

Enhanced Analgesic Activity and Reduced Gastric Ulceration Potential of Ibuprofen Sodium through a Novel Bouyant *In Situ* Gelling