

Caracterización de sistemas microparticulados poliméricos obtenidos mediante precipitación controlada.

Priotti J, Leonardi D, Lamas M.

Email: priotti.josefina@gmail.com

IQUIR – CONICET, Facultad de Ciencias Bioquímicas y Farmacéuticas, UNR. Suipacha 531, 2000, Rosario, Argentina.

Introducción: El albendazol (ABZ) es un carbamato benzimidazólico de amplio espectro utilizado en el tratamiento de enfermedades helmínticas. Sin embargo, presenta problemas de absorción luego de ser administrado oralmente, debido a su escasa solubilidad en agua (1µg/mL). Esto lleva a una biodisponibilidad baja y variable. Los sistemas microestructurados pueden mejorar la solubilidad de este tipo de compuestos al aumentar el área superficial efectiva y, por tanto, la velocidad de disolución. Dentro de los sistemas microestructurados encontramos a las micropartículas poliméricas (MPs). Las mismas pueden ser obtenidas por precipitación controlada empleando soluciones acuosas de polímeros hidrofílicos y solventes no acuosos en donde se solubiliza al fármaco.

Objetivos: Diseñar, preparar y caracterizar MPs de ABZ por precipitación controlada para alcanzar una mejora en el tratamiento de la triquinelosis.

Materiales y métodos: El procedimiento consistió en gotear una solución de ABZ en ácido acético:etanol 1:1,5 sobre soluciones acuosas de distintos polímeros (derivados celulósicos y quitosano, en dos concentraciones diferentes), con o sin el agregado de Poloxámero 388. Las suspensiones resultantes fueron secadas por aspersión. Se determinó el tamaño y la morfología de las MPs a partir de imágenes de microscopía electrónica de barrido. Además se realizaron los siguientes ensayos de caracterización: rendimiento, estructura cristalina por difracción de rayos, equilibrio de solubilidad, velocidad de disolución y actividad antihelmíntica *in vitro* en nematodos adultos de *Trichinella spiralis*.

Resultados: Los rendimientos variaron de acuerdo a la composición de la solución acuosa empleada. Las MPs presentaron un tamaño entre 5 y 20 µm y una morfología esférica. El difractograma de rayos X del ABZ exhibió varios picos de reflexión revelando su naturaleza cristalina mientras que los difractogramas de las MPs mostraron patrones amorfos indicando una transición de la estructura cristalina del ABZ. En los equilibrios de solubilidad se logró quintuplicar la solubilidad aparente del ABZ. En los perfiles de disolución de ABZ cargado en las MPs, dos de los sistemas exhibieron una liberación del 100% a los 30 minutos, mientras que el ABZ sin microencapsular alcanzó sólo un 2,8%. El ensayo en nematodos adultos mostró que, para alcanzar un efecto, se necesitó una menor dosis de ABZ cuando se encontraba incluido en las MPs que cuando no lo estaba.

Conclusión: El aumento en la solubilidad y la velocidad de disolución del ABZ en las MPs se traduce en un aumento en la cantidad de fármaco disponible para actuar y, en una mayor eficacia.