



ООО «НКЦ «ЛАБТЕСТ»  
Россия, Москва, 123557,  
Большой Тишинский пер.38  
Тел: +7 (495) 605 3507, 605 3610  
Факс: +7 (495) 518 9452  
info@lab-test.ru, www.lab-test.ru



Применение спектрофлуориметра ChronosDFD с цифровой обработкой сигнала в частотной области (ISS, США) в биохимических исследованиях.

Аннотация статьи

CHARACTERIZATION OF FLUORINATED CATANSONES:  
A PROMISING VECTOR IN DRUG-DELIVERY

*Kadla R. Rosholm, Ahmad Arouri, Per L. Hansen, Alfredo Gonzalez-Perez, Ole G. Mouritsen, Langmuir., 2012, 28(5), 2773-81.*

**ИССЛЕДОВАНИЕ СВОЙСТВ ФТОРИРОВАННЫХ КАТАНСОМ:  
МНОГООБЕЩАЮЩЕЕ НАПРАВЛЕНИЕ В НАПРАВЛЕННОМ ТРАНСПОРТЕ  
ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ**

Одним из наиболее перспективных направлений в современной медицине и фармакологии является создание систем направленного транспорта лекарственных препаратов. Вещество, введённое в организм традиционным способом, распределяется в нём равномерно, попадая не только в поражённые места, но и в те органы, где действие препарата может дать негативный эффект. К тому же лекарственный препарат, достигает органы-мишени в концентрации, значительно меньшей по сравнению с необходимой, что заставляет медиков использовать дозы, превосходящие терапевтически необходимые. Адресная доставка лекарственных веществ позволяет сконцентрировать лекарственный препарат исключительно или хотя бы преимущественно в целевой области, значительно увеличив его эффективность, одновременно снизив возможные побочные эффекты.

В качестве одного из способов направленной доставки препаратов с противовирусной, противораковой и антибактериальной активностью используется инкапсуляция в везикулы. При этом везикулы могут быть использованы для инкапсуляции как гидрофильных, так и гидрофобных соединений. Наибольший интерес у учёных вызывают липосомы, сферические везикулы, чья оболочка состоит из одного или нескольких липидных слоёв. Основное преимущество липосом по сравнению с другими везикулами состоит в их биосовместимости. Но при этом нестабильность липосом в физиологических условиях ограничивает их применение в практической медицине и заставляет исследователей искать другие везикулоподобные структуры. В последнее время всё большее внимание некоторые учёные уделяют катансомам — везикулоподобным структурам, полученным путём смешения эквимольных или неэквимольных количеств противоположно заряженных мицеллообразующих поверхностно-активных веществ (ПАВ). Основная задача, которая стоит перед исследователями, состоит в выборе оптимального химического состава катансом.

Коллективом датских учёных под руководством Кадлы Росхольм из Копенгагенского университета проведено исследование катансом, полученных путём смешения перфторированных анионных ПАВ и катионных ПАВ. В качестве катионных ПАВ исследователи использовали додецилтриметиламмония бромид ( $C_{12}TA$ ) и 1-додецилпиридиния хлорид ( $C_{12}P$ ), а в качестве анионного ПАВ — перфтороктаноат натрия ( $C_8FO$ ). Перфтороктаноат привлек внимание исследователей, поскольку ранее было показано, что при использовании фторированных ПАВ происходит увеличение стабильности и уменьшение проницаемости везикул.

Стабильность полученных катансом в присутствии различных детергентов, эффективность инкапсуляции и мембранную проницаемость определяли по изменению во времени интенсивности флуоресценции инкапсулированного в везикулы кальцеина (флуорексона). Для проведения флуоресцентного анализа исследователи использовали **спектрофлуориметр Chronos для измерений в частотной области (ISS, США)**. Преимущество данного прибора заключается в наличии модуляции возбуждающего света и цифровой обработки сигналов флуоресценции в частотной области. Источником света являются лазерный диод и светодиоды, которые работают с установленной пользователем модуляцией частоты сигнала. Сигнал флуоресценции содержит основную частоту, повторяющую скорость работы лазера, и гармонические сигналы, отстающие по фазе. Встроенное программное обеспечение

проводит математическую обработку сигнала, определяя амплитуду и отставание по фазе для каждого компонента.

