

Estudo da encapsulação de Praziquantel em diferentes formulações de nanopartículas lipídicas sólidas.

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, Nanopartícula lipídica sólida, Compritol[®] 888 ATO, Esquistossomose.

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, encapsulação de fármacos hidrofílicos e lipofílicos, aumento da biodisponibilidade, entre outras.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 estudar NPLS contendo PZQ usando o lipídio Compritol[®] 888 ATO e diferentes emulsificantes e concentrações.

Resultados e Discussão

O método utilizado para obter as NPLS foi o da homogeneização à quente, com uso somente de alto cisalhamento. Resumidamente, PZQ foi disperso em Compritol[®] 888 ATO em temperatura acima de seu ponto de fusão, seguido pela adição a uma solução aquosa de emulsificante na mesma temperatura e submetida à agitação de 18000 rpm. Para as diferentes formulações das NPLS foi variada a concentração de lipídio (5,0% ou 2,0%) e o tipo de emulsificante: tween 80 (T), lecitina de soja (Lipoid S75) (E), estearato de sódio (D) ou taurocolato de sódio (K). Estas partículas foram caracterizadas com relação à distribuição de tamanho (D), índice de polidispersividade (PDI), medida do potencial zeta (Z) e eficiência de encapsulação (EE).

A quantificação do PZQ foi realizada em cromatografia líquida de alta eficiência nas condições: coluna Microsorb-MV C18; fase móvel metanol:solução ácido acético 0,1% (75:25); fluxo de 1mL/min. e detector UV à 220 nm.

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

NPLS*	D (nm)	PDI	Z (mV)
T2	284,3	0,37	-15,1
E2	163,3	0,67	-29,9
E5	133,4	0,28	-24,6
D2	422,2	0,42	-39,1
D5	138,1	0,47	-36,7
K2	394,5	0,43	-24,8
K5	164,0	0,26	-21,8

* "5" e "2" significa a % de lipídio na formulação

Os resultados da Tabela 1 mostram que as melhores formulações nas condições utilizadas são E5 e K5, o que indica uma combinação adequada das proporções de emulsificante e lipídio.

Para a análise da EE, 2 técnicas foram comparadas quanto aos seus resultados. As EE das formulações variaram entre 85,3 a 95,9% (filtração e centrifugação) e 64,9 a 84,3% (centrifugação); também foi observado que os resultados da EE foram melhores para NPLS com 5,0% de lipídio.

Embora os resultados obtidos sejam satisfatórios, o que já era esperado para um fármaco lipofílico, novas técnicas para a análise da EE do PZQ serão avaliadas posteriormente.

Conclusões

A presença de lecitina de soja ou taurocolato de sódio na formulação produziu bons resultados e pequenas mudanças nas concentrações podem alterar os mesmos, sendo necessário um estudo minucioso da composição e variáveis do processo. O método utilizado para obter as NPLS mostrou-se eficaz, porém é necessário mais resultados e estudos.

Agradecimentos

À CAPES pelo suporte financeiro.

À Centagro Produtos Veterinários, Croda, Lipoid e UNICAMP.

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.