



Estratégias de vetorização de fármacos ao cólon

Catarina Nunes, Alexandra Ramos, Juliana Rodrigues, Marta Lourenço, Ana I Fernandes
Egas Moniz Center for Interdisciplinary Research (CiiEM); Egas Moniz School of Health & Science, 2829-511 Caparica, Almada, Portugal

Vetorização ao cólon

O cólon é considerado um **local de eleição** uma vez que o tratamento pode ser mais **efetivo se for direcionado**. É explorado como uma potencial alternativa para **aumentar a biodisponibilidade oral** de **proteínas, peptídeos** e outras **moléculas de origem biotecnológicas**, visto que estas são **alvo de intensa degradação enzimática e química** ao nível do trato GI superior. Dois tipos de abordagens podem ser utilizadas, **libertação retardada** ou **libertação específica** no cólon. Tem especial interesse no tratamento de doenças como doença de Crohn, cancro colorretal e colite ulcerativa.

Fatores que afetam a absorção colónica de fármacos

Fisiológicos

- pH
- Degradação enzimática
- Tempo de permanência no local
- Microflora intestinal

Patológicos

- Colite ulcerosa
- Doença de Crohn
- Cancro colorretal

Sistemas osmóticos

- São compostos por um **compartimento osmótico** e por outro que contém a substância ativa, rodeados por uma **membrana semipermeável** onde existe um orifício para a saída do fármaco.
- Este dispositivo é revestido por uma membrana entérica que se **dissolve ao contactar com o fluído intestinal**, o que permite a **entrada de água no sistema**, intumescendo o compartimento osmótico e promovendo a **saída controlada de fármaco** do sistema farmacêutico.

Sistema OSMET®

Sistemas dependentes do pH

Estes sistemas consistem em **revestimentos com polímeros insolúveis** em pH ácido e que **são solúveis em pH ligeiramente alcalino**.

Eudragit®

Polímeros do **ácido metacrílico** e **metilmetacrílico**

CODES®

Sistema tempo-pH dependente **ativado pela microflora do colón**, sendo que é mais específico e eficaz

Sistemas dependentes do tempo

É fácil modular a libertação de um fármaco a partir de um sistema, de forma a controlar o local de absorção.

Sistema Pulsincap®

- Consiste numa "**rolha**" **solúvel em água** e num **corpo insolúvel e impermeável com fármaco** e selado com um tampão de hidrogel. Em contato com fluidos aquosos, a "**rolha**" começa a intumescer até ser expulsa do corpo, permitindo assim a **libertação do fármaco**.

Sistema Pentasa®

- A libertação da substância ativa faz-se por um processo **combinado de erosão e difusão**, através da camada gelificada que se forma por **contacto do sistema farmacêutico com os fluidos orgânicos**.

Sistema Chronotropic®

- O sistema baseia-se numa **camada de polímero hidrofílico expansível**, responsável pelo retardado início da libertação, aplicado a núcleos contendo fármacos de natureza diversa.



Sistemas revestidos por polímeros biodegradáveis

São **degradados** especificamente por **bactérias** da microflora do **colón**.

Têm que obedecer a certos requisitos:

- **Proteger** o fármaco na parte superior do tubo gastrointestinal;
- Assegurar uma **libertação rápida** da substância ativa quando chega à zona alvo.

Os sistemas devem:

- **Susceptíveis de degradação** pelas bactérias do cólon, solúveis ou dispersíveis em solventes
- **Insolúveis** em água
- **Formar filmes** de revestimentos
- **Não** apresentar **toxicidade**

Exemplos:
Inulina
Quitossano
Amilose

Referências Bibliográficas

Gazzaniga, A., Maroni, A., Sangalli, M. E., & Zema, L. (2006). Time-controlled oral delivery systems for colon targeting. *Expert Opinion on Drug Delivery*, 3(5), 583–597. <https://doi.org/10.1517/17425247.3.5.583>
Philip, A. K., & Philip, B. (2010). Colon Targeted Drug Delivery Systems: A Review on Primary and Novel Approaches. *Oman Medical Journal*, 25(2), 79. <https://doi.org/10.5001/OMJ.2010.24>