

लखनऊ विश्वविद्यालय, लखनऊ University of Lucknow, Lucknow

Press Note 20 May 2020



Dr Venu Vangala is one of the leading scientists and an academic at the University of Bradford (UoB), United Kingdom in the research area of solid-state pharmaceuticals. He has delivered a Zoom webinar entitled '**Crystal Engineering for Pharmaceuticals Development**' to the University of Lucknow on 20 May 2020. Around 400 distinguished scientists and students across world have participate this e-Seminar. Dr Vangala aims to apply the fundamental principles of crystal engineering for tailoring the physical properties of drugs.

A significant fraction of drugs are delivered in the solid (tablet, capsule) form. Therapeutic effectiveness and commercial success of a drug primarily depends on the bioavailability, stability, quality and manufacturability of the dosage form. ~40% of the marketed and 90% of new chemical entities present concerns with poor solubility, which limits bioavailability despite having desirable pharmacological activity. Several strategies are currently being used to enhance the solubility and biological activity of drugs.

In the past decade, crystal engineering (solid-state arrangement) based multicomponent solids (hereafter referred to as pharmaceutical cocrystals), active drug and safe additive molecule(s) forms homogeneous complex with intermolecular interactions and exists in solid-state at ambient conditions, demonstrated a significant potential in terms of modifying the physicochemical properties, absorption and manufacturability of drugs. Aside bioavailability, active drugs present challenges pertaining to physicochemical transformations during processing and formulation, chemical degradation and poor compressibility. Dr Vangala's Research Group have successfully demonstrated for **the first time** that cocrystals could offer photo-stabilisation (chemical stability) to the drug, which has potential applications in manufacturing and packaging. Accordingly, pharmaceutical cocrystals have attracted pharmaceutical industry and academia now as novel pharmaceutical materials for positively modifying the drug physical properties and manufacturability.

Thus far, publications have outlined various aspects of cocrystals at the molecular level concentrating on their design, growing techniques, and physicochemical characterizations. However, to take cocrystals from bench to bedside, they have to be incorporated into suitable formulations notwithstanding that the attention paid to cocrystal formulations is so diminutive. This contribution comprises the **first systematic review** based

लखनऊ विश्वविद्यालय, लखनऊ University of Lucknow, Lucknow

exclusively on cocrystals formulations. Dr Vangala's talk consist of some of their cocrystal formulations efforts (Figure 1).

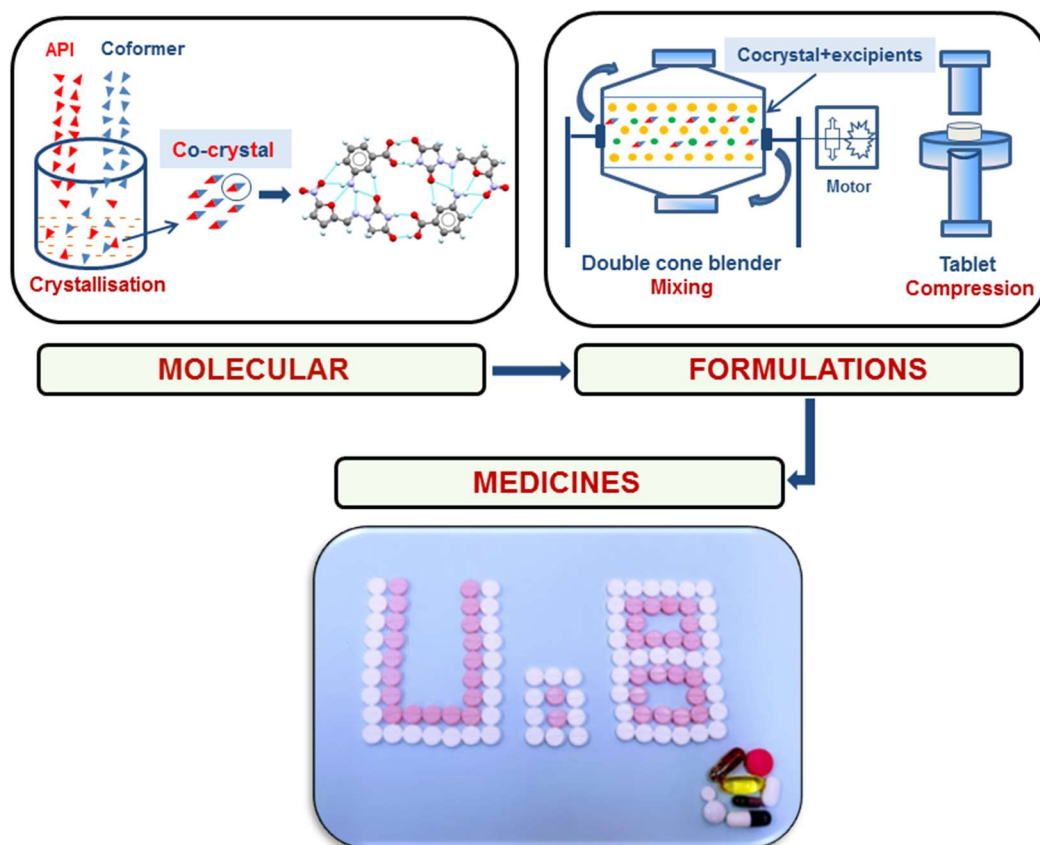


Figure 1. Molecular level of understanding and tailoring of physical properties and successful formulations pave the way for the drug development.

The research findings suggest that after physicochemical characterisations, a number of approaches are desired in order to develop successful cocrystal formulations. It further highlights the main hurdles encountered with cocrystals formulation and other challenges to the transformation of cocrystals into viable medicines to have the full picture. There are marketed cocrystal products now, and it can be said it is only a matter of time before cocrystals are added to the main selection toolbox alongside salts for developing medicinal products.

लखनऊ विश्वविद्यालय, लखनऊ University of Lucknow, Lucknow

डॉ वेणु वंगला ठोस-राज्य फार्मास्यूटिकल्स के अनुसंधान क्षेत्र में यूनाइटेड किंगडम के ब्रैडफोर्ड विश्वविद्यालय (यूओबी) में अग्रणी वैज्ञानिकों में से एक हैं। उन्होंने 20 मई 2020 को लखनऊ विश्वविद्यालय में क्रिस्टल इंजीनियरिंग फॉर फार्मास्यूटिकल्स डेवलपमेंट ' नामक जूम वेबिनार दिया है। दुनिया भर के लगभग 400 प्रतिष्ठित वैज्ञानिकों और छात्रों ने इस ई-सेमिनार में भाग लिया है। डॉ वंगला का उद्देश्य ड्रग्स के भौतिक गुणों को संतुलित करने के लिए क्रिस्टल इंजीनियरिंग के मूलभूत सिद्धांतों को लागू करना है।

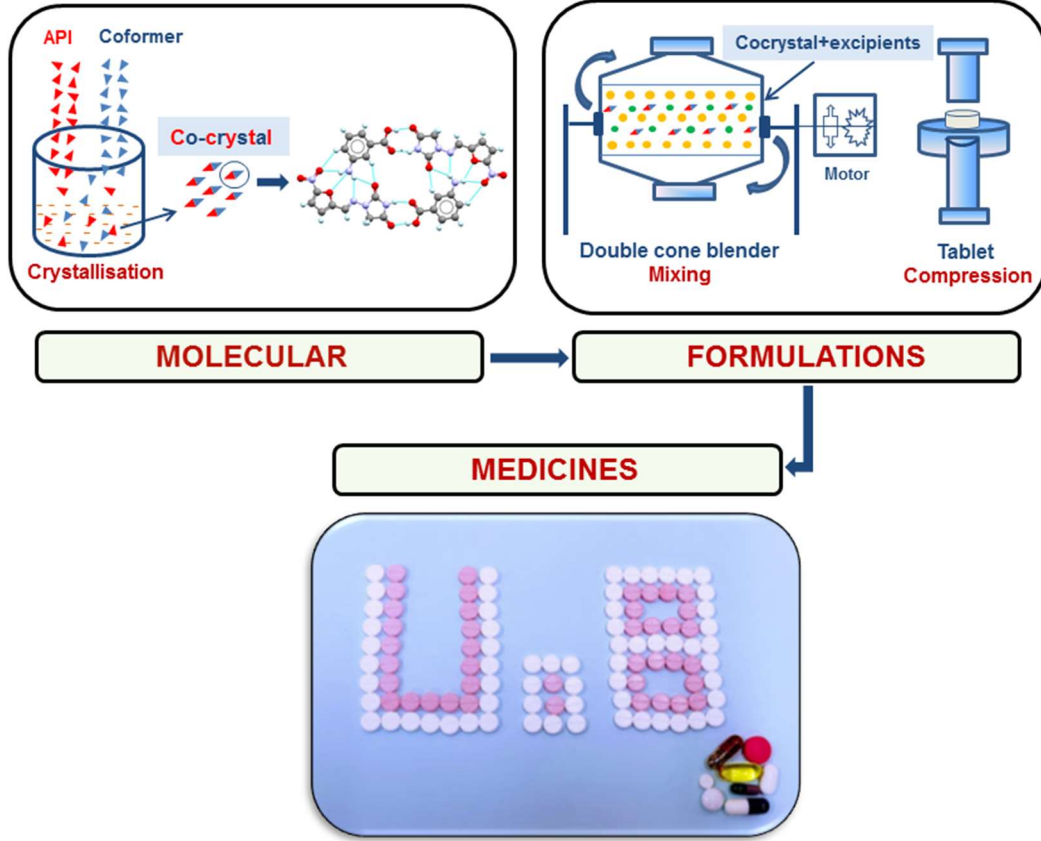
दवाओं का एक महत्वपूर्ण अंश ठोस (टैबलेट, कैप्सूल) रूप में दिया जाता है। चिकित्सीय प्रभावशीलता मुख्य रूप से खुराक के रूप की जैवउपलब्धता, स्थिरता, गुणवत्ता और विनिर्माण क्षमता पर निर्भर करता है। ~ 40% विपणन और नई रासायनिक संस्थाओं का 90% खराब घुलनशीलता के साथ चिंताओं को प्रस्तुत करता है, जो वांछनीय औषधीय गतिविधि के बावजूद जैव उपलब्धता को सीमित करता है। वर्तमान में दवाओं की घुलनशीलता और जैविक गतिविधि को बढ़ाने के लिए कई रणनीतियों का उपयोग किया जा रहा है।

पिछले एक दशक में, क्रिस्टल इंजीनियरिंग (ठोस-राज्य व्यवस्था) आधारित मल्टीकंपोनेंट सॉलिड्स (इसके बाद फार्मास्यूटिकल कोक्रिस्टल्स के रूप में संदर्भित), सक्रिय ड्रग और सुरक्षित एडिटिव अणु (एस) इंटरमॉलिक्युलर इंटरैक्शन के साथ सजातीय परिसर बनाते हैं और परिवेश की स्थिति में ठोस अवस्था में मौजूद होते हैं। जैव उपलब्धता के अलावा, सक्रिय दवाएं प्रसंस्करण और निर्माण, रासायनिक क्षरण और खराब संपीडितता के दौरान भौतिक रासायनिक परिवर्तनों से संबंधित चुनौतियां पेश करती हैं। डॉ वंगला के अनुसंधान समूह ने पहली बार सफलतापूर्वक प्रदर्शित किया है कि कोकसील दवा को फोटो-स्थिरीकरण (रासायनिक स्थिरता) की पेशकश कर सकता है, जिसके निर्माण और पैकेजिंग में संभावित अनुप्रयोग हैं। तदनुसार, फार्मास्यूटिकल कोक्रिस्टल ने दवा उद्योग को और अकादमिक को आकर्षित किया है, क्योंकि दवा के भौतिक गुणों और संधारणीयता को सकारात्मक रूप से संशोधित करने के लिए दवा सामग्री के रूप में है।

इस प्रकार अब तक, प्रकाशनों ने आणविक स्तर पर अपने डिजाइन, बढ़ती तकनीकों और भौतिक-रासायनिक विशेषताओं पर ध्यान केंद्रित करते हुए कोक्रिस्टल के विभिन्न पहलुओं को रेखांकित किया है। हालांकि, बेंच से बेडसाइड में कोकेस्ट्रल लेने के लिए, उन्हें उपयुक्त योगों में शामिल करना होगा, इस बात पर ध्यान दिए बिना कि कोचर क्रिस्टल फॉर्मेशन पर ध्यान दिया जाना बहुत कम है। इस

लखनऊ विश्वविद्यालय, लखनऊ University of Lucknow, Lucknow

योगदान में विशेष रूप से कोकेस्ट्रल योगों पर आधारित पहली व्यवस्थित समीक्षा शामिल है। डॉ। वंगला की चर्चा में उनके कुछ कोकेस्ट्रल योगों के प्रयास (चित्र 1) शामिल हैं।



चित्र 1. भौतिक गुणों की समझ और आणविक स्तर और सफल योगों से दवा के विकास का मार्ग प्रशस्त होता है।

शोध के निष्कर्षों से पता चलता है कि भौतिक रासायनिक वर्णनों के बाद, सफल कोक्रिस्टल योगों को विकसित करने के लिए कई दृष्टिकोण वांछित हैं। यह आगे मुख्य बाधाओं को कोकेस्ट्रल के निर्माण और व्यावहारिक दवाओं में कोकेस्ट्रल के परिवर्तन के साथ अन्य चुनौतियों का सामना करने के लिए पूरी तस्वीर पर प्रकाश डालता है। अब विपणन किए गए कोकेस्ट्रल उत्पाद हैं, और यह कहा जा सकता है कि औषधीय उत्पादों को विकसित करने के लिए लवण के साथ मुख्य चयन टूलबॉक्स में जोड़े जाने से पहले यह केवल समय की बात है।



University of Lucknow | Centenary Year
लखनऊ विश्वविद्यालय | शताब्दी वर्ष



लखनऊ विश्वविद्यालय, लखनऊ University of Lucknow, Lucknow