

Triagem de polímeros/carreadores para o desenvolvimento de dispersões sólidas amorfas

Estudante de Graduação Autor: Melissa Viana de Almeida

Colaboradora: Ana Paula dos Santos Cardoso

Alcindo Aparecido Dos Santos

Orientador: Gabriel Lima Barros de Araujo

Faculdade de Ciências Farmacêuticas (FCF-USP)/Universidade de São Paulo

melissavalmeida04@usp.br

Objetivos

A solubilidade aquosa limitada de novos candidatos a fármacos continua sendo um desafio crítico no desenvolvimento de medicamentos. Este estudo teve como objetivo melhorar a solubilidade do oxi-cloro teluro anisol (Te-18OH), um novo metalofármaco com atividade antitumoral promissora, mas baixa solubilidade em pH fisiológico.

Métodos e Procedimentos

Dispersões sólidas amorfas (ASDs) de oxi-cloro telúrio anisólico (Te-18OH) foram preparadas pelo método de evaporação de solvente, utilizando 14 diferentes polímeros hidrofílicos na proporção 1:3 (fármaco:polímero). O estado amorfo das formulações obtidas foi inicialmente avaliado por microscopia de luz polarizada. A solubilidade em equilíbrio foi determinada em tampões fisiológicos com diferentes valores de pH (1,2; 4,5; 6,8; 7,4). A caracterização físico-química incluiu difração de raios X para avaliar a cristalinidade e análise térmica (TG/DSC) para investigar estabilidade térmica.

Resultados

Os resultados mostraram que alguns polímeros hidrofílicos apresentaram maior capacidade de formar dispersões predominantemente amorfas, reduzindo a recristalização do Te-18OH. Nos estudos de solubilidade, observou-se maior dissolução em meio ácido (0,85 mg/mL a pH 1,2 após 24 h), com queda acentuada da solubilidade em pH neutro e básico (~0,01–0,04 mg/mL). A difração de raios X confirmou que o composto puro apresenta caráter cristalino, enquanto a análise térmica demonstrou estabilidade até aproximadamente 110 °C.

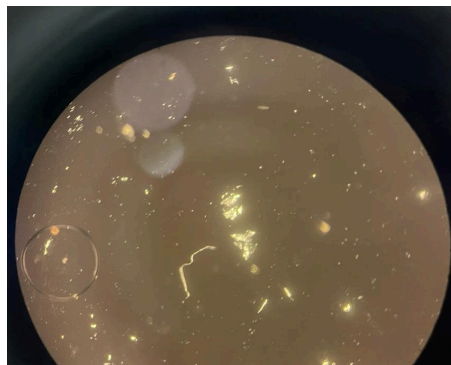


Figura 1: Oxi-cloro teluro anisol puro observado por microscopia utilizando luz polarizada



Figura 2: amostra contendo Te-18OH:PVP K17 (1:3) observada por microscopia utilizando luz polarizada

Conclusões

Os resultados indicam que a preparação de ASDs é uma estratégia eficaz para converter o Te-18OH em sua forma amorfa e melhorar significativamente seu perfil de solubilidade. A caracterização adicional das dispersões mais promissoras está em andamento. Essa abordagem apoia o desenvolvimento de uma formulação oral viável para estudos pré-clínicos, potencializando a aplicação terapêutica do Te-18OH como novo agente anticâncer.

Os autores declaram não haver conflito de interesses.

Os autor A, B e C conceberam e planejaram o estudo. Os autores A e B realizaram a coleta e análise dos dados. Os autores A, B e C participaram da redação e revisão final do manuscrito. Todos os autores aprovaram a versão final do resumo.

Agradecimentos

O presente trabalho foi realizado com apoio da Fundação de Amparo à Pesquisa do Estado de São Paulo (FAPESP), Brasil. Processos nº2024/14953-4 G. L. B. de Araujo agradece ao Conselho Nacional de Desenvolvimento Científico e Tecnológico (CNPq), Brasil, pela Bolsa de Produtividade em Desenvolvimento Tecnológico e Extensão Inovadora (DT), processo nº 304477/2022-2.

Referências

ALVES, L. D. S. et al. Avanços, propriedades e aplicações de dispersões sólidas no desenvolvimento de formas farmacêuticas sólidas. *Revista de Ciências Farmacêuticas Básica e Aplicada*, v. 33, n. 1, 1 jan. 2012.

FILHO, L.; DE, P. Estudos da biodisponibilidade e bioequivalência de medicamentos com alimentação: fundamentos e critérios de execução. text—[s.l.] Universidade de São Paulo, 16 set. 2005.

NETO, I. F. DA S. et al. Aplicação dos metalofármacos na terapia de cânceres: uma revisão de literatura. *Estação Científica*, v. 16, n. JUL./DEZ., 2022.

SREDNI, B. Immunomodulating tellurium compounds as anti-cancer agents. *Seminars in Cancer Biology, Cancer Immunotherapy*. v. 22, n. 1, p. 60–69, 1 fev. 2012.