

Effect of Polar Protic Solvents on the Physicochemical Properties and Dissolution of Soluplus Based Solid Dispersions of Rosuvastatin Calcium

Sana INAM¹, Muhammad IRFAN^{1*}, Muhammad Shahid IQBAL²,
Haroon Khalid SYED¹ & Nayer ISLAM¹

¹ Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmaceutical Sciences,
GC University Faisalabad, Pakistan

² Department of Clinical Pharmacy, College of Pharmacy, Prince Sattam bin Abdulaziz University,
Alkharj, Kingdom of Saudi Arabia

SUMMARY. Solid dispersions (SD) is a promising technology for improving dissolution and thereby bio-availability of poorly soluble drugs. This study aimed to prepare SD of rosuvastatin calcium, a BCS class II drug, through solvent evaporation method using variable ratios of soluplus to achieve the objective of boosted solubility. Moreover, impact of polar protic solvents (acetone, MeOH and AC:MeOH) was also investigated to foresee the transformation of physicochemical properties. The prepared formulations were assessed for saturation solubility, in-vitro drug release, FTIR, XRD, DSC and SEM analysis. The results revealed that all SDs profoundly increased solubility as well as drug release. Among the optimized SD formulations, RSEB-10 with a remarkable increase of 34.95 fold in solubility presented 81.67% of drug release within 5 min in contrast to only 25% release of pure RoCa. Importantly, the role of solvent, though present in minute amounts after evaporation, could not be underrated and the combination of polar solvents noticeably influenced in potentiating the solubility of RoCa.

RESUMEN. Las dispersiones sólidas (SD) son una tecnología prometedora para mejorar la disolución y, por lo tanto, la biodisponibilidad de fármacos poco solubles. Este estudio tuvo como objetivo preparar SD de rosuvastatina cálcica, un fármaco de clase II de BCS, a través del método de evaporación de solventes utilizando proporciones variables de soluplus para lograr el objetivo de solubilidad aumentada. Además, también se investigó el impacto de los disolventes próticos polares (acetona, MeOH y AC:MeOH) para prever la transformación de las propiedades fisicoquímicas. Las formulaciones preparadas se evaluaron en cuanto a solubilidad de saturación, liberación del fármaco in vitro, análisis FTIR, XRD, DSC y SEM. Los resultados revelaron que todos los SD aumentaron profundamente la solubilidad y la liberación del fármaco. Entre las formulaciones SD optimizadas, RSEB-10 con un aumento notable de 34,95 veces en la solubilidad presentó un 81,67 % de liberación del fármaco en 5 min en contraste con sólo un 25 % de liberación de RoCa puro. Es importante destacar que el papel del solvente, aunque presente en cantidades mínimas después de la evaporación, no podría subestimarse y la combinación de solventes polares influyó notablemente en la potenciación de la solubilidad de RoCa.

KEY WORDS: increased solubility, rosuvastatin calcium, solid dispersion, soluplus, solvent evaporation,

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: manipharma@yahoo.co.uk, drmirfan@gcu.edu.pk