



Benzoyl Peroxide-Loaded PCL Microparticles: Physicochemical Characterization and *In Vitro* Antibacterial and Permeation Studies

Barbara JUSTUS¹, Jessica M. NADAL², Martinha A. ALMEIDA³,
Meri E.S. JANZEN¹, Jane M. BUDEL¹, Luís A. ESMERINO¹,
Sônia F. ZAWADZKI³, Josiane P. de PAULA¹ & Paulo V. FARAGO*¹

¹ Postgraduate Program in Pharmaceutical Sciences, Department of Pharmaceutical Sciences,
State University of Ponta Grossa, 4748 Carlos Cavalcanti Ave.,
Zip Code 84030-900, Ponta Grossa, Paraná, Brazil

² Postgraduate Program in Pharmaceutical Sciences, Department of Pharmacy,
Federal University of Paraná, 632 Lothário Meissner Ave., Zip Code 80210-170, Curitiba, Paraná, Brazil

³ Postgraduate Program in Chemistry, Department of Chemistry,
Federal University of Paraná, P.O. Box 19081, Zip Code 81531-980, Curitiba, Paraná, Brazil

SUMMARY. Benzoyl peroxide (BPO) is a drug widely used for treating acne. However, BPO can cause local irritation, burning sensation and cutaneous edema. In that sense, the goal of this paper was to obtain poly(ϵ -caprolactone) (PCL) microparticles containing BPO as well as to perform the physicochemical characterization and *in vitro* antibacterial and permeation analyses. Formulations were prepared by simple emulsion/solvent evaporation. BPO-loaded microparticles showed spherical and almost spherical shapes. The encapsulation efficiency values were higher than 90% in accordance to literature. FTIR spectra demonstrated that no chemical bond was achieved between polymer and drug after microencapsulation. X-ray diffraction patterns revealed that microencapsulation led to drug amorphization. Microencapsulation did not impair the antibacterial performance of BPO against *Staphylococcus aureus*, *S. epidermidis*, and *Propionibacterium acnes*. BPO-loaded microparticles presented a significantly reduced *in vitro* permeation compared to pure drug. PCL microparticles containing BPO can be used as a novel cosmeceutical approach to treat acne.

RESUMEN. El peróxido de benzoilo (BPO) es un fármaco ampliamente utilizado para el tratamiento del acné. Sin embargo, BPO puede causar irritación local, sensación de ardor y edema cutáneo. En ese sentido, el objetivo de este trabajo fue obtener micropartículas de poli(ϵ -caprolactona) (PCL) que contienen BPO, así como llevar a cabo la caracterización físico-química y antibacteriana *in vitro* y el análisis de permeabilidad. Las formulaciones se prepararon por simple evaporación de la emulsión disolvente. Las micropartículas cargadas con BPO mostraron formas esféricas y casi esféricas. Los valores de eficiencia de encapsulación fueron superiores a 90%, de acuerdo a la literatura. Los espectros FTIR demostraron que ningún enlace químico se generó entre el polímero y el fármaco después de la microencapsulación. Los patrones de difracción de rayos X revelaron que la microencapsulación llevó a la amorfización del fármaco. La microencapsulación no afectó el desempeño antibacteriano de BPO frente a *Staphylococcus aureus*, *S. epidermidis* y *Propionibacterium acnes*. Las micropartículas cargadas con BPO presentaron una reducción significativa en la permeabilidad *in vitro* en comparación con el fármaco puro, por lo que se pueden utilizar como un nuevo enfoque cosmeceutico para tratar el acné.

KEYWORDS: acne, controlled release, microencapsulation, poly(ϵ -caprolactone), skin.

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