerinrest - im Gegensatz zu den Neutralfetten - nur zwei Fettsäuren gebunden. Die dritte OH-Gruppe trägt einen Phosphatrest, der mit einer Alkohol-Komponente (Cholin, Ethanolamin, Serin oder Inositol) verestert ist. Phospholipide können in wässriger Lösung Micellen, Vesikel und Membranen ausbilden.

Durch die Entwicklung PL-spezifischer, heterobifunktionaler PEGs für die Konjugation soll der amphiphile Charakter von PL verändert werden bzw. neue Moleküle aus PL hergestellt werden, zur:

- direkten Herstellung von Emulsionen
- Abschirmung der DCS gegen unbeabsichtigtes Targeting
- Verbesserten Freigabe von Wirkstoffen durch Spacerfunktion

