

B0401

SISTEMA DE LIBERAÇÃO SUSTENTADA PARA O ANESTÉSICO LOCAL PRAMOXINA

Cíntia Matsumoto (Bolsista PIBIC/CNPq e FAPESP) e Profa. Dra. Eneida de Paula (Orientadora), Instituto de Biologia - IB, UNICAMP

Anestésicos locais (AL) são compostos cuja atividade farmacológica envolve o bloqueio reversível da condução nervosa causada pela inibição do processo de excitação-condução em nervos periféricos, não permitindo a percepção da dor. A pramoxina (PMX) diferente dos AL mais comuns, é um amino-éter. Nesse estudo foi preparado e caracterizado um novo sistema de liberação sustentada para PMX, utilizando lipossomas unilamelares de 400 nm (compostos de fosfatidilcolina de ovo, EPC, colesterol e α -tocoferol na razão molar de 4:3:0,07) como carreador, com a finalidade de melhorar as propriedades farmacológicas da PMX. Foram determinadas as propriedades óticas da PMX na região do UV ($\lambda_{\text{máx}} = 286 \text{ nm}$ e coeficiente de absorvidade molar = $3072 \text{ M}^{-1} \cdot \text{cm}^{-1}$ e $\lambda_{\text{em}} = 324 \text{ nm}$, em pH 7,4) e sua constante de dissociação ($\text{pK}_a = 7$). A solubilidade (S) da PMX foi medida em diferentes pH (S pH 5,5 > 2M; pH 7,4 = 4,6mM e pH 10,5 = 1,2mM). O coeficiente de partição (P) determinado em pH 7,4 entre lipossomas multilamelares de EPC/água foi igual a 399 ± 54 (eficiência de encapsulação, EE= $76\% \pm 10$) e em lipossomas convencionais (EPC:colesterol: α -tocoferol) P = 841 ± 128 (EE= $80\% \pm 2$). A estabilidade físico-química do sistema (medida pelo tamanho e peroxidação lipídica dos lipossomas) se mostrou satisfatória em até 120 dias de armazenamento na temperatura de 5°C . Em ensaios de cinética a PMX lipossomal mostrou taxa de liberação mais lenta em relação à PMX não encapsulada enquanto testes *in vitro*, em cultura de células 3T3 revelaram menor citotoxicidade para a formulação lipossomal de PMX, comparada com pramoxina em solução aquosa. Esses resultados demonstram vantagens na encapsulação deste anestésico local em sistema lipossomal para liberação sustentada.

Pramoxina - Lipossoma - Liberação sustentada