

Fabrication of Acyclovir Floating Tablets by Using Combination of Eudragit L100 and Ethyl Cellulose by Direct Compression Method

Pervaiz Akhtar SHAH^{1*}, Salah ud din KHAN², Haroon Khalid SYED³, Muhammad AAMIR¹,
Areeba PERVAIZ¹, Haider Abbas ZAIDI⁴ & Muhammad Shahid IQBAL⁵

¹ Department of Pharmaceutics, University College of Pharmacy,
University of the Punjab, 54590, Lahore, Pakistan

² Department of Biochemistry, College of Medicine,
Imam Mohammad ibn Saud Islamic University (IMSIU), 11432, Riyadh, Saudi Arabia

³ Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmaceutical Sciences,
Government College University, Faisalabad, 38000, Pakistan

⁴ Department of Pharmacy, Ghulam Devi Institute of Pharmacy Lahore Pakistan.

⁵ Department of Clinical Pharmacy, College of Pharmacy,
Prince Sattam bin Abdulaziz University, Al-kharj, 11942, Saudi Arabia

SUMMARY. The objective of this study was to prepare the floating tablets of Acyclovir with minimum side effects. Eudragit L100 and ethyl cellulose were used as co-polymer for manufacturing of gastro retentive formulations of acyclovir by direct compression method. Pre-formulation study was performed and characterization was done with FTIR, DSC and XRD for analysis of acyclovir floating tablets. Dissolution study was carried out in 0.1 N HCl for 12 h to check the release profile of formulations and different pharmacokinetic models were used. The purity of Acyclovir was confirmed by results of pre formulation studies. The drug polymer mixture showed good flow properties at low drug to polymer ratio. The results of FTIR and DSC showed the absence of chemical and physical interaction among drug and polymers. The results of post compression tests of prepared tablets were in acceptable range. The analysis of *in vitro* buoyancy time showed that the floating lag time of all tablets was less than 1 min and tablets remained on the surface of dissolution medium for more than 12 h. The data of swelling index test showed that the decline in swelling ability of floating tablets was due to increase in concentration of polymer. Formulations showed the extended release phenomena in 0.1 N HCl for all formulations with best release of 90% after 12 h. It was shown that all the formulations followed Korsmeyer Peppas model due to highest value of coefficient R^2 in results. The release mechanism followed the super case II transport because the value of coefficient R^2 was greater than 0.89.

RESUMEN. El objetivo de este estudio fue preparar comprimidos flotantes de aciclovir con mínimos efectos secundarios. Se utilizaron Eudragit L100 y etilcelulosa como copolímero para la fabricación de formulaciones gastro-retentivas de aciclovir mediante el método de compresión directa. Se realizó estudio de pre-formulación y caracterización con FTIR, DSC y XRD para análisis de tabletas flotantes de aciclovir. Se realizó estudio de disolución en HCl 0,1 N durante 12 h para comprobar el perfil de liberación de las formulaciones y se utilizaron diferentes modelos farmacocinéticos. La pureza del aciclovir se confirmó mediante los resultados de los estudios previos a la formulación. La mezcla de polímero de fármaco mostró buenas propiedades de flujo a una relación de fármaco a polímero baja. Los resultados de FTIR y DSC mostraron la ausencia de interacción química y física entre fármacos y polímeros. Los resultados de las pruebas posteriores a la compresión de las tabletas preparadas se encontraban en un rango aceptable. El análisis del tiempo de flotabilidad *in vitro* mostró que el tiempo de espera de flotación de todos los comprimidos fue inferior a 1 min y los comprimidos permanecieron en la superficie del estómago durante más de 12 h. Los datos de la prueba del índice de hinchamiento mostraron que la disminución de la capacidad de hinchamiento de los comprimidos flotantes se debió al aumento de la concentración de polímero. Las formulaciones mostraron el fenómeno de liberación prolongada en HCl 0,1 N para todas las formulaciones con la mejor liberación del 90% después de 12 h. Se demostró que todas las formulaciones siguieron el modelo de Korsmeyer Peppas debido al valor más alto de coeficiente R^2 en los resultados. El mecanismo de liberación siguió al transporte del super caso II porque el valor del coeficiente R^2 fue superior a 0,89.

KEY WORDS: acyclovir, ethyl cellulose, eudragit L100, floating tablets.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: pashah6512@yahoo.com