

Nanoesferas de PLGA-PEG contendo In(III)-ftalocianina: influência de parâmetros sobre a eficiência de encapsulação e o potencial zeta.

Carlos Augusto Zanone Souto¹ (IC), André Romero da Silva¹ (PQ)*

¹ Instituto Federal do Espírito Santo, Campus Aracruz, 29192-733, Aracruz-ES; * aromero@ifes.edu.br

Palavras Chave: nanoesferas, PLGA-PEG, In(III)-ftalocianina, terapia fotodinâmica

Introdução

A encapsulação de fotossensibilizadores tem resultado no aumento da eficiência da terapia fotodinâmica¹. Por décadas, a tarefa de otimização das formulações farmacêuticas ficou associada ao trabalho univariado de tentativa e erro, fato que pode melhorar uma característica em detrimento de outra, tornando dispendioso e caro a otimização das formulações². No entanto, o emprego de planejamento sistemático dos experimentos tem permitido a otimização de formulações com um menor número de experimentos e com a identificação de interações (sinérgicas ou antagônicas) entre variáveis do processo². Diante dos fatos acima, o In(III)-ftalocianina (InPc) foi encapsulado em nanoesferas do polímero de ácido láctico-co-glicólico ligado a cadeias de polietileno glicol (PLGA-PEG). As influências de 3 diferentes fatores (porcentagem de etanol e álcool polivinílico (PVA) na fase aquosa e a proporção entre as fases orgânica/aquosa) sobre a porcentagem de encapsulação e o potencial zeta foram avaliados usando um planejamento fatorial 2³ constituído de dois níveis.

Resultados e Discussão

A eficiência da encapsulação do InPc variou entre 53 ± 1% a 95 ± 1%. Os resultados estatisticamente significativos, com 95% de confiança, mostraram que o aumento individual da proporção entre as fases orgânica/aquosa (fator A) e da porcentagem de etanol (fator B) causaram uma diminuição na porcentagem de encapsulação do InPc (-13,14% e -8,69%, respectivamente) enquanto que o PVA (fator C) aumentou a eficiência (+15,19%) (Figura 1). Todos os efeitos combinatórios foram significativos, causando um aumento na eficiência de encapsulação. Destaca-se o efeito binário AC (+12,19%) por ser o terceiro efeito mais influente sobre a encapsulação do InPc. Ambos os fatores A e B favorecem a solubilização do InPc em meio aquoso, fato que torna o aumento individual destes fatores responsável pela diminuição da porcentagem de encapsulação. O efeito do fator C se deve a redução da concentração do InPc no meio orgânico, fato que favorece a diminuição do número de moléculas de InPc que se difundem para a fase aquosa durante a evaporação do solvente.

34^a Reunião Anual da Sociedade Brasileira de Química



Figura 1. Efeito dos parâmetros A, B e C sobre a eficiência de encapsulação do InPc.

Os valores dos potenciais zeta variaram de -20 ± 2 mV a -29 ± 2 mV. Os valores negativos estão associados a presença de grupos carboxílicos localizados nas cadeias poliméricas do PLGA-PEG. O planejamento fatorial revelou que somente o aumento do fator B influenciou o potencial zeta (resultados não mostrados), causando uma redução do potencial negativo (efeito = +2,25 mV). O fator B é responsável pela diminuição do tamanho das nanoesferas, fato que favorece o acúmulo de PVA na superfície das partículas causando a blindagem da carga superficial.

Conclusões

O planejamento fatorial 2³ revelou que o aumento de etanol e de PVA na fase aquosa causam a diminuição da eficiência de encapsulação do InPc enquanto que a proporção entre as fases orgânica/aquosa aumenta a eficiência. Entretanto, somente o etanol reduziu o potencial zeta. Todos os efeitos combinatórios foram significativos em aumentar a porcentagem de encapsulação, no entanto, nenhum deles causou alteração do potencial zeta.

Agradecimentos

Ao CNPq e ao IFES.

¹ Silva, A. R.; Inada, N. M.; Rettori, D.; Baratti, M. O.; Vercesi, A. E. e Jorge, R. A., *J. Photochem. Photobiol. B* **2009**, *94*, 101.

² Singh, B.; Kumar, R. e Ahuja, N., *Crit. Rev. Ther. Drug Carr. Syst.* **2005**, *22*, 27.