

Effects of Filler-Binders and Lubricants on Physicochemical Properties of Tablets Obtained by Direct Compression: A 2² Factorial Design

Michel de O. BASTOS¹, Rossana B. FRIEDRICH² & Ruy C.R. BECK^{2*}

¹ Curso de Farmácia, Universidade Federal de Santa Maria, Santa Maria, RS, Brazil

² Programa de Pós-Graduação em Ciências Farmacêuticas, Departamento de Farmácia Industrial, Av. Roraima, 1000 - Prédio 26 - Centro de Ciências da Saúde Centro de Ciências da Saúde, Universidade Federal de Santa Maria, Santa Maria 97105-900, RS, Brazil

SUMMARY. The influence of the filler-binder granulometry (Avicel PH 101 or Avicel PH 102) and the type of lubricants (magnesium stearate or stearic acid) by means of a 2² factorial design on the physicochemical characteristics of tablets containing high amount of an active substance have been studied. Acetylsalicylic acid (ASA) was used as a model drug. All formulations met pharmacopeial specifications for mean weight, assay, uniformity of content, and disintegration time. Higher hardness and higher percentage of drug dissolved ($p \leq 0.05$) was shown by formulations prepared with stearic acid compared to formulations prepared with magnesium stearate. Tablet friability was significantly higher ($p \leq 0.05$) for formulations prepared with Avicel PH 101 in relation to formulations containing Avicel PH 102. The type of lubricant as well as the filler granulometry showed to have a great influence on the physicochemical and biopharmaceutical characteristics of tablets containing high amount of active substance obtained by direct compression.

RESUMEN. "Efecto de los Excipientes Diluyente-aglutinante y Lubricante sobre las Propiedades Físicoquímicas de Tabletas Obtenidas por Compresión Directa: un Diseño Factorial 2²". En el presente trabajo se estudió la influencia de la granulometría del diluyente-aglutinante (Avicel PH 101 o Avicel PH 102) y el tipo de lubricante (estearato de magnesio o ácido esteárico), mediante un diseño factorial 2², sobre las características físicoquímicas de tabletas con un alto contenido de principio activo. El ácido acetilsalicílico (ASA) fue utilizado como fármaco modelo. Todas las formulaciones cumplían con las especificaciones de farmacopea en cuanto al peso promedio, ensayos de uniformidad de contenido y tiempo de desintegración. Mayor dureza y porcentaje disuelto ($p \leq 0,05$) fueron observados en las formulaciones preparadas con ácido esteárico comparadas con aquellas en que se utilizó estearato de magnesio. La friabilidad de las tabletas fue significativamente mayor ($p \leq 0,05$) para aquellas preparadas con Avicel PH 101 en comparación con las que contenían Avicel PH 102. Tanto el tipo de lubricante como la granulometría del diluyente mostraron una gran influencia en las características físicoquímicas y propiedades biofarmacéuticas de las tabletas obtenidas por compresión directa con un alto contenido de sustancia activa.

KEY WORDS: Acetylsalicylic acid, Adjuvants, Direct compression, Factorial design, Tablets.

PALABRAS CLAVE: Ácido acetilsalicílico, Compresión directa, Diseño factorial, Excipiente, Tabletas.

* Autor a quien dirigir la correspondencia. E-mail: ruybeck@smail.ufsm.br