

FORMULACIÓN DE SISTEMAS MICELARES DE ALBENDAZOL PARA EL TRATAMIENTO ORAL DE LAS HELMINTIASIS

Priotti, J.; Leonardi, D.; Lamas, M.C.; Picó, G.

FBioyF-UNR, IPROBYQ – CONICET - Rosario, Santa Fe.

Introducción:

El albendazol (ABZ) es un compuesto benzimidazólico con demostrada actividad antihelmíntica. Actualmente se encuentra disponible en el mercado en forma de comprimidos o suspensiones de administración oral. Su absorción en el tracto gastrointestinal es limitada y errática debido a su escasa solubilidad acuosa. Presenta efectos adversos severos, tales como irritación gastrointestinal, náuseas y vómitos.

La solubilización del ABZ a través de sistemas micelares podría mejorar la absorción y la biodisponibilidad, como así también disminuir los efectos adversos.

La espectroscopía de fluorescencia es una técnica analítica que permite estudiar la solubilización de estos sistemas dado que el ABZ presenta un grupo fluoróforo en su estructura, el anillo imidazólico. La emisión de fluorescencia es incrementada cuando el fluoróforo está incluido en la micela. Además, puede estudiarse la posición del fluoróforo dentro de la micela a través del análisis de la extinción de la fluorescencia. Midiendo la disminución de la emisión ante el agregado de una sustancia que genera choque entre las moléculas se pueden obtener los valores de constantes de Stern-Volmer que están directamente relacionados con la capacidad del extintor para acceder al fluoróforo.

Objetivo:

Diseñar sistemas micelares estudiando la capacidad de distintos surfactantes para solubilizar al ABZ empleando espectroscopía de fluorescencia.

Materiales y métodos:

Se prepararon diferentes soluciones micelares empleando como surfactantes: polisorbato 80 (P80), poloxamer 407 (P407), colato (C) y desoxicolato de sodio (DC) en soluciones de buffer fosfato/citrato a diferentes valores de pH. Se midió la intensidad de fluorescencia del ABZ en función de la concentración de cada surfactante. Las longitudes de onda de excitación y emisión fueron 294 nm y 350 nm, respectivamente. A partir de las curvas de cambios de intensidad de fluorescencia en función de la concentración de surfactante se obtuvieron los moles necesarios para solubilizar un mol de ABZ.

Resultados:

A partir de los ensayos realizados se obtuvieron los siguientes resultados: se requirieron 141 moles de P80 y 15-23 moles de P407 para solubilizar un mol de ABZ a pH 4. A pH 6, fue necesario duplicar la cantidad de ambos surfactantes para solubilizar la misma

cantidad de ABZ. Respecto a las sales biliares, 4930 moles de C y 3022 de DC fueron necesarios para solubilizar un mol de ABZ a pH 7.

Conclusión:

Los surfactantes P80 y P407 presentaron una mayor capacidad de solubilización que las sales biliares y serían útiles en el diseño de formas farmacéuticas orales de ABZ en solución.