



Chlorhexidine Digluconate-Loaded (Meth)Acrylic Microparticles: High Encapsulation Efficiency and Prolonged Release

Stella M.G. REINKE ¹, Márcio C.S. RASTELLI ^{1,2}, Rafaela GARCIA ³, Luís A. ESMERINO ⁴,
Josiane P. DE PAULA ³, Fábio A. DOS SANTOS ¹ & Paulo V. FARAGO ^{1,3} *

¹ State University of Ponta Grossa, Postgraduate Program in Dentistry, Ponta Grossa, Paraná, Brazil

² Regional University of Blumenau, Department of Dentistry, Blumenau, Santa Catarina, Brazil

³ State University of Ponta Grossa, Department of Pharmaceutical Science,
4748, Carlos Cavalcanti Ave., Zip Code 84030-900, Ponta Grossa, Paraná, Brazil

⁴ State University of Ponta Grossa, Department of Clinical
and Toxicological Analysis, Ponta Grossa, Paraná, Brazil

SUMMARY. The goal of this paper was to prepare (meth)acrylic microparticles containing chlorhexidine digluconate, a widely used antiseptic, by the non-aqueous emulsion/solvent evaporation method in order to achieve high encapsulation efficiency and a controlled drug release profile. Micrometer-sized, heat-stable and amorphous/non-crystalline formulations with drug-loading efficiencies higher than 90% were obtained. No change in FTIR assignments was recorded after the microencapsulation procedure. Drug-loaded (meth)acrylic microparticles as compressed tablets provided a remarkable decrease of dissolution rate of chlorhexidine digluconate changing the initial drug release profile to a biexponential kinetic model. In addition, microencapsulation did not compromise the antimicrobial activity of chlorhexidine digluconate. Therefore, these formulations are feasible carriers for controlled release of chlorhexidine digluconate and can be used into further innovative skin and oral products intended for a long-lasting antiseptic effect.

RESUMEN. El objetivo de este trabajo fue la preparación de micropartículas (met)acrílicas que contienen digluconato de clorhexidina, un antiséptico muy utilizado, por el método de evaporación de emulsión/disolvente no acuoso, con el fin de lograr una alta eficiencia de encapsulación y un perfil de liberación controlada del fármaco. Se obtuvieron formulaciones de tamaño micrométrico, estables al calor, amorfas/no cristalinas, con eficiencia de carga de fármaco mayor al 90 %. No se registraron cambios en las asignaciones de FTIR después del procedimiento de microencapsulación. Las micropartículas (met)acrílicas portando drogas como tabletas comprimidas proporcionan una notable disminución de la velocidad de disolución de digluconato de clorhexidina al cambiar el perfil inicial de liberación del fármaco a un modelo cinético biexponencial. Además, la microencapsulación no comprometió la actividad antimicrobiana del digluconato de clorhexidina. Por lo tanto, estas formulaciones son portadores factibles para la liberación controlada de digluconato de clorhexidina y se pueden utilizar en productos orales y dérmicos más innovadores destinados a lograr un efecto antiséptico de larga duración.

KEY WORDS: Antiseptic, Controlled release, Microencapsulation, *Streptococcus*.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: pvfarago@gmail.com