

Estudo inicial sobre encapsulação de Praziquantel em nanopartículas lipídicas sólidas de Compritol® 888 ATO e diferentes emulsificantes.

Andreza de Almeida e Silva¹ (PG) *, Francisco B.T. Pessine¹ (PQ)

Instituto de Química, Universidade Estadual de Campinas, Campinas – SP, CEP 13083-970

*andsilva@iqm.unicamp.br

Palavras Chave: Praziquantel, Nanopartículas lipídicas sólidas, Compritol® 888 ATO.

Introdução

Praziquantel (PZQ) é um fármaco com amplo espectro de ação contra parasitas cestóides e trematódeos, sendo mais utilizado no tratamento da esquistossomose e cisticercose.¹ Por ser um fármaco de baixa solubilidade aquosa, sua taxa de dissolução limita sua absorção, sendo necessário doses altas de PZQ para vencer a barreira aquosa e o metabolismo hepático e atingir, desta forma, concentração sanguínea adequada ao tratamento.² Nanopartículas lipídicas sólidas (NPLS) são carreadores que exibem vantagens sobre sistemas tradicionais, pois possibilitam liberação modificada e/ou direcionada do fármaco, aumento da estabilidade, incorporação de fármacos hidrofílicos e lipofílicos, aumento da biodisponibilidade, entre outras. Além disso, evitam algumas desvantagens, como toxicidade elevada.³ Porém, ainda não estão disponíveis métodos para produção de NPLS em larga escala, com as características desejáveis e reprodutíveis para encapsulação de fármacos. Assim, o objetivo deste trabalho é obter NPLS usando o lipídio Compritol® 888 ATO contendo PZQ, utilizando diferentes emulsificantes.

Resultados e Discussão

O método utilizado inicialmente para escolha do melhor sistema emulsificante foi o da homogeneização à quente, com uso somente de alto cisalhamento. Resumidamente, PZQ foi disperso no lipídio fundido à 80 °C, seguido pela adição a uma solução aquosa de emulsificante na mesma temperatura e submetida à agitação no dispersor à ≈ 18000 rpm por 10 min. com posterior resfriamento. Estas partículas foram caracterizadas com relação à distribuição de tamanho (D), índice de polidispersividade (PDI) e medida do potencial zeta (Z). Os emulsificantes testados foram Tween 80 (A), Tween 80-Synperonic PE/F68 (1:1) (B), Synperonic PE/F68 (C), Tween 80-Colato de sódio (1:1) (D), Tween 80-Taurocolato de sódio (1:1) (E), Colato de sódio (F) e Taurocolato de sódio (G).

Também foram iniciados estudos para quantificar PZQ utilizando espectroscopia de fluorescência. Foram obtidos espectros de fluorescência de PZQ nas concentrações de 10^{-4} , 10^{-3} e 10^{-2} mol/L ($\lambda_{exc} = 263$ nm, fendas = 5 nm), pois a espectroscopia de

fluorescência será uma das técnicas a serem empregadas para caracterizar a encapsulação deste fármaco no sistema carreador.

Tabela 1. Resultados de D, PDI e Z para cada formulação.

NPLS	D (nm)	PDI	Z (mV)
A	128,8	0,270	-11
B	154,1	0,484	-18,5
C	313,5	0,487	-21,1
D	1436	0,795	-19,7
E	1851	0,986	-25,4
F	687,4	0,561	-55,8
G	883,8	0,461	-56,7

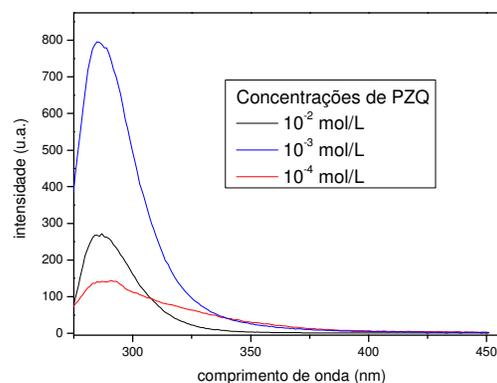


Figura 1. Espectros de emissão de fluorescência de PZQ.

Estes resultados mostram que apesar do valor Z encontrado, a melhor formulação nas condições utilizadas é a A e a pior é a E.

Em relação à concentração de PZQ, a melhor a ser utilizada é 10^{-3} mol/L, pois quando aumenta para 10^{-2} ocorre supressão da fluorescência.

Conclusões

Os resultados iniciais das formulações indicam a necessidade de usar processo posterior, como homogeneização em alta pressão, além de um estudo mais detalhado das variáveis do processo, como o uso de planejamento fatorial, para otimizar a produção das NPLS e a encapsulação do PZQ.

Agradecimentos

À CAPES pelo suporte financeiro.

¹ Dayan, A.D. *Acta Tropica* **2006**, 86, 154.

² Becket, G.; Schep, L.J.; Tan, M.Y. *Int. J. Pharm.* **1999**, 179, 65.

³ Müller, R.H.; Mäder, K.; Gohla, S. *Eur. J. Pharm. Sci.* **2000**, 50, 161.