

Abstract

Project Code (รหัสโครงการ): TRG5080004

Project Title (ชื่อโครงการ): Development of novel zanamivir-liposomal formulations for avian influenza treatment and evaluation of intestinal absorption using human intestinal Caco-2 cell line

Investigator (ชื่อนักวิจัย): Dr. Boontarika Boonyapiwat
Department of Medical Sciences
Ministry of Public health

E-mail Address : boontarika.b@dmsc.mail.go.th

Project Period (ระยะเวลาโครงการ): 2 July 2007 – 2 July 2009

The liposomes loading zanamivir was developed and investigated in the intestinal Caco-2 monolayer in order to study whether liposomes are able to enhance the ability of zanamivir to be absorbed across biological membranes. By using reverse-phase evaporation method, liposomal formulation composed of Phospholipon[®] 90 G : cholesterol at a 7:3 molar ratio provided the highest entrapment efficiency of zanamivir at 31.17%. The result revealed that the cationic and anionic surfactants (stearylamine and dicetylphosphate) in the liposomal formulation did not enhance the entrapment efficiency of zanamivir. The reduction of liposome size did not statistically influence the entrapment efficiency of zanamivir into liposomes. The transport study suggested that the prepared liposomes increased the transport of zanamivir through Caco-2 cells by 3.27 folds. The reduction of liposome size enhanced the permeation of zanamivir across Caco-2 monolayer by 1.90 folds. The study concluded that liposomes with entrapped zanamivir were able to increase the permeability of zanamivir across Caco-2 monolayer, presumably increasing delivery of the drug via gastrointestinal tract. The future work will be the study on the permeation and pharmacokinetic study of liposomes with the entrapment of zanamivir *in vivo*.

Keywords: liposomes, zanamivir, Caco-2, transport study, absorption

Abstract

Project Code (รหัสโครงการ): TRG5080004

Project Title (ชื่อโครงการ): การพัฒนาระบบนำส่งยาต้านไวรัสไข้หวัดนก (zanamivir) ในรูปแบบไลโปโซมและประเมินการดูดซึมยาทางลำไส้โดยใช้เซลล์ Caco-2

Investigator (ชื่อนักวิจัย): ดร. บุญทริกา บุญญาวิวัฒน์
กรมวิทยาศาสตร์การแพทย์
กระทรวงสาธารณสุข

E-mail Address : boontarika.b@dmsc.mail.go.th

Project Period (ระยะเวลาโครงการ): 2 กรกฎาคม 2550 – 2 กรกฎาคม 2552

ไลโปโซมบรรจุยา zanamivir ได้รับการพัฒนาเพื่อศึกษาว่าไลโปโซมมีความสามารถเพิ่มการดูดซึมยา zanamivir ผ่านทางผนังลำไส้ได้หรือไม่โดยใช้ Caco-2 monolayer ในการศึกษา ไลโปโซมถูกเตรียมโดยวิธี reverse-phase evaporation พบว่าสูตรของไลโปโซมที่ประกอบด้วย Phospholipon® 90 G และ cholesterol ที่สัดส่วน 7:3 โมลาร์ สามารถบรรจุ zanamivir ได้สูงสุดที่ 31.17 เปอร์เซ็นต์ ผลการทดลองยังพบว่า สารลดแรงตึงผิวทั้งชนิดประจุบวก และลบ (stearylamine and dicetylphosphate) ที่ผสมในสูตรของไลโปโซม ไม่สามารถเพิ่มประสิทธิภาพการบรรจุยา zanamivir ได้ นอกจากนี้การลดขนาดของไลโปโซมไม่มีผลอย่างมีนัยสำคัญต่อการเพิ่มหรือลดประสิทธิภาพการบรรจุยา zanamivir ในไลโปโซม การศึกษาการดูดซึมยาพบว่าไลโปโซมที่เตรียมได้สามารถเพิ่มการซึมผ่านของยา zanamivir ในเซลล์ Caco-2 ได้ 3.27 เท่า และการลดขนาดไลโปโซมสามารถเพิ่มการซึมผ่านของยาได้ 1.90 เท่า เมื่อเปรียบเทียบกับไลโปโซมที่ไม่ได้ถูกลดขนาด การศึกษานี้สรุปได้ว่า ไลโปโซมที่บรรจุยา zanamivir สามารถเพิ่มการซึมผ่านของยาใน Caco-2 monolayer ได้ และงานวิจัยที่จะดำเนินการต่อไปในอนาคตคือการศึกษากลไกการดูดซึมของไลโปโซมที่เตรียมได้ในสัตว์ทดลอง

Keywords: ไลโปโซม, ชานามีเวีย, Caco-2, การศึกษาการซึมผ่าน, การดูดซึม