

Efecto del Eudragit y la Etilcelulosa como Agentes Retardantes de la Liberación sobre las Características Físico-Químicas y la Liberación *In Vitro* de Microesferas Cargadas con Zidovudina

Nicté GONZÁLEZ *, Dianelis FERNÁNDEZ, Martha GÓMEZ,
Leopoldo NÚÑEZ & Orlando LAFITA.

Centro de Investigación y Desarrollo de Medicamentos (CIDEM).
19 de mayo N° 13 esquina Amézaga, Plaza, Ciudad de La Habana, Cuba.

RESUMEN. El propósito de esta investigación fue estudiar la influencia del polímero como agente retardante de la liberación en las características físico-químicas de microesferas cargadas con Zidovudina (AZT) y en el comportamiento de la liberación *in vitro* del fármaco desde una forma farmacéutica oral. Las microesferas de AZT se obtuvieron por el método de Emulsión/Evaporación de Solventes, estructurando el experimento con el objetivo de evaluar el efecto en la formulación de dos polímeros inertes, la etilcelulosa y el Eudragit, caracterizando las muestras mediante la determinación de: distribución de tamaño de partículas, rendimiento, eficiencia de encapsulación, porcentaje de pérdida por cristales superficiales y solventes residuales. Los ensayos de disolución se realizaron a microesferas equivalentes a 150 mg de AZT contenidas en cápsulas duras de gelatina, evaluándose el comportamiento de la cinética de liberación para cada experiencia en comparación con el producto de liberación convencional, RETROVIR. El estudio reveló la influencia de las propiedades físico-químicas de cada polímero en las características de las microesferas y en el comportamiento de la liberación *in vitro* del fármaco desde las mismas. En ambos casos el retardo de la liberación del AZT se logró mediante mecanismos de difusión anómala. Los mejores resultados de eficiencia de encapsulación, capacidad de retardar la liberación del fármaco *in vitro*, así como los mayores rendimientos en el proceso de obtención de las microesferas, fueron exhibidos por la formulación que contenía Eudragit/AZT.

SUMMARY. "Effect of Eudragit and Ethylcellulose as a Release Retarding Agent in the Physico-chemicals Characteristics and *in vitro* Release of Zidovudine Loaded Microspheres". The purpose of this investigation was to study the influence of the polymer as a release retarding agent in the physico-chemicals characteristics of Zidovudine (AZT) loaded sustained release microspheres and *in vitro* drug release behavior from an oral pharmaceutical form. The AZT microspheres was obtained by the Emulsion/Evaporation of Solvents technique, structuring the experiment with the objective of evaluating the effect in the formulation of two inert polymers such as ethylcellulose and Eudragit, the samples were characterized by: particles size distribution, yield, loading efficiency, percentage of loose surface crystals and residual solvents. The dissolution assays were performed using an amount of microspheres corresponding to 150 mg of AZT filled in hard gelatin capsules, evaluating the kinetics drug release for each experience in comparison with the conventional product, RETROVIR. The study revealed the influence of physico-chemicals properties of each polymer on the characteristics of the microspheres and on the *in vitro* drug release behavior from them. In both cases the AZT was released by anomalous diffusion mechanisms. The best results in loading efficiency, capability to control *in vitro* drug release, as well as the biggest yields in the process were exhibited by the formulation containing Eudragit/AZT.

PALABRAS CLAVE: Etilcelulosa, Eudragit, Liberación controlada, Microesferas, Polímeros.

KEY WORDS: Controlled release, Ethylcellulose, Eudragit, Microspheres, Polymers.

Autora a quien dirigir la correspondencia. *E-mail:* iverlis@infomed.sld.cu