

Spray-Like TPGS-Based Microemulsions for Fusidic Acid Topical Delivery: Preparation, Characterization and *In Vitro* Antimicrobial Evaluation

Min QIN, Zhihong ZOU* & Changchun FAN

School of Chemistry and Chemical Engineering,
Southeast University, Nanjing, 211189, China

SUMMARY. The purpose of present study was to prepare and optimize a novel spray-like tocopherol polyethylene glycol 1000 succinate (TPGS) based microemulsion (ME) containing fusidic acid (FA) and to improve FA permeability and antimicrobial efficacy. Microemulsions were developed via pseudo-ternary phase diagrams combined with physicochemical characteristics. The spray of ME was evaluated according to its evaporation time, spray pattern, spray angle and *ex-in vivo* physical parameters. *In vitro* permeation study was carried out with the Franz diffusion cell. *In vitro* antimicrobial activity on bacteria was examined by disc diffusion test and constant dilution method. The optimized formulation (M4) showed good physicochemical characteristics and uniform spray patterns. The cumulative permeation study of FA demonstrated that TPGS-ME enhanced the drug transport. FA-TPGS-ME (M4), compared with FA-DM-SO (dissolved in DMSO), exhibited more effective antibacterial activity against *S. aureus*, *S. epidermidis* and *P. acnes*. TPGS-ME was identified as having potential synergy in the FA antimicrobial process. In conclusion, TPGS-ME spray can be an innovative and promising method that enhances the permeability and antimicrobial efficacy of FA for the topical administration.

RESUMEN. El objetivo del presente estudio fue preparar y optimizar una nueva microemulsión (ME) de tocoferol polietilenglicol 1000 succinato (ME) con tocoferol pulverizado que contiene ácido fusídico (FA) y para mejorar la permeabilidad de FA y la eficacia antimicrobiana. Las microemulsiones se desarrollaron mediante diagramas de fase pseudo-ternarios combinados con características fisicoquímicas. La pulverización de ME se evaluó de acuerdo con su tiempo de evaporación, patrón de pulverización, ángulo de pulverización y parámetros físicos *in vivo*. El estudio de permeación *in vitro* se llevó a cabo con la celda de difusión de Franz. La actividad antimicrobiana *in vitro* sobre bacterias se examinó mediante prueba de difusión de disco y método de dilución constante. La formulación optimizada (M4) mostró buenas características fisicoquímicas y patrones de pulverización uniformes. El estudio de permeabilidad acumulada de FA demostró que TPGS-ME mejoró el transporte de fármacos. FA-TPGS-ME (M4), en comparación con FA-DMSO (disuelto en DMSO), exhibió una actividad antibacteriana más efectiva contra *S. aureus*, *S. epidermidis* y *P. acnes*. TPGS-ME se identificó como una sinergia potencial en el proceso antimicrobiano FA. En conclusión, el spray TPGS-ME puede ser un método innovador y prometedor que mejora la permeabilidad y la eficacia antimicrobiana de FA para la administración tópica.

KEY WORDS: antimicrobial efficacy, fusidic acid, microemulsion, tocopherol polyethylene glycol 1000 succinate, transdermal spray.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: 101006373@seu.edu.cn