



Alternativas para o Tratamento da Esquistossomose: Caracterização Físico-Química do Complexo de Inclusão entre Praziquantel e Hidroxipropil- β -Ciclodextrina

Izabel S. CHAVES ¹, Stella G. RODRIGUES ¹, Nathalie F.S. MELO ³, Marcelo B. de JESUS ²,
Leonardo F. FRACETO ³, Eneida de PAULA ² & Luciana M.A. PINTO ^{1*}

¹ Departamento de Química, Universidade Federal de Lavras,
Caixa Postal: 3037, Lavras – MG, CEP: 37200-000, Brasil;

² Departamento de Bioquímica, Instituto de Biologia, Universidade Estadual de Campinas;

³ Departamento de Engenharia Ambiental, Universidade Estadual Paulista Júlio de Mesquita

RESUMO. O praziquantel (PZQ) é o fármaco de escolha no tratamento da esquistossomose. Porém, ele apresenta baixa solubilidade aquosa, o que pode limitar a sua biodisponibilidade no organismo. Para contornar estas características foi feita a inclusão da molécula do PZQ em hidroxipropil-beta-ciclodextrina (HP- β -CD). Desta forma, o objetivo deste trabalho foi preparar e caracterizar o complexo de inclusão PZQ/HP- β -CD. Estudos morfológicos, espectroscópicos e de calorimetria diferencial de varredura, demonstraram os primeiros indícios da interação hóspede/hospedeiro. Analisando a cinética de incorporação da molécula de PZQ na cavidade da HP- β -CD, pode-se determinar a constante cinética, além do tempo para equilíbrio do sistema. Utilizando-se isoterma de solubilidade foi possível observar que a interação com HP- β -CD aumentou a solubilidade aquosa do PZQ em 2,4 vezes. Ensaios de citotoxicidade *in vitro*, utilizando fibroblastos, demonstraram não haver indícios de toxicidade para estas células, nas concentrações testadas. Os resultados indicam que há um potencial favorável da aplicação deste fármaco na forma complexada em HP- β -CD.

SUMMARY. “Alternatives for the Treatment of Schistosomiasis: Physico-Chemical Characterization of an Inclusion Complex Between Praziquantel and Hydroxypropyl- β -Cyclodextrin”. Praziquantel (PZQ) is the drug of choice commonly used for the treatment of schistosomiasis. However, it has low aqueous solubility, which could limit its bioavailability in the body. To circumvent these features, an inclusion complex with hydroxypropyl-beta-cyclodextrin (HP- β -CD) was prepared. Thus, the objective of this work was to prepare and characterize the PZQ/HP- β -CD inclusion complex. Morphological, spectroscopic, and calorimetric analysis showed the first signs of the guest/host interaction. The complexation kinetic analysis was used to determine the kinetic constant and, besides that, it was possible to establish the time consumed to reach equilibrium. Using the solubility isotherm, it was observed that the interaction with HP- β -CD increased 2.4 fold the aqueous solubility of plain PZQ. *In vitro* cytotoxicity tests, using fibroblast cells, evidenced no toxicity for these cells at the concentrations tested. These results demonstrated that there is a potential use of PZQ in formulations with HP- β -CD.

PALAVRAS-CHAVE: Ciclodextrina, Complexo de inclusão, Esquistossomose, Praziquantel.

KEY WORDS: Cyclodextrin, Inclusion complex, Praziquantel, Schistosomiasis.

* Autor a quem a correspondência deve ser enviada: E-mail: luca@dqi.ufla.br