

In Vitro Evaluation of Alogliptin Encapsulated Novel Floating Microspheres for Gastroretentive Delivery

Anand GOSWAMI *¹, Neetesh Kumar JAIN², & Neelam JAIN³

¹ Faculty of Pharmacy, Oriental University,
Indore-453555, Madhya Pradesh, India.

² Department of Pharmacology, Faculty of Pharmacy, Oriental University,
Indore-453555, Madhya Pradesh, India.

³ Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmacy, Oriental University,
Indore-453555, Madhya Pradesh, India.

SUMMARY. The present study has been performed to microencapsulate alogliptin, an antidiabetic drug (dipeptidyl peptidase-4; DPP-4 inhibitor) for enhancing gastric residence time of drug thereby increasing its bioavailability. The attempt of this study was to formulate the alogliptin loaded floating microspheres by emulsion solvent evaporation technique by varying the ratio of polymers i.e. cellulose acetate butyrate (CAB) and polyethylene oxide (PEO), drug loading and concentration of poly(vinyl alcohol) (PVA) solution. The prepared formulations were studied for entrapment efficiency, particle size, floating behaviour, surface morphology by SEM and *in vitro* drug release. FTIR spectroscopy was done to confirm the chemical stability of drug after penetration of microspheres. Microspheres formed were spherical with smooth surfaces as revealed by SEM. Formulation F3 composed of CAB: PEO (80: 20 wt%) containing 1.5 wt% PVA solution and drug loading (10 wt%) gave the most advantageous entrapment ($87.02 \pm 1.06\%$) and release results after 12 h ($Q_{12h} = 78.19 \pm 0.90\%$) in simulated gastric fluid pH 1.2 as compared to other compositions. The microspheres tend to float over the simulated gastric media for more than 10 h. The % buoyancy of microspheres was found to be up to $89.50 \pm 1.53\%$ and showed gastroretentive delivery of the drug. Floating microspheres of alogliptin with good floating ability and gastroretentive release were developed.

RESUMEN. El presente estudio se ha realizado para microencapsular alogliptina, un fármaco antidiabético (dipeptidil peptidasa-4; inhibidor de DPP-4) para mejorar el tiempo de residencia gástrica del fármaco, aumentando así su biodisponibilidad. El intento de este estudio fue formular las microesferas flotantes cargadas con alogliptina mediante la técnica de evaporación de solventes en emulsión variando la proporción de polímeros, es decir, butirato de acetato de celulosa (CAB) y óxido de polietileno (PEO), carga de fármaco y concentración de alcohol polivinílico (PVA).) solución. Las formulaciones preparadas se estudiaron en cuanto a eficacia de atrapamiento, tamaño de partícula, comportamiento de flotación, morfología superficial por SEM y liberación de fármacos *in vitro*. Se realizó espectroscopia FTIR para confirmar la estabilidad química del fármaco después de la penetración de las microesferas. Las microesferas formadas eran esféricas con superficies lisas como se reveló por SEM. La formulación F3 compuesta por CAB: PEO (80: 20 % en peso) que contenía una solución de PVA al 1,5 % en peso y carga de fármaco (10 % en peso) proporcionó los resultados de atrapamiento más ventajosos ($87,02 \pm 1,06\%$) y liberación después de 12 h ($Q_{12h} = 78,19 \pm 0,90\%$) en fluido gástrico simulado pH 1,2 en comparación con otras composiciones. Las microesferas tienden a flotar sobre el medio gástrico simulado durante más de 10 h. Se encontró que el % de flotabilidad de las microesferas era de hasta $89,50 \pm 1,53\%$ y mostraba una administración gastrorretentiva del fármaco. Se desarrollaron microesferas flotantes de alogliptina con buena capacidad de flotación y liberación gastrorretentiva.

KEY WORDS: alogliptin, emulsion solvent evaporation technique floating microspheres., *in-vitro* drug release.

* Author to whom correspondence should be addressed: E-mail: anandgoswami2@gmail.com