

Solubility Enhancement of Rosuvastatin Calcium through Development of β -CD Based Microparticulate System and its *In Vitro* Evaluation

Rai M. SARFRAZ^{1*}, Asif MAHMOOD², Muhammad R. AKRAM¹, Muhammad R. ALI¹,
Muhammad U. KHAN¹, Husnain AHMAD¹, Muhammad N. QAISAR¹,
Muhammad A. AKRAM³, Jahangir KHAN⁴ & Zamir UI HASSAN⁵

¹ College of Pharmacy, University of Sargodha, Sargodha, Pakistan

² Department of Pharmacy, Faculty of Pharmacy, University of Lahore

³ Department of Pharmacy, Gomal University Dera Ismail Khan

⁴ Department of Pharmacy, University of Malakand, Chakdara, Dir (L) KPK, Pakistan

⁵ Global Pharmaceuticals (pvt) Ltd. Islamabad, Pakistan

SUMMARY. Present work is based upon the preparation of β -cyclodextrin based microparticulate systems through various techniques for solubility enhancement of rosuvastatin calcium. Two types of microparticulate system were prepared in the form of solid dispersion and hydrogel microparticles. Prepared formulations were characterized for entrapment efficiency and product yield, FTIR, DSC & TGA, PXRD, SEM, TEM, Zeta size and potential, solubility studies and *in vitro* drug release studies. Optimum drug release was observed for formulations S3 and HS7. A remarked improvement in solubility of rosuvastatin calcium was observed at pH 6.8. 10.66 folds enhancement in solubility was observed for hydrogel microparticles while solid dispersion system presented the 8.54 folds improvement in solubility. Results of *in vitro* studies presented the better release of drug from microparticulate systems as compared to commercially available tablets of RST. On the basis of these results β -cyclodextrin based microparticulate systems proved a potential tool for solubility enhancement of rosuvastatin calcium.

RESUMEN. El presente trabajo se basa en la preparación de sistemas de micropartículas basada en β -ciclodextrina a través de diversas técnicas para el aumento de la solubilidad de la rosuvastatina cálcica. Se prepararon dos tipos de sistemas de micropartículas en forma de dispersión sólida y micropartículas de hidrogel. Las formulaciones preparadas se caracterizaron por la eficiencia de atrapamiento y el rendimiento del producto, FTIR, DSC y TGA, PXRD, SEM, TEM, tamaño y potencial Zeta, estudios de solubilidad y estudios de liberación *in vitro* de fármacos. Se observó una liberación óptima del fármaco para las formulaciones S3 y HS7. Se observó una mejora notable en la solubilidad de rosuvastatina cálcica a 6,8 pH. Se observaron 10,66 pliegues de aumento de la solubilidad para las micropartículas de hidrogel, mientras que el sistema de dispersión sólida presentó la mejora de 8,54 pliegues de la solubilidad. Los resultados de los estudios *in vitro* presentaron la mejor liberación del fármaco de los sistemas de micropartículas en comparación con los comprimidos de RST disponibles en el mercado. Sobre la base de estos resultados, los sistemas de micropartículas basadas en β -ciclodextrina demostraron ser una herramienta potencial para mejorar la solubilidad de la rosuvastatina cálcica.

KEY WORDS: β -cyclodextrin, hydrogels, microparticulate systems, rosuvastatin calcium, solid dispersion, solubility.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: sarfrazrai85@yahoo.com