

Development and Evaluation of Amoxicillin Formulations by Direct Compression: Influence of the Adjuvants on Physicomechanical and Biopharmaceutical Properties of the Tablets

Kerly F. M. PASQUALOTO*¹, José Aparício B. FUNCK ¹,
Fabiana E. B. da SILVA ^{1,2}, Cristiane de P. KRATZ ^{1,3}

¹ PPG em Ciência e Tecnologia Farmacêuticas, Departamento de Farmácia Industrial, Centro de Ciências da Saúde, Faculdade de Farmácia, Universidade Federal de Santa Maria, Camobi, Santa Maria, RS 97119-900, Brasil.

² Departamento de Ciências da Saúde, Curso de Farmácia, Universidade Regional Integrada do Alto Uruguai - URI, Campus de Erechim, Erechim, RS 99700-000, Brasil.

³ Departamento de Ciências da Saúde, Curso de Farmácia, Universidade Regional Integrada do Alto Uruguai e das Missões - URI, Campus de Santo Ângelo, Santo Ângelo, RS 98802-470, Brasil.

SUMMARY. The amoxicillin 500 mg formulations were developed by direct compression using a 2³ factorial design. Eight different formulations were carried out and they were analyzed considering three levels: the type of microcrystalline cellulose (Avicel® PH-102 or Avicel® PH-200), the presence or absence of spray-dried lactose, and the presence or absence of the superdisintegrant agent, croscarmellose sodium. Average weight, thickness and diameter, hardness, friability, amoxicillin concentration (iodometric assay), disintegration time, and dissolution profile were the parameters used for the tablets evaluation. Considering all evaluated parameters, a suitable amoxicillin 500 mg tablet formulation should present the microcrystalline cellulose type Avicel® PH-102 and the superdisintegrant agent, croscarmellose sodium (Ac-di-sol® SD-711), in its composition.

RESUMEN. “Desarrollo y evaluación de formulaciones de Amoxicilina por compresión directa: influencia de los adyuvantes sobre las propiedades físico-mecánicas y biofarmacéuticas de los comprimidos”. Formulaciones de amoxicilina 500 mg fueron desarrolladas por el método de compresión directa utilizando planeamiento factorial 2³. Ocho formulaciones diferentes fueron planeadas y analizadas considerando tres niveles: el tipo de celulosa microcristalina (Avicel® PH-102 o Avicel® PH-200), la presencia o ausencia de lactosa liofilizada y la presencia o ausencia de agente superdesintegrante, croscarmelosa sódica. Los parámetros utilizados para la evaluación de los comprimidos fueron: peso medio, espesor y diámetro, friabilidad, concentración de amoxicilina (ensayo iodométrico), tiempo de desintegración y perfil de disolución. Una formulación adecuada de comprimidos de amoxicilina 500 mg deberían contener en su composición celulosa microcristalina tipo Avicel® PH-102 y el agente superdesintegrante croscarmelosa sódica (Ac-di-sol® SD-711).

KEY WORDS: Direct compression, Factorial design, Physicochemical properties, Physicomechanical and biopharmaceutical properties, Preformulation, Solid dosage form.

PALABRAS CLAVE: Compresión directa, Forma farmacéutica sólida, Planeamiento factorial, Preformulación, Propiedades físico-mecánicas y biofarmacéuticas, Propiedades físico-químicas.

* Author to whom correspondence should be addressed. *Current address:* Laboratório de Quimiometria Teórica e Aplicada – LQTA, Departamento de Físico-Química, Instituto de Química, Universidade Estadual de Campinas - UNICAMP, Sala H 209, Caixa Postal 6154, Campinas, SP 13083-970, Brasil. *E-mail:* kerly@netpoint.com.br