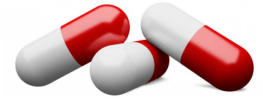




SISTEMAS DE LIBERACIÓN ENTÉRICA PARA EL TRATAMIENTO DE AFECCIONES LOCALES Y SISTÉMICAS

Ester Sánchez Sánchez

Trabajo Fin de Grado. Facultad de Farmacia. Universidad Complutense de Madrid



INTRODUCCIÓN Y ANTECEDENTES

Los sistemas de liberación modificada (SLM) son un tipo de formas farmacéuticas que liberan un principio activo a una velocidad y/o en una localización determinada en función de las necesidades terapéuticas, durante un período de tiempo específico.

De esta manera se optimizan los parámetros de eficacia y seguridad del fármaco.

SLM Administrados por vía oral :

- Sistemas de liberación prolongada
- Sistemas de liberación sostenida
- **SISTEMAS DE LIBERACIÓN RETARDADA**

No liberan el fármaco inmediatamente después de su administración.

Retrasan la liberación hasta intestino delgado, tal y como se muestra en este trabajo, o incluso hasta el colon.

OBJETIVOS:

Recopilar información sobre los sistemas de liberación retardada en intestino delgado con el fin de conocer:

- Sus orígenes y motivos de aparición
- Componentes de dichos sistemas
- Sistemas principales que se encuentran en el mercado
- Mecanismos y materiales usados en el desarrollo de dichos sistemas
- Actualidad y avances en este campo
- Aplicaciones en la terapéutica para el tratamiento de patologías sistémicas o locales

MATERIALES Y MÉTODOS:

La elaboración de este trabajo se ha llevado a cabo mediante una búsqueda bibliográfica en diferentes fuentes:

- Fuentes online: Artículos de Pubmed, Scopus o Science Direct y libros de texto en formato digital.
- Fuentes en formato físico: Libros de la Biblioteca de Farmacia de la UCM

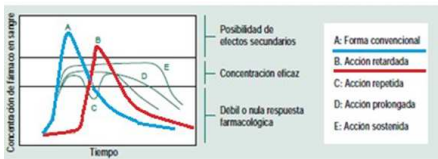
RESULTADOS Y DISCUSIÓN

1. Origen y necesidad de los sistemas de liberación entérica

Las cubiertas gastrorresistentes son el sistema más empleado para conseguir un retraso en la liberación. Los motivos de su origen y uso son:

- ✓ Proteger al principio activo de la degradación por el pH ácido de los jugos gástricos.
- ✓ Proteger al organismo de acciones nocivas del fármaco.
- ✓ Retrasar el momento en el que el fármaco se libera porque se busca un efecto local, un aumento de la biodisponibilidad o un tratamiento cronoterapéutico.
- ✓ Evitar, en terapias combinadas, la aparición de interacciones entre fármacos que se administran al mismo tiempo pero se liberan en distinto momento.

3. Sistemas y mecanismos utilizados



4. Novedades y desarrollo en la actualidad.

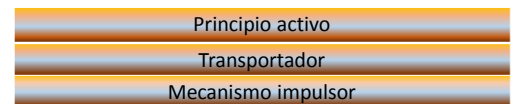
Las novedades en el campo de la liberación entérica, además de innovar y crear nuevos sistemas, están dirigidas fundamentalmente a:

- ❖ Mejorar el rendimiento de los sistemas ya existentes.
- ❖ Combinar sistemas de liberación entérica con otros de liberación prolongada o sostenida.
- ❖ Desarrollar mejoras en los ensayos in vitro para garantizar reproducibilidad in vivo.
- ❖ Estudiar en mayor profundidad los excipientes utilizados en estos sistemas y realizar modificaciones sobre ellos con el fin de obtener un mayor rendimiento.

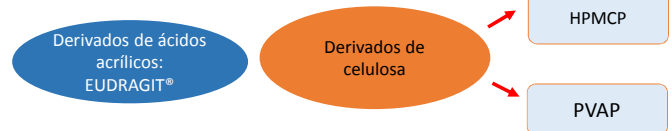
5. Tratamiento de afecciones locales y sistémicas

Fundamentalmente se emplean para la administración sistémica de fármacos; en menor medida para la acción local intestinal.

2. Componentes de una formulación de liberación entérica

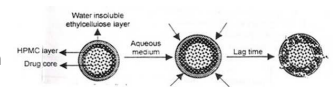


Sistemas pH-dependientes: en los que la liberación del p.a. depende del pH en el que se encuentran. Son sistemas recubiertos de polímeros que resisten a pH<5, evitando así la liberación en estómago y retrasándola hasta el intestino delgado. Ejemplos de polímeros para recubrimiento entérico:

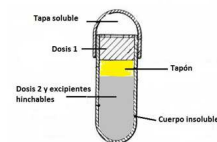


Sistemas tiempo dependientes: en los que se aprovecha el tiempo de permanencia en el tubo digestivo y las características físico-químicas de los excipientes para retrasar el comienzo de la liberación del principio activo. Ejemplos:

- Time-controlled Explosion System



- Sistemas pulsátiles



LOCAL	Ej. Prednisona, sulfasalazina.
SISTÉMICA	Ej. Abacavir, AAS, omeprazol, diclofenaco, melatonina, paclitaxel, pravastatina, telmisartán.

CONCLUSIONES

1. Estos sistemas se usan para proteger el p.a. y aumentar su biodisponibilidad.
2. Entre los sistemas comercializados más usados los encontramos recubiertos de polímeros gastrorresistentes, y sistemas tiempo dependientes.
3. Se emplean fundamentalmente para administrar principios activos de acción sistémica.

BIBLIOGRAFÍA

- Doménech Berrozpe J, Martínez Lanoa J, Plá Delfina J.M. Biofarmacia y farmacocinética. Vol.2: Biofarmacia. España: Síntesis. Capítulo 15, Preparados orales de cesión modificada. 319-321
- Peter J.tarcha. Polymers for Controlled Drug Delivery EEUU: CRCPress.Chapter 3: polymers for enteric coating applications.
- Thakral S, Thakral NK. Eudragit: a technology evaluation. Expert Opinion Drug Delivery 2013 Jan; 10(1):131-49
- Hata T, Asakura S, Yamaguchi H , Kotani M , Ueda Y. Development of a novel drug release system, time-controlled explosion system (TES). J Drug Target. 1994; 2(1):35-44
- Varum FJ, Merchant HA, Goyanes A. Accelerating the dissolution of enteric coatings in the upper small intestine: evolution of a novel pH 5.6 bicarbonate buffer system to assess drug release. Int J Pharm. 2014 Jul 1; 468(1-2):172-7