



## Self-Assembled Behaviors of Poly (Acrylic Acid)-*b*-Polycaprolactone and its Potential Application in Gambogenic Acid Loading

Hong CHEN<sup>1,2</sup>, Huanhuan LIU<sup>1,2,3</sup>, Mei YANG<sup>1</sup>, Xiaoxia LI<sup>1</sup> & Weidong CHEN<sup>1,2,3</sup> \*

<sup>1</sup> The College of Pharmacy,

<sup>2</sup> Institute of Drug Metabolism,

<sup>3</sup> Institute of Pharmaceutics,

Anhui University of Chinese Medicine, Hefei 230012, China

**SUMMARY.** Self-assembly of block copolymers (BCs) have attracted increased attention, which could affect the applications of BCs. Here, poly (acrylic acid)-*b*-polycaprolactone (PAA-*b*-PCL) was applied to evaluate its self-assembled behaviors and potential application in gambogenic acid (GNA) loading. The results revealed that the self-assembled PAA-*b*-PCL aggregates (PAs), in various organic solvents and oil/water ratio, exhibited different particle size, size distribution and micromorphology, and those aggregates could reassemble in acid environment (pH 5.3), which was shown the great pH-sensitivity of PAA-*b*-PCL. Moreover, in this study, an optimal prescription, with 3 h of self-assembled time, 0.6 mg/mL of PAA-*b*-PCL, 0.2 mg/mL of GNA, and 1:14 of oil/water ratio, was constructed for promoting the drug loading efficiency (DLE) of PAA-*b*-PCL. The obtained GNA-loaded PAA-*b*-PCL aggregates (GPAs) had a high DLE of  $88.90 \pm 2.62$  %, proper particle size of  $230 \pm 2$  nm and zeta potential of  $-35.10 \pm 1.73$  mV.

**RESUMEN.** El autoensamblaje de copolímeros de bloques (BC) ha atraído una mayor atención, lo que podría afectar las aplicaciones de los BC. Aquí, se aplicó ácido poliacrílico-*b*-policaprolactona (PAA-*b*-PCL) para evaluar sus comportamiento autoensamblado y su aplicación potencial en la carga de ácido gambogénico (GNA). Los resultados revelaron que los agregados de PAA-*b*-PCL (PA) autoensamblados, en varios solventes orgánicos y diferente proporción de aceite/agua exhibieron diferentes tamaños de partícula, distribución de tamaño y micromorfología, y esos agregados podrían reensamblarse en un ambiente ácido (pH 5.3), que mostró la gran sensibilidad al pH de PAA-*b*-PCL. Además, en este estudio se construyó una receta óptima, con 3 h de tiempo de autoensamblado, 0,6 mg/mL de PAA-*b*-PCL, 0,2 mg/mL de GNA y 1:14 de relación aceite/agua, para promover la eficiencia de carga de medicamentos (DLE) de PAA-*b*-PCL. Los agregados de PAA-*b*-PCL (GPA) cargados con GNA tuvieron una alta DLE de  $88.90 \pm 2.62$  %, un tamaño de partícula adecuado de  $230 \pm 2$  nm y un potencial zeta de  $-35.10 \pm 1.73$  mV.

**KEY WORDS:** drug loading, gambogenic acid, pH-sensitivity, polymer, self-assembly.

\* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: wdchen@ahtcm.edu.cn