

Preparation and *In Vitro* and *In Vivo* Evaluation of Lutein Solid Dispersion

Xiu ZHANG¹, Qingqing XU¹, Wenli GUO¹, Jiarui YU,
Yanxiao DU², Tingting XU³, & Dandan ZHANG^{1*}

¹ College of Chemical Engineering, Qingdao University of Science and Technology, Qingdao, China

² Qingdao Municipal Hospital, Qingdao, China

³ Qingdao Central Hospital, Qingdao, China

SUMMARY. The aim of the present work was to improve the oral bioavailability of poorly water-soluble lutein. The solvent evaporation method was carried out to prepare lutein solid dispersion (SD) system. The physicochemical properties, dissolution profiles, and bioavailability of lutein SD were evaluated. The optimal preparation conditions of lutein SD were as follows: with polyvinylpyrrolidone K-30 (PVP K30) as the carrier, the ratio of lutein to PVP K30 was 1:20 and the preparation temperature was 70 °C. The accumulated dissolution of lutein SD reached 90.48% in 60 min, the solubility of lutein was obviously improved. Scanning electron microscopy (SEM), differential scanning calorimetry (DSC) and Fourier transformed infrared spectroscopy (FTIR) showed that the lutein particles were uniformly dispersed in PVP K30 in an amorphous state, the lutein-PVP K30 solid dispersion was effectively formed. The pharmacokinetics of the lutein SD was studied in New Zealand rabbits compared to lutein API. The area under the concentration-time curve ($AUC_{(0-\infty)}$) of lutein SD ($210.63 \pm 18.55 \text{ ng} \cdot \text{mL}^{-1} \cdot \text{h}$) was significantly larger than that of the lutein API ($66.54 \pm 8.07 \text{ ng} \cdot \text{mL}^{-1} \cdot \text{h}$), the relative bioavailability was 316.55%. The study demonstrated a great potential of lutein SD as a good formulation in improving solubility and bioavailability.

RESUMEN. El objetivo del presente trabajo fue mejorar la biodisponibilidad oral de luteína poco soluble en agua. Se llevó a cabo el método de evaporación del disolvente para preparar el sistema de dispersión sólida (SD) de luteína. Se evaluaron las propiedades fisicoquímicas, perfiles de disolución y biodisponibilidad de luteína SD. Las condiciones óptimas de preparación de luteína SD fueron las siguientes: con polivinilpirrolidona K-30 (PVP K30) como vehículo, la proporción de luteína a PVP K30 fue de 1:20 y la temperatura de preparación fue de 70 °C. La disolución acumulada de luteína SD alcanzó el 90,48% en 60 min, la solubilidad de la luteína obviamente mejoró. La microscopía electrónica de barrido (SEM), la calorimetría diferencial de barrido (DSC) y la espectroscopía infrarroja transformada de Fourier (FTIR) mostraron que las partículas de luteína estaban uniformemente dispersadas en PVP K30 en un estado amorfo, la dispersión sólida de luteína-PVP K30 se formó de manera efectiva. La farmacocinética de luteína SD se estudió en conejos de Nueva Zelanda en comparación con luteína API. El área bajo la curva de concentración-tiempo ($AUC_{(0-\infty)}$) de luteína SD ($210,63 \pm 18,55 \text{ ng mL}^{-1} \text{ h}$) fue significativamente mayor que la del API de luteína ($66,54 \pm 8,07 \text{ ng mL}^{-1} \text{ h}$), la biodisponibilidad relativa fue del 316,55%. El estudio demostró un gran potencial de la luteína SD como una buena formulación para mejorar la solubilidad y la biodisponibilidad.

KEY WORDS: lutein, characterization, pharmacokinetics, relative bioavailability, solid dispersion.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: 312685423@qq.com