

IMPORTÂNCIA E AVANÇOS DOS MÉTODOS DE LIBERAÇÃO FARMACÊUTICA¹

Luiza Lúcilé Pereira Monteiro², Jaqueline Aparecida Eufrásio Monteiro³, Gisele Iriane Gomes da Costa⁴, Jussara Christina Rodrigues⁵, Renata Kelly Soares⁶, Raquel Moreira Maduro de Carvalho⁷

Resumo: *A grande indagação das indústrias farmacêuticas é obter um método para que o fármaco seja absorvido completamente sem a alteração de suas propriedades físico- químicas e biológicas, obtendo eficácia terapêutica com baixo custo tanto para a indústria quanto para o usuário. Os comprimidos, grânulos e os fármacos em geral, necessitam de um revestimento para que haja proteção contra agentes externos e conservação das propriedades do fármaco utilizado. Diante disso, o campo farmacêutico tem-se ampliado e as indústrias têm investido em novas tecnologias de produção de sistemas de liberação de sólidos orais.*

Palavras-chave: *Indústria farmacêutica, fármaco, revestimento, sistemas de liberação*

Abstract: *The greatest quest made by the pharmaceutical market is to obtain a method in which the medicaments can be completely absorbed without changing its physical-chemical and biological properties, achieving therapeutic effectiveness with a low cost not only to the industry, but also to the user. The pills, granules and the medicaments in general need a coating that can protect them from external agents so it can maintain their properties when they are consumed. In light of this, the pharmaceutical field has expanded and the industries have been investing in new production technologies for oral solid releasing systems.*

¹ Trabalho Extra-Classe da disciplina Físico-Química Aplicada a Farmácia;

² Graduanda em Farmácia – FACISA/UNIVIÇOSA. e-mail: luizalucile@hotmail.com

³ Graduanda em Farmácia – FACISA/UNIVIÇOSA. e-mail: jaquelinemonteiro374@yahoo.com

⁴ Graduanda em Farmácia – FACISA/UNIVIÇOSA. e-mail: giselecostaufv@hotmail.com

⁵ Graduanda em Farmácia – FACISA/UNIVIÇOSA. e-mail: jussara-christina@hotmail.com

⁶ Graduanda em Farmácia – FACISA/UNIVIÇOSA. e-mail: renata_soares2008@hotmail.com

⁷ Professora – FACISA/UNIVIÇOSA. e-mail: raquelmaduro@gmail.com

Keywords: *Coating, medicaments, pharmaceutical industries, releasing systems*

Introdução

O revestimento de formas farmacêuticas é um dos mais antigos processos, sendo um importante passo no desenvolvimento de novas formas farmacêuticas ou na otimização das existentes (GIBSON, 2009).

O processo de revestimento do fármaco irá consistir na aplicação de um material sobre a superfície externa da partícula sólida, o que lhe irá conferir benefícios e propriedades em relação à forma não revestida do fármaco. Esta tecnologia de revestimento para a indústria farmacêutica permite a produção de sistemas sólidos orais com elevado desempenho estético passando pelo gastro resistente (MENEGUIM, CURY e EVANGELISTA, 2014).

Os termos liberação prolongada, lenta ou sustentada são aplicados às formas farmacêuticas desenvolvidas para liberarem o fármaco gradualmente, mantendo a concentração plasmática em níveis terapêuticos, por um período de tempo prolongado (LORDI, 2001). Todavia, o recurso de excelência gerado por este processo encontra-se representado pelo sistema de liberação específica de fármacos (MENEGUIM *et al.*, 2014).

Além do controle da liberação de fármacos, há outras vantagens relacionadas a este procedimento, como melhora da estabilidade de fármacos ao proteger da exposição destrutiva da luz e dos agentes atmosféricos; tornar mais agradável o medicamento quando este for de sabor ou odor desagradável; obter perfis de liberação modificados, como o revestimento entérico; e proporcionar qualidades estéticas e diferenciadas ao produto (MOURA, 2005).

Desta forma, o objetivo deste trabalho é relatar a aplicação de revestimentos em formas farmacêuticas sólidas e os seus avanços, tanto para a indústria farmacêutica quanto para usuários destes medicamentos revestidos.

Material e Métodos

A metodologia utilizada no presente trabalho foi uma busca eletrônica nos bancos de dados da Science, Scielo, Portal Capes, Revista de Ciências Farmacêuticas Básica e Aplicada, Revista Eletrônica de Farmácia, Revista Brasileira de Farmácia e Revista Química Nova. As palavras-chaves utilizadas na elaboração deste artigo foram: indústria farmacêutica, fármaco, revestimento e sistemas de liberação. Foram também selecionados artigos de livre acesso da língua portuguesa nos quais mostram estudos principalmente de revestimentos de formas farmacêuticas sólidas com ênfase na aplicação de revestimentos dos fármacos. Todavia, foram utilizados livros especializados na área de Tecnologia de Medicamentos para a elaboração deste estudo.

