

Taste-Masked Spray Dried Microparticles for Intra-Oral Dispersible Tablets of Lornoxicam

Gamal A. SHAZLY^{1,2}, Mohamed A. IBRAHIM^{1,3}, Sayed H. AUDA^{1,3},
Mahmoud EL-BADRY⁴, Saleh A. AL-SUWAYEH¹, & Faiyaz SHAKEEL^{1*}

¹ *Department of Pharmaceutics, College of Pharmacy, King Saud University,
P. O. Box 2457, Riyadh 11451, Saudi Arabia*

² *Department of Industrial Pharmacy, Faculty of Pharmacy, Assiut University 71526, Assiut, Egypt*

³ *Department of Pharmaceutics and Industrial Pharmacy,
Faculty of Pharmacy, Al-Azhar University, Assiut, Egypt*

⁴ *Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmacy, Assiut University 71526, Assiut, Egypt*

SUMMARY. Taste-masked microspheres of lornoxicam (LOX) were prepared by spray drying technique using hydroxypropyl methyl cellulose (HPMC) or polyvinyl pyrrolidone (PVP) as polymers in different mass ratios. The effect of polymers and drug-polymer mass ratios on the taste-masking and release properties of co-spray dried microparticles (CSDM) was investigated. CSDM masked the bitter taste of the LOX and enhanced its dissolution rate as compared to pure drug. This improvement in drug dissolution was attributed to both the solubilizing effect of the polymers and physical change in the drug crystal. CSDM formulae with drug, HPMC and PVP (1:4:4) were selected for the preparation of intra-oral tablets (IOTs) because it showed the highest drug release. Three superdisintegrants were used for the preparation of LOX IOTs. IOTs containing croscarmellose sodium released the drug faster than that containing sodium starch and this was probably due to the binding effect of PVP. The anti-inflammatory effects of the prepared LOX IOTs were studied using rat hind paw edema method. The results revealed that IOTs containing croscarmellose sodium showed significant inflammation size reduction in rat hind paw. Palatability studies on human volunteers showed acceptable taste and mouth feel of developed formulation.

RESUMEN. Las microesferas de lornoxicam (LOX) fueron preparadas por secado por aspersión usando hidroxipropilmetil celulosa (HPNC) o polivinil pirrolidona (PVP) como polímeros en diferentes relaciones de masa. El efecto de los polímeros y de las relaciones de masas en el sabor y en las propiedades de liberación de las micropartículas co-secadas (CDSM) fue investigado. Las CDSM enmascararon el gusto amargo del LOX y aumentaron su velocidad de disolución comparadas con la droga pura. Esta mejora en la disolución de la droga fue atribuida tanto al efecto solubilizante de los polímeros como a los cambios físicos en el estado cristalino de la droga. La fórmula de CSDM con droga, HPMC y PVP (1:4:4) fue seleccionada para la preparación de tabletas intra-orales (IOTs) porque mostraron la mayor liberación de droga. Tres superdesintegrantes fueron usados para la preparación de LOX IOTs. Los IOTs conteniendo croscarmelosa sódica liberaron la droga más rápido que las que contenían almidón sódico y esto fue probablemente debido al efecto adhesivo del PVP. Los efectos antiinflamatorios de los LOX IOTs preparados fueron estudiados usando el método de edema de pata de rata. Los resultados revelaron que las IOTs conteniendo croscarmelosa sódica mostraron una significativa reducción en el tamaño de la inflamación del edema de pata de rata. Los estudios de palatabilidad sobre voluntarios humanos mostraron que la formulación posee un gusto y sensación bucal aceptables.

KEY WORDS: Anti-inflammatory effects, Intraoral dispersible tablet, Lornoxicam, Microparticles, Polymer.

* Author to whom correspondence should be addressed. *E-mail:* faiyazs@fastmail.fm