



Colon Specific Formulation of Mesalamine: Preparation and *In Vitro* Evaluation

Asad M. KHAN^{1,2}, Sajid BASHIR¹, Muhammad HANIF³,
Nasir ABBAS⁴ & Muhammad AHSAN^{4,5}*

¹ Department of Pharmaceutics, University of Sargodha, Sargodha, Pakistan

² Lahore Pharmacy College, Lahore Medical and Dental College, Lahore, Pakistan

³ Faculty of Pharmacy, Bahauddin Zakariya University, Multan, Pakistan

⁴ University College of Pharmacy, University of the Punjab, Lahore, Pakistan

⁵ Riphah Institute of Pharmaceutical Sciences, Riphah International University, Lahore, Pakistan

SUMMARY. The present study was aimed to develop a colon specific formulation of mesalamine to release not more than 20 % in first 6 h ($t_{20\%}$) and almost 80 % after 10 h ($t_{80\%}$). Five formulations of mesalamine using different blends of Eudragit RS 100, carbopol 940, and ethyl cellulose were prepared by wet granulation and two formulations by direct compression method. Formulations were studied for physicochemical parameters and drug release. Also, Fourier transform infrared (FTIR) studies were carried out to check possible interaction among drug, polymers and excipients. Physicochemical parameters like tablet thickness, hardness, weight variation for optimized formulation (F_{WG5}) were 8.09 mm, 10.78 kg/cm², 1203 ± 9.128 mg, respectively. In the same formulation, release of drug was found to be 24.64 ± 0.70 % after 6 h and 91.03 ± 0.90 % after 10 h. The FTIR spectra showed no interaction between drug and excipients. It was observed that data was best described by Peppas model ($R^2 = 0.9882, 0.9851$). The value of 'n' ranged from 1.231 to 1.941 indicating super case II transport as mechanism of drug release. Formulation F_{WG5}, prepared by wet granulation method, met the desirability criteria.

RESUMEN. El presente estudio tiene por objeto desarrollar una formulación específica para colon de mesalamina para liberar no más del 20% en las primeras 6 h ($t_{20\%}$) y casi el 80% después de 10 h ($t_{80\%}$). Cinco formulaciones de mesalamina utilizando diferentes mezclas de Eudragit RS 100, carbopol 940 y etil celulosa se prepararon por granulación húmeda y dos formulaciones por el método de compresión directa. Se estudiaron los parámetros físico-químicos y la liberación del fármaco de las formulaciones. Además, los estudios infrarrojos por transformada de Fourier (FTIR) fueron realizados para comprobar la posible interacción entre fármacos, polímeros y excipientes. Parámetros físico-químicos tales como el grosor de la pastilla, la dureza, la variación del peso de la formulación optimizada (F_{WG5}) fueron 08,09 mm, 10,78 kg/cm², 1203 ± 9,128 mg, respectivamente. En la misma formulación, se encontró que la liberación de fármaco fue de 24,64 ± 0,70% después de 6 h y 91,03 ± 0,90% después de 10 h. Los espectros de FTIR no mostraron interacción entre el fármaco y los excipientes. Se observó que los valores eran mejor descritos por el modelo Peppas ($R^2 = 0.9882, 0.9851$). El valor de "n" varió de 1,231 a 1,941 indicando el transporte súper caso II como mecanismo de liberación del fármaco. La formulación F_{WG5}, preparada por el método de granulación húmeda reunió los criterios deseados.

KEY WORDS: Carbopol 940, colon targeted drug delivery system, ethyl cellulose, Eudragit RS 100, mesalamine, wet granulation.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: ahsanshareef105@hotmail.com