Resultados e Discussão

As indústrias farmacêuticas tem o constante desafio de encontrar métodos eficazes de revestimento de fármacos. As aplicações do revestimento farmacêutico nas indústrias possuem diversas técnicas, sendo algumas delas o revestimento por açúcar, por imersão, com pó, por compressão e por filme (VIANA, 2006). Os principais pré-requisitos para o revestimento eficaz é a adesão da película ao núcleo de forma perfeita e a ausência de qualquer irregularidade que passa afetar a integridade da película e seu desempenho. O revestimento por açúcar, polímero e filme, terá maior ênfase, pois são revestimentos de grande importância. O revestimento por açúcar ou drageamento é o método mais antigo de revestimento de formas farmacêuticas sólidas (MOURA, 2005). Este processo foi utilizado aproximadamente até a década de 60. As vantagens dos medicamentos revestidos em geral, inclusive o de açúcar são de mascarar o sabor do medicamento; possuir menor risco de contaminação de microrganismos; proteger contra umidade, ar ou luz; facilitar a deglutição; preservar as propriedades físicas e químicas do fármaco; melhorar a aparência do medicamento; entre outros (MOURA, 2005).

Entretanto, o revestimento por açúcar começou a apresentar desvantagens tais como, apresentam alto custo de produção e a sua fabricação necessita de vários estágios de produção; não é recomendado para pessoas diabéticas; possuem alisamento insuficiente, ou seja, apresentam aspectos parecidos com “casca de laranja”; e o revestimento pode apresentar rachaduras devido à secagem incorreta. Contudo, após a década de 60, os pesquisadores desenvolveram uma nova técnica tais como os polímeros para o revestimento.

Os polímeros são carreadores hidrossolúveis que melhoram a solubilidade de vários medicamentos que são poucos hidrossolúveis, pois, aumentam a solubilidade do fármaco e a dissolução no organismo propiciando absorção rápida.

O revestimento mais utilizado atualmente é o revestimento por filmes. Este tipo de revestimento também é chamado de revestimento peliculado e utiliza polímeros na sua formulação (VIANA, 2006). Além das vantagens dos medicamentos revestidos, este tipo apresenta um revestimento mais fino, pode ser revestido a base de solução aquosa ou por solventes orgânicos, apresenta ótima durabilidade e resistência a rachaduras, o seu processo de fabricação é rápido com economia de mão – de – obra, tempo, e matéria prima, a alteração do seu tamanho, peso, e forma é mínima e apresenta uma boa aparência (BAZZO & SILVA, 2005). Uma das poucas desvantagens deste revestimento é que o processo de evaporação da solução aquosa é um pouco lento e alguns solventes orgânicos podem ser explosivos, liberam agentes tóxicos e poluem o ambiente e possuem um alto custo para a recuperação do solvente.

Para cada tipo de polímero empregado no revestimento de núcleo há uma característica e aplicação. Independente do polímero de revestimento dos comprimidos o objetivo é modificar e tornar mais eficaz o perfil de liberação do princípio-ativo (BAZZO & SILVA, 2005).

Dos sistemas de liberação de fármacos, temos os sistemas que são os mais usados: o sistema monolítico, que consiste em unidades funcionais de liberação única, ou seja, comprimidos ou cápsulas, como por exemplo o Sporanox® (cápsulas de Itraconazol); e o sistema multiparticulado, que consiste

em fármacos divididos em várias subunidades funcionais de liberação, ou seja, em formas de grânulos, minicomprimidos ou pellets. Estas formas farmacêuticas são de liberação prolongada. Outra técnica que atualmente está sendo muito usada pelo campo farmacêutico é a dispersão sólida amorfa, pois, este tipo de dispersão não possui forma definida e consiste na diminuição da partícula do fármaco com um aumento da uniformidade e da superfície de contato. Estes tipos de medicamentos vêm ganhando espaço na indústria farmacêutica e vem sendo prescrito para crianças, devido á sua espessura e tamanho.

Considerações Finais

Na indústria farmacêutica há uma grande procura por técnicas de preparação, revestimento e dispersão de medicamentos, buscando melhorar a estabilidade, dissolução, absorção e eficácia terapêutica do fármaco. Estes métodos além de serem importantes para a indústria são benéficos para o usuário, pois, o medicamento apresenta tamanho reduzido, não apresenta sabor desagradável sendo fácil a sua deglutição e na sua maioria apresentam preços baixos, propiciando acessibilidade a todos e a melhoria na saúde.

Referências Bibliográficas

BAZZO, G.C. & SILVA, M.A.S. Estudo termooanalítico de comprimidos revestidos contendo captopril através de termogravimetria (TG) e calorimetria exploratória diferencial (DSC). Rev. Bras. Cienc. Farm., 41(3): 315-322, 2005.

GIBSON, M. Introduction and perspective. In: Gibson M, editor. Pharmaceutical pre formulation and formulation: a practical guide from candidate drug selection to commercial dosage form. New York: Informa Healthcare; p.1-10, 2009.

LORDI, N. G. Formas farmacêuticas de liberação prolongada. In: LACHMAN, L.; LIEBERMAN, H. A.; KANING, J. L. (Eds.). Teoria e prática na indústria farmacêutica. Lisboa: Fundação Calouste Gulbenkian, cap.14, p.737-781, 2001.

MENEGUIN, A. B.; CURY, B. S. F.; EVANGELISTA, R. C.; Carbohydr. Polym.; p. 99, 140. 2014.

MOURA, E. Tecnologia de Obtenção de Revestimento Aquoso Gastro-resistente para Comprimidos de Bisacodil 5m - Pré-formulação e Desenvolvimento do Processo de Revestimento, 63 p. 2005.

VIANA, O.S. et al. Desenvolvimento de formulações e tecnologia de obtenção de comprimidos revestidos de efavirenz . terapia anti-HIV. Revista Brasileira de Ciências Farmacêuticas, 42 (4): 505-511, 2006.