

Vehiculización de Antralina en Coageles de n-alkil derivados del Ácido Ascórbico

Santiago PALMA ¹, Ruben MANZO ¹, Pierandrea LO NOSTRO ²,
Laura FRATONI ² y Daniel ALLEMANDI ¹

¹ *Departamento de Farmacia, Fac. de Ciencias Químicas, Universidad Nacional de Córdoba. Ciudad Universitaria - 5000 - Córdoba - Argentina.*

² *Dipartimento di Chimica e CSGI, Università di Firenze, via della Lastruccia 3, 50019 Sesto Fiorentino - Italy.*

RESUMEN. Los tratamientos antipsoriásicos utilizando antralina presentan varias desventajas debido principalmente a las propiedades físico-químicas de ésta, a sus efectos adversos y a su formulación. La antralina es insoluble en agua, químicamente inestable y produce ardor y tinción en la zona de aplicación y vestimentas. En el presente trabajo se evalúa la potencial vehiculización de antralina en agregados supramoleculares de derivados n-alcúlicos del ácido ascórbico (ASCn) con el objeto de obtener nuevas formas farmacéuticas semisólidas (FFsS). Estos sistemas presentan un gran potencial de solubilización de drogas y la presencia del grupo ascorbilo provee un efecto estabilizante para drogas con problemas de estabilidad en medio acuoso. Se estudiaron propiedades como solubilización de la droga en las dispersiones coloidales, determinación de la capacidad de carga en los coageles, efecto del agregado de co-solventes sobre estas propiedades, estabilidad de antralina en los coageles y sus propiedades reológicas. La solubilidad aparente de antralina fue significativamente incrementada en los agregados supramoleculares de ASCn. El agregado de co-solventes como PEG aumentó varias veces la capacidad de carga de antralina en coageles de ASC16. Asimismo, la estabilidad de la droga fue dramáticamente incrementada en estos sistemas en comparación con soluciones etanólicas de antralina.

SUMMARY. "Vehiculation of Anthralin into n-alkyl Ascorbic Acid Derivatives Coagels". Anthralin, vehiculated in semisolids pharmaceutical dosage forms, is used in pharmacological treatment of psoriasis. The physicochemical properties and the drug side effect difficult the design and utilization of suitable formulations. Anthralin has very low aqueous solubility, it is unstable and its efficacy remains hampered by the effects of irritation and staining of the perilesional skin. In this work, the potential vehiculation of anthralin into supramolecular aggregates of n-alkyl ascorbic acid derivatives (ASCn) was evaluated. These compounds can form supramolecular aggregates above critical micellar temperature (TMC) and liquids crystal structures ("coagels") as temperature decrease below TMC. This kind of systems showed high potential for drug solubilization and besides the ascorbyl moiety can contribute to stabilize the drug in the aggregate. Anthralin solubilization in ASCn colloidal dispersions and coagels, the effect of co-solvents on solubilization, drug stability in the coagels and its rheological properties were studied. The anthralin apparent solubility was significantly increased. The incorporation of PEG augmented several times the solubilization capacity of ASC16 coagels. Likewise, Anthralin stability was dramatically raised in these systems comparatively to ethanolic solutions of the drug.

PALABRAS CLAVE: Antralina, Coageles, Solubilización, Vitamina C.
KEY WORDS: Anthralin, Coagels, Solubilisation, Vitamin C.

* Autor a quien dirigir la correspondencia. E-mail: dalemand@dco.fcq.unc.edu.ar