

Orodispersible Tablets of Epalrestat for Immediate Release Studies

Zunaira ALVI¹, Imran NAZIR², Zobaria A. JAVED¹,
Ghulam ABBAS³, Muhammad HANIF^{1*} & Muhammad A. SHEHZAD⁴

¹ Faculty of Pharmacy Bahauddin Zakariya University Multan, Pakistan

² Faculty of Pharmacy and Alternative Medicine, The Islamia University Bahawalpur, Pakistan

³ Faculty of Pharmaceutical Sciences Government College University Faisalabad, Pakistan

⁴ Department of Statistics Bahauddin Zakariya University Multan, Pakistan

SUMMARY. Compression of orodispersible tablets remained a challenge for the pharmaceutical scientists due to different nature of excipients. In the present study, effect of powder, granules and combination of powder and granules were evaluated. Three different types of materials were finally optimized by using Box-Behnken design by taking avicel, magnesium stearate and mannitol as factors and micromeritic properties of powder, granules and powder and granules combination like angle of repose, bulk density, tapped density, Carr's index and Hausner's ratio as responses. Compressed tablets were further evaluated by physicochemical studies like hardness, friability, weight variation, revised *in vitro* disintegration, wetting time, water absorption ratio, and percentage release studies by using phosphate buffer pH 7.4. All the micromeritic properties and physicochemical test of the compressed formulations were within the acceptable limit. Compatibility of excipients and drug were further analyzed by FTIR and characteristics peaks were obtained at 3743, 3673, 3649, 1741, 1680, and 1472 cm⁻¹ corresponds to the peaks of mannitol, magnesium stearate, avicel, and epalrestat, respectively, indicating no chemical interactions between drug, polymer, and excipients. Significant amount of more than 85% release of Epalrestat was observed from compressed formulation. *In vivo* studies for the treatment of diabetic neuropathy, nephropathy and retinopathy can be studied due to potential effects of epalrestat as already reported in previous inquiries.

RESUMEN. La compresión de tabletas orodispersables siguió siendo un desafío para los científicos farmacéuticos debido a la diferente naturaleza de los excipientes. En el presente estudio se evaluó el efecto del polvo, gránulos y combinación de polvo y gránulos. Finalmente, se optimizaron tres tipos diferentes de materiales utilizando el diseño de Box-Behnken tomando avicel, estearato de magnesio y manitol como propiedades micromeríticas variables de polvo, gránulos y combinación de polvo y gránulos como ángulo de reposo, densidad aparente, densidad captada, índice de Carr e índice de Hausner como respuestas. Las tabletas comprimidas se evaluaron adicionalmente mediante estudios fisicoquímicos como dureza, friabilidad, variación de peso, desintegración *in vitro* revisada, tiempo de humectación, relación de absorción de agua y estudios de liberación porcentual mediante el uso de tampón fosfato de pH 7.4. Todas las propiedades micromeríticas y la prueba fisicoquímica de las formulaciones comprimidas estaban dentro del límite aceptable. La compatibilidad de los excipientes y el fármaco se analizaron adicionalmente mediante FTIR y los picos de las características se obtuvieron en 3743, 3673, 3649, 1741, 1680 y 1472 cm⁻¹ que corresponde a los picos de manitol, estearato de magnesio, avicel y epalrestat, respectivamente, lo que indica que no hay interacciones químicas entre fármaco, polímero y excipientes. Se observó una cantidad significativa de más del 85% de velocidad de liberación de una formulación comprimida. Los estudios *in vivo* para el tratamiento de la neuropatía diabética, nefropatía y retinopatía pueden estudiarse debido a los efectos potenciales del epalrestat, como ya se informó en estudios anteriores.

KEY WORDS: epalrestat, FTIR, *in vitro* release, orodispersible tablets.

* Author to whom correspondence should be addressed. *E-mail:* muhammad.hanif@bzu.edu.pk