

O fosfato de sitagliptina (STG) é o primeiro fármaco de uma nova classe terapêutica chamada de inibidores da dipeptidil peptidase IV, utilizada para o tratamento do Diabetes Mellitus tipo 2. É comercializado na forma de comprimidos revestidos contendo 25, 50 e 100 mg de STG. O medicamento foi aprovado pelo FDA em 2006 e ainda não possui monografia em códigos oficiais. O objetivo desse trabalho foi desenvolver e validar um método analítico por cromatografia líquida de alta eficiência (CLAE) para a quantificação da STG na formulação, assim como, avaliar o potencial citotóxico dos produtos de degradação decorrentes da instabilidade do fármaco à luz. Nas análises utilizou-se STG SQR com 99,5% de pureza e comprimidos revestidos de 50 mg de STG. Os parâmetros analíticos avaliados na validação do método por CLAE foram: especificidade, linearidade, precisão, exatidão, limites de detecção e de quantificação e robustez. O ensaio de citotoxicidade foi realizado frente a amostras de STG degradadas na radiação UVC (254 nm) e o potencial citotóxico foi determinado pela medida da lactato desidrogenase liberada pela ruptura da membrana celular. As análises ocorreram no sistema cromatográfico Shimadzu 20A, equipado com amostrador automático e detector PDA. A busca de adequadas condições cromatográficas resultou na utilização de uma coluna analítica Waters C8 X-Bridge TM (250 mm x 4,6 mm, partícula 5 µm). O sistema foi operado isocraticamente a 25 ° C, com fase móvel composta por uma solução de trietilamina 0,3% e acetonitrila (75:25, v/v), com ajuste de pH e a detecção foi em 207 nm. O método desenvolvido por CLAE foi satisfatoriamente validado, e demonstrou ser específico, linear ( $r^2=0,9984$ ), preciso ( $DPR_{interm.}=1,21\%$ ), exato (99,08%), sensível ( $LD=0,0768 \mu\text{g/mL}$ ;  $LQ=0,2327 \mu\text{g/mL}$ ) e robusto. O ensaio de citotoxicidade demonstrou potencial citotóxico nas concentrações acima de 50 µg/mL (concentração inicial de STG), e não houve correlação entre a concentração da amostra e o dano causado na membrana celular.

Agradecimento: CNPq e LCQFar/UFRGS.