

Avaliação da permeabilidade in vitro da eremantolida C pelo método PAMPA

LAIS FERNANDES (Autor), JACQUELINE DE SOUZA (DEFAR) (Orientador), DENIA ANTUNES SAUDE GUIMARAES (Co-Orientador), TAMIRES GUEDES CALDEIRA (Colaborador)

Determinar a permeabilidade de fármacos é etapa primordial para prever sua biodisponibilidade in vivo. Associado aos resultados de solubilidade, a permeabilidade é apontada pelo Sistema de Classificação Biofarmacêutica como parâmetro útil na previsão da absorção. Dentre os métodos in vitro para avaliação da permeabilidade, o ensaio de permeabilidade em membrana artificial paralela (PAMPA) tem sido empregado por reproduzir o transporte passivo, predizendo o comportamento in vivo de substâncias biologicamente ativas, como a eremantolida C (EREC), lactona sesquiterpênica presente na espécie *Lychnophora trichocarpa*, que vem sendo estudada por suas atividades farmacológicas e baixa toxicidade. Assim, o objetivo deste trabalho foi avaliar a permeabilidade in vitro da EREC. Primeiramente foi realizada a validação do método analítico para quantificação da EREC nos meios fluido intestinal simulado sem enzimas (FISSE pH 6,8) e tampão fosfato (TF pH 7,4) por CLAE com detecção no ultravioleta a 267 nm, utilizando coluna cromatográfica C18 (150x4,6mm; 3 μ m) e fase móvel composta por acetonitrila:água (50:50 v:v), temperatura de 30°C, fluxo de 1,0mL/minuto e volume de injeção de 25 μ L. O método foi linear na faixa de 0,01 a 0,325 mmol/L, seletivo, preciso e exato. A avaliação da permeabilidade pelo PAMPA foi realizada utilizando-se no compartimento doador o FISSE contendo EREC e como compartimento receptor, o TF. O filtro foi impregnado com 5 μ L de solução de fosfatidilcolina a 5% em dodecano, e as placas foram incubadas à 37°C por 5 horas sob agitação de 50 rpm. A EREC foi classificada como substância de alta permeabilidade, pois apresentou permeabilidade efetiva de 30,4x10⁻⁶ cm/s, resultado superior ao propranolol (9,2x10⁻⁶ cm/s), fármaco padrão de alta permeabilidade em PAMPA. Assim, a alta permeabilidade aliada às atividades farmacológicas e baixa toxicidade, demonstram a importância da EREC como candidato a fármaco. Agradecimentos: UFOP/CiPharma/Anvisa/FAPEMIG/Rede Toxifar/CNPq.

Instituição de Ensino: Universidade Federal de Ouro Preto