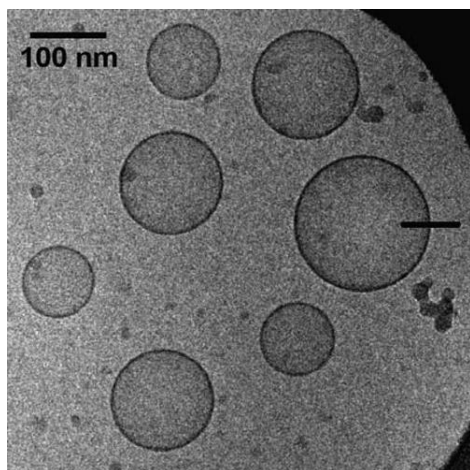


Рис. 1. Катансомы состава  $C_{12}TA-C_8FO$ , полученные при 50% избытке катионного ПАВ.

Для каждого исследуемого образца измерение проводится по несколько раз. По усреднённой разности фаз между флуоресценцией и возбуждением на заданной частоте и по отношению амплитуд происходит вычисление времени жизни флуоресценции. Данная технология позволяет с высокой точностью определять время затухания флуоресценции в очень широком диапазоне — от 10 пс до 1 с.

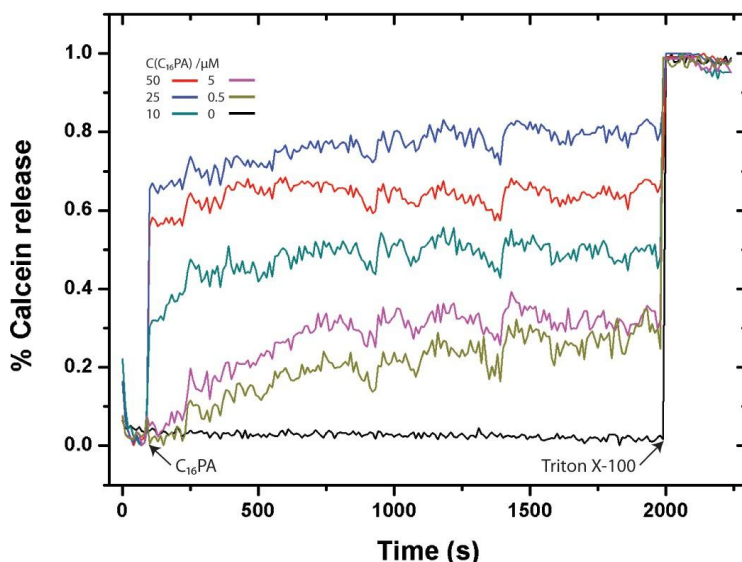


Рис. 2. Влияние пальмитиновой кислоты  $C_{16}PA$  и Triton X-100 на стабильность катансом состава  $C_{12}TA-C_8FO$  с инкапсулированным кальцеином.

Полученные катансомы сохраняли стабильность на протяжении пяти месяцев при комнатной температуре. Кроме того, после введения флуоресцентного маркера кальцеина катансомы продемонстрировали большую эффективность инкапсулирования и низкую утечку инкапсулированного вещества. Добавление к кальцеин-содержащим катансомам жирных кислот увеличивает утечку кальцеина, при этом скорость утечки возрастает пропорционально концентрации жирных кислот и длине цепи. По мнению авторов исследования, полученные результаты могут быть использованы в дальнейших разработках катансом в качестве средств адресной доставки лекарств.

Подготовил Алексей Шнитко  
ООО «НКЦ «ЛАБТЕСТ»  
тел.: +7 495 605 35 07  
факс: +7 495 605 39 44  
a.shnitko@lab-test.ru  
www.lab-test.ru