

Ciklodextrinek kettős szerepben a vírusok elleni küzdelemben : segédanyag és hatóanyag

Cyclodextrins in dual function to fight viruses: excipients and active ingredients

SZENTE Lajos

CycloLab Cyclodextrin research and development Laboratory
H-1097 Budapest, Illatos út 7. Hungary

ABSTRACT

Cyclodextrins (CDs) have been reputed to provide dual function in fighting SARS-Cov-2 virus and in general fighting envelop type viruses.

The first function of CDs is their traditional application: they are functional excipients in solubilizing, stabilizing and targeting antiviral APIs (active pharmaceutical ingredients). Currently an anionic betaCD derivative, the sulfobutylether-BCD (Dexolve®) is used for the solubilization of remdesivir (product of Gilead Sciences) in the marketed product Veklury®.

Details of the cGMP-compliant industrial scale manufacturing of excipient Dexolve® will be discussed in the early time of Covid pandemy, when no vaccines were yet available. The function of CDs in the remdesivir formulation will be explained by discussing their physico-chemical characteristics and drug release properties. Other functions like vaccine adjuvant and vaccine protein stabilization by CDs will also be discussed on the example of the marketed Janssen's (J and J) covid vaccine and the new development of needle-free vaccine for dermal delivery of vaccine. The future applications of CDs themselves against viral infections will be highlighted on the example of HIV viruses, SARS-Cov-2 influenza viruses, and other envelop viruses.

Keywords: viruses, remdesivir SARS-Cov-2, cyclodextrins, Dexolve®

KIVONAT

A ciklodextrinek (CDk) szerepe a vírusok elleni terápiákban kettős: a CDk elsősorban segédanyagként alkalmasak vírusellenes hatóanyagok formulálására, a molekulák vízdékonyságának fokozására, kémiai stabilizálásukra, és célba juttatásukra. A másik alkalmazási lehetőség az, amikor a CDk önmagukban fejtenek ki hatást vírus ellen, illetve csökkentik azok fertőzőképességét. A CDk segédanyagként történő használatára legalkalmasabb példa a szulfobutil-éter-BCD-vel (Dexolve®) szolubilizált remdesivir antivirális szer, (a Gilead Sciences terméke). Ezt a hatóanyagot nagy mennyiségű Dexolve-val tudták infúziós terméké (Veklury®) fejleszteni. Sokáig, amíg az oltóanyagok nem kerültek forgalomba, ez a készítmény játszotta a fő szerepet a kórházba került súlyos Covid fertőzöttek terápiájában. A ciklodextrinek önmaguk is mutatnak vírus ellenes hatásokat, főként azok, melyek hatékony lipid/koleszterin komplexáló, mobilizáló képességgel rendelkeznek. Ezeket több, egymástól független kutatócsoport is hatékonyan találta *in vitro* és *in vivo* az ún. "burkolattal rendelkező", tokos vírusok ellen, mint pl. a HIV-vírus, a SARS-Cov-2 koronavírus és influenza vírusok. A CDk antivirális terápiában betölthető jövőbeli szerepéről rövid kitekintést adunk friss irodalmi adatok alapján.

Kulcsszavak: vírusok, remdesivir, koronavírus, ciklodextrinek, Dexolve®