

Preparation and Characterization of Atenolol Microparticles Developed by Emulsification and Solvent Evaporation

Reza ENAYATI-FARD¹, Jafar AKBARI¹, Majid SAEEDI¹, Katayoun MORTEZA-SEMNANI²,
Hamed MORAD^{1,*} & Ali NOKHODCHI^{3,4,*}

¹ Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmacy, Mazandaran University of Medical Sciences, Sari, Iran

² Department of Medicinal Chemistry, Faculty of Pharmacy, Mazandaran University of Medical Sciences, Sari, Iran

³ Pharmaceutics Research Laboratory, School of Life Sciences, University of Sussex, Brighton, BN1 9QJ, UK

⁴ Applied Drug Research Center and Faculty of Pharmacy, Tabriz University of Medical Sciences, Iran

SUMMARY. It is believed that controlling the drug release at the site of absorption could improve the bioavailability or *in vivo* performance of atenolol. Therefore, the aim of the present study was to develop atenolol microcapsules that may improve its absorption and bioavailability via controlling the drug release. The effect of drug:polymer ratio and surfactant concentrations on microcapsules particle size, polydispersity, release rate and encapsulation efficiency were investigated. Atenolol microcapsules were prepared by emulsion solvent evaporation technique and factors affecting the formation of the microcapsules were studied. The results showed that as drug:polymer ratio decreased from 3:1 to 1:3, the mean diameter of the microcapsules increased from 524.56 to 749.63 μm , as well as the encapsulation efficiency improved from 36.87 to 98.52%, while the atenolol release rate decreased. Increasing the concentration of Span 80 from 0.5 to 1.5% decreased the mean diameter of microcapsules from 600.96 to 413.43 μm , while there was a reduction in the encapsulation efficiency and an increase in the atenolol release rate was observed. In conclusion, the results showed that it is possible to achieve a high drug loading efficiency (up to 98%) with desired properties by changing the parameter involved in the formation of microcapsules.

RESUMEN. Se cree que controlar la liberación del fármaco en el sitio de absorción podría mejorar la biodisponibilidad o el rendimiento *in vivo* de atenolol. Por lo tanto, el objetivo del presente estudio fue desarrollar microcápsulas de atenolol que puedan mejorar su absorción y biodisponibilidad mediante el control de la liberación del fármaco. Se investigó el efecto de la relación de fármaco:polímero y las concentraciones de surfactante en el tamaño de partícula de las microcápsulas, la polidispersidad, la velocidad de liberación y la eficiencia de encapsulación. Las microcápsulas de atenolol se prepararon mediante una técnica de evaporación con disolvente de emulsión y se estudiaron los factores que afectan la formación de las microcápsulas. Los resultados mostraron que a medida que la relación fármaco: polímero disminuía de 3:1 a 1:3, el diámetro medio de las microcápsulas aumentaba de 524.56 a 749.63 μm , y la eficiencia de encapsulación mejoraba de 36.87 a 98.52%, mientras que la tasa de liberación de atenolol disminuía. El aumento de la concentración de Span 80 de 0.5 a 1.5% disminuyó el diámetro medio de las microcápsulas de 600.96 a 413.43 μm , mientras que hubo una reducción en la eficiencia de encapsulación y se observó un aumento en la tasa de liberación de atenolol. En conclusión, los resultados mostraron que es posible lograr una alta eficiencia de carga del fármaco (hasta un 98%) con las propiedades deseadas cambiando el parámetro involucrado en la formación de microcápsulas.

KEY WORDS: atenolol, emulsion solvent evaporation, ethyl cellulose, microcapsule.

* Authors to whom correspondence should be addressed. E-mail: a.nokhodchi@sussex.ac.uk (A. Nokhodchi); h.morad@mazums.ac.ir (Hamed Morad)