

5-Fluorouracil Encapsulated PLGA Nanoparticles for the Treatment of Lung Cancer

Xifang WANG¹, Yi LIU¹, Jun BAI¹, Yu LEI¹, Weijia WANG¹, Fan ZHANG¹,
Chao SUN¹, Wangfeng LU² & Yinyin HOU^{1*}

¹ Department of Medical Oncology, Shaanxi Provincial People's Hospital,
No. 256 Youyi West Road, Yanta District, Xi'an, Shaanxi, 710068, China

² Department of Gastrointestinal Surgery, Shangluo Central Hospital,
No. 148 Beixin Street, Shangzhou District, Shangluo, Shaanxi, 726000, China

³ Department of Gastrointestinal Surgery, Shangluo Central Hospital,
No. 148 Beixin Street, Shangzhou District, Shangluo, Shaanxi, 726000, China

SUMMARY. Non-Small Cell Lung Cancer (NSCLC) is accounted for almost 84% of all types of lung cancer diagnosed so far. The NSCLC is targeting many peoples worldwide every year, irrespective of their gender. 5-fluorouracil (5-FU) is an anticancer drug with uracil analog. This drug has tendencies to annihilate different tumor cells. But the biggest challenge of 5-FU is as: it gets metabolize very fast in the blood, which ultimately leads to lower anticancer activities. The main objective of this research was to prepare 15% w/w 5-FU loaded nanoparticles which has potential anti lung cancer activity. In this experiment, an attempt was made to prepare 5-FU loaded PLGA nanoparticles and subsequently observed the effect of PLGA molecular weight, PLGA loading, sonication time on the 15% w/w 5-FU loaded nanoparticles cytotoxic effect against A549 Isogenic Cell line (Human). In this experiment, two things are more evident; first, PLGA has a significant impact on 5-FU release due to the higher degradation and rate of PLGA diffusion in nanoparticle solution; second, nanoparticles having a larger surface area and smaller particle size has lower IC₅₀ value. In conclusion, 5-FU encapsulated PLGA nanoparticles was prepared successfully using solvent evaporation method and anticancer activity of the nanoparticles were tested against A549 isogenic cell line, which suggest that the prepared nanoparticles was found to be a good candidate for lung cancer treatment.

RESUMEN. El cáncer de pulmón de células no pequeñas (CPCNP) representa casi el 84% de todos los tipos de cáncer de pulmón diagnosticados hasta ahora. El NSCLC se dirige a muchas personas en todo el mundo cada año, independientemente de su género. El 5-fluorouracilo (5-FU) es un fármaco contra el cáncer con análogo de uracilo. Esta droga tiene tendencia a aniquilar diferentes células tumorales. Pero el mayor desafío del 5-FU es que se metaboliza muy rápido en la sangre, lo que en última instancia conduce a una menor actividad anticancerosa. El objetivo principal de esta investigación fue preparar nanopartículas cargadas con 5-FU al 15% p/p que tienen actividad potencial contra el cáncer de pulmón. En este experimento, se intentó preparar nanopartículas de PLGA cargadas con 5-FU y posteriormente se observó el efecto del peso molecular de PLGA, la carga de PLGA y el tiempo de sonicación en el efecto citotóxico de las nanopartículas cargadas con 5-FU al 15% p/p contra la línea celular isogénica A549 (humana). En este experimento, dos cosas son más evidentes; primero, PLGA tiene un impacto significativo en la liberación de 5-FU debido a la mayor degradación y velocidad de difusión de PLGA en la solución de nanopartículas; en segundo lugar, las nanopartículas que tienen un área superficial más grande y un tamaño de partícula más pequeño tienen un valor de CI₅₀ más bajo. En conclusión, las nanopartículas de PLGA encapsuladas con 5-FU se prepararon con éxito utilizando el método de evaporación de solventes y la actividad anticancerígena de las nanopartículas se probó contra la línea celular isogénica A549, lo que sugiere que las nanopartículas preparadas resultaron ser un buen candidato para el tratamiento del cáncer de pulmón.

KEY WORDS: A549 isogenic cell line, 5-FU, IC₅₀ value, non-small cell lung cancer (NSCLC), PLGA, polymeric nanoparticles.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: houyinyindjmm@sina.com