

The Effect of Polyethylene Glycol on Drug Content, Particle Morphology, and Carbamazepine Release Profiles of Sustained Release Microspheres prepared from Cellulose Acetate Butyrate

Betina ZANETTI-RAMOS ¹, Marli SOLDI ², Valdir SOLDI ² & Elenara LEMOS-SENNA ^{1*}

¹ Departamento de Ciências Farmacêuticas,

² Departamento de Química, Universidade Federal de Santa Catarina, Campus Trindade, CEP 88040-900, Florianópolis, SC, Brazil.

SUMMARY. Blends of cellulose acetate butyrate (CAB) and polyethylene glycol 1500 (PEG 1500) were used to prepare sustained release carbamazepine-loaded microspheres by the emulsion-solvent evaporation method. The effect of CAB molecular weight (MW 30000 or 70000) and addition of PEG 1500 to the formulations on drug content, particle size, and CBZ release rate were evaluated using a 2² factorial design. The CBZ encapsulation efficiency (%) and the drug content varied from 65 to 70% and from 20 to 24% (w/w), respectively. The mean particle diameter varied from 300 to 1400 µm. The addition of PEG 1500 to the formulations led to an increase in surface porosity due to the diffusion of this polymer towards the external phase of the emulsion. The absence of PEG 1500 in the particles was confirmed by FTIR. The statistical analysis revealed that the release rate of carbamazepine was significantly increased when CAB (MW 30000) and PEG 1500 were used to prepare the microspheres.

RESUMEN. “Efecto del Polietilenglicol sobre la Carga de fármaco, Morfología y Perfil de Liberación de Carbamazepina en Microesferas de Liberación Prolongada de Acetobutirato de Celulosa”. El objetivo del presente trabajo ha sido el de evaluar el efecto del peso molecular de acetobutirato de celulosa (ABC) (PM 30000 y 70000) y la presencia de polietilenglicol 1500 (PEG 1500) en el tamaño de microesferas preparadas a partir de mezclas de dichos polímeros mediante el método de emulsificación- evaporación del disolvente y cargadas con carbamazepina. Asimismo, se evaluó el perfil de liberación del fármaco a partir de las formulaciones, empleando un diseño experimental 2². Las formulaciones presentaron un tamaño medio entre 300 y 1400 µm, y una eficiencia de asociación y carga de fármaco entre 65-70% y 20-24%, respectivamente. La difusión del PEG para la fase externa de la emulsión resultó en una mayor porosidad de las partículas. El análisis estadístico de los resultados pone de manifiesto un aumento significativo en la liberación de carbamazepina a partir de los sistemas conteniendo ABC con peso molecular de 30000 y conteniendo el PEG 1500 en la fase interna de la emulsión.

KEY WORDS: Carbamazepine, Cellulose acetate butyrate, Microspheres, Polyethylene glycol, Polymeric blends.

PALABRAS CLAVE: Acetobutirato de celulosa, Carbamazepina, Mezclas poliméricas, Microesferas, Polietilenglicol.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: lemos@ccs.ufsc.br