

Formulation and Evaluation of Chitosan-Based Polymeric Biodegradable Mucoadhesive Buccal Delivery for Locally Acting Drugs: *In Vitro*, *Ex Vivo* and *In Vivo* Volunteers Characterization

Sana HANIF¹, Rai M. SARFRAZ^{1*}, Muhammad A. SYED²,
Shujaat ALI³, Zafar IQBAL⁴, Rouheena SHAKIR² & Javed IQBAL²

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

² Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmacy, College of Pharmacy,
The University of Lahore, Lahore, Pakistan.

³ University of Bordeaux, Bordeaux, France

⁴ Universitätsklinikum Eppendorf Hamburg, University of Hamburg, Germany

SUMMARY. Pain treatment by means of a local anesthetic and at the same time, controlling the microbial flora with an antiseptic agent can be considered as an option for delivering through mucoadhesive buccal dosage form. The objective of the current study was to develop a chitosan (CHI) based targeted polymeric buccal mucoadhesive fabrication for simultaneous release of lignocaine hydrochloride (LGN) and tibenonium iodide (TBN). Mixed ingredients were compacted via direction compression using chitosan (CHI) with sodium alginate (SA) and hypromellose (HPMC). Outcomes shown that the weight variation and friability were according to the USP specifications and were unaffected by changing amounts of the polymers in the formulations. Maximum swellability was observed in PT8, containing 7.5% of SA and CHI. Surface pH was also in accordance to the normal physiological pH range. Maximum mucoadhesive strength and time values were observed in the formulation PT4 containing 7.5% concentration of CHI and HPMC each, which were 5.76 h and 9.37 g, respectively. Same was the case for PT4 in terms of maximum simultaneous *in vitro* release for both drugs. The release of TBN and LGN was best fitted to Hixon Crowell release model. Formulation PT4 promised optimum results in terms of maximum release with optimum mucoadhesive values till to 4 h.

RESUMEN. El tratamiento del dolor por medio de un anestésico local y al mismo tiempo, el control de la flora microbiana con un agente antiséptico puede considerarse como una opción para su administración a través de una forma de dosificación bucal mucoadhesiva. El objetivo del presente estudio fue desarrollar una fabricación mucoadhesiva bucal polimérica dirigida basada en quitosano (CHI) para la liberación simultánea de clorhidrato de lignocaína (LGN) y yoduro de tibenonio (TBN). Los ingredientes mezclados se compactaron mediante compresión direccional usando quitosano (CHI) con alginato de sodio (SA) e hipromelosa (HPMC). Los resultados mostraron que la variación de peso y la friabilidad estaban de acuerdo con las especificaciones de la USP y no se vieron afectadas por las cantidades cambiantes de los polímeros en las formulaciones. Se observó una máxima hinchabilidad en PT8, que contenía un 7,5% de SA y CHI. El pH de la superficie también estuvo de acuerdo con el rango de pH fisiológico normal. Se observaron valores máximos de fuerza mucoadhesiva y tiempo en la formulación PT4 que contenía una concentración del 7,5% de CHI y HPMC cada una, que fueron 5,76 h y 9,37 g, respectivamente. Lo mismo sucedió con PT4 en términos de liberación *in vitro* simultánea máxima de ambos fármacos. El lanzamiento de TBN y LGN se ajustó mejor al modelo de lanzamiento de Hixon Crowell. La formulación PT4 prometía resultados óptimos en términos de liberación máxima con valores mucoadhesivos óptimos hasta las 4 h.

KEY WORDS: anesthetic lozenges, antiseptic buccal tablet, lignocaine HCl, mucoadhesive buccal tablet, mucoadhesive strength tester, tibenonium iodide.

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