

Development and Optimization of Atenolol Loaded Polymeric Microspheres: *In Vitro* Attributes

Ayesha SAEED ¹, Sherjeel ADNAN ¹, Muhammad FAROOQ ¹*, Zeeshan MASOOD ¹,
Asif MAHMOOD ¹, Nazar M RANJHA ², Sana SAEED ¹ & Sadia HASSAN ¹

¹ Faculty of Pharmacy, University of Lahore, Lahore Pakistan

² Faculty of Pharmacy, University of Lahore, Gujrat Campus, Gujrat Pakistan

SUMMARY. The present work was aimed to prepare atenolol loaded microspheres by varying concentration different polymers, *i.e.* Eudragit S-100, Eudragit L-100, and ethyl cellulose. A total of sixteen formulations (M1-M16) were prepared by solvent evaporation method. Microspheres were characterized for micrometric properties, particle size, swelling index, drug entrapment efficiency, percentage yield, FTIR, XRD, SEM, and release studies. Entrapment efficiency and swelling index were found 65.9% (M8) and 20% (M16), respectively. FTIR studies confirmed absence of any sort of chemical interaction drug and polymers. XRD studies have reported that amorphous nature of developed polymeric microspheres. SEM results have shown that prepared microspheres were spherical in their geometry along with rough surfaces. Zeta sizer measurements confirmed the micrometric range of the prepared microspheres *i.e.* 172.80 to 215.02 μm . Optimum atenolol release was offered by formulation M9 > 85 % at phosphate buffer pH 6.8. Based upon R² value best-fit model was zero order kinetics. Mechanism of drug release was dependent on type of the polymer used and value of “n”. Formulations containing ethyl cellulose (M1-M8) have offered fickian diffusion and formulations containing Eudragit (M9-M16) offered non-fickian diffusion. Highly stable polymeric microspheres for controlled delivery of atenolol was successfully developed and optimized.

RESUMEN. El presente trabajo tuvo como objetivo preparar microesferas cargadas de atenolol variando la concentración de diferentes polímeros, es decir, Eudragit S-100, Eudragit L-100 y etilcelulosa. Se prepararon un total de dieciséis formulaciones (M1-M16) por el método de evaporación del disolvente. Las microesferas se caracterizaron por sus propiedades micrométricas, tamaño de partícula, índice de hinchamiento, eficiencia de atrapamiento de fármacos, porcentaje de rendimiento, FTIR, XRD, SEM y estudios de liberación. La eficiencia de atrapamiento y el índice de hinchazón fueron 65.9% (M8) y 20% (M16), respectivamente. Los estudios de FTIR confirmaron la ausencia de cualquier tipo de interacción química de drogas y polímeros. Los estudios de XRD han informado que la naturaleza amorfa de las microesferas poliméricas desarrolladas. Los resultados de SEM han demostrado que las microesferas preparadas eran esféricas en su geometría junto con las superficies rugosas. Las mediciones del medidor Zeta confirmaron el rango micrométrico de las microesferas preparadas, es decir, 172,80 a 215,02 μm . Se logró una liberación óptima de atenolol mediante la formulación M9 > 85% en tampón fosfato pH 6,8. El modelo de mejor ajuste basado en el valor R² fue la cinética de orden cero. El mecanismo de liberación del fármaco dependía del tipo de polímero utilizado y del valor de “n”. Las formulaciones que contienen etilcelulosa (M1-M8) han ofrecido difusión fickiana y las formulaciones que contienen Eudragit (M9-M16) mostraron difusión no fickiana. Microesferas poliméricas altamente estables para el suministro controlado de atenolol se desarrollaron y optimizaron con éxito.

KEY WORDS: Atenolol, Ethyl cellulose, Eudragit L-100, Eudragit S-100, Microspheres, Solvent evaporation.

* Author to whom correspondence should be addressed. *E-mail:* Muhammad.Farooq@pharm.uol.edu.pk