



Development and *In vitro* Evaluation of Swellable Floating Formulation of Captopril

Muhammad A. HAFIZ¹, Sajid BASHIR², Imran TARIQ^{*1}, Pervaiz A. SHAH¹,
Hafiz M.I. NAZAR¹, Sohail AMJAD¹, Abida LATIF¹ & Ghulam MURTAZA³

¹ University College of Pharmacy, University of the Punjab, Lahore -5400, Pakistan.

² Faculty of Pharmacy, University of the Sargodha, Sargodha

³ Department of Pharmaceutics, COMSATS Institute of Information Technology, Abbottabad, Pakistan

SUMMARY. The purpose of the present work was to formulate and evaluate the effervescent floating tablets of captopril using blend of natural and synthetic polymers. Ten formulations of floating tablets were prepared using *Psyllium* husk, Hydroxypropylmethylcellulose (HPMC K100M) and sodium bicarbonate (NaHCO₃) by direct compression technology. Fourier transform infra red spectrometry (FTIR) and Differential scanning calorimetry (DSC) were performed to elucidate the interaction of drug with polymer and excipients. Floating units were evaluated for physicochemical parameters like hardness, diameter, thickness, swelling index, mass uniformity, percent drug content, buoyancy lag time and drug release. Swelling and *in vitro* release studies were carried out in 0.1 N HCl at 37 °C using paddle apparatus. The formulated tablets were optimized on the basis of buoyancy time and drug release. FTIR and DSC results showed no detectable incompatibility between drug and polymers. The diameter of all formulations was found to be in the range of 9.82-10.78 mm; thickness was in the range of 3.914-4.437 mm. The hardness was calculated to be in the range of 1.92-2.75 kg/cm². The buoyancy time remained less than 3.5 min and duration of floating did not exceed 12 h for all formulations. The results of swelling studies showed higher percent swelling on increasing the polymer concentration. The value of 'n' was in the range of 0.409-0.755 which is indicator of drug release by fickian as well as non-fickian or anomalous diffusion mechanisms. The study concluded, C4 as the best optimized formulation for the extent of drug release was found to be around 99.24 ± 1.26% and showed buoyancy lag time at 114 ± 10 s with floating duration of ≥ 12 h.

RESUMEN. El propósito del presente trabajo fue formular y evaluar las tabletas efervescentes flotantes de captopril utilizando mezcla de polímeros naturales y sintéticos. Diez formulaciones de comprimidos flotantes se prepararon utilizando cáscara de *Psyllium*, hidroxipropilmetilcelulosa (HPMC K100M) y bicarbonato de sodio (NaHCO₃) por compresión directa. Para dilucidar la interacción de fármaco con polímeros y excipientes se utilizó espectrometría infrarroja por transformada de Fourier (FTIR) y calorimetría diferencial de barrido (DSC). Las tabletas fueron evaluadas para parámetros físico-químicos tales como dureza, diámetro, espesor, índice de hinchamiento, uniformidad de masa, contenido porcentual de fármaco, flotabilidad tiempo de retraso y liberación del fármaco. Los estudios de hinchamiento y de liberación *in vitro* se llevaron a cabo en HCl 0,1 N a 37 ° C. Los comprimidos formulados fueron optimizados sobre la base de tiempo de la flotabilidad y de liberación del fármaco. Los resultados de FTIR y DSC no mostraron incompatibilidad detectable entre el fármaco y los polímeros. El diámetro de todas las formulaciones fue de 9,82 a 10,78 mm y el espesor entre 3,914 y 4,437 mm. La dureza varió en el intervalo de 1,92 a 2,75 kg/cm². El tiempo de flotabilidad se mantuvo a menos de 3,5 min y la duración de la flotación no excedió las 12 h para todas las formulaciones. Los resultados de los estudios de hinchamiento mostraron mayor porcentaje de hinchamiento con el aumento de la concentración de polímero. El valor de "n" estuvo en el rango de 0,409 a 0,755, que es el indicador de liberación del fármaco por Fick, así como mecanismos de difusión no fickianos o anómalos. C4 fue la formulación mejor optimizada para la extensión de la liberación del fármaco en alrededor de 99,24 ± 1,26 % y mostró flotabilidad de tiempo de retraso en 114 ± 10 s, con una duración variable ≥ 12 h.

KEY WORDS: Captopril, Direct compression, Floating tablet, HPMC K100M, *Psyllium* husk.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: imran_1982@hotmail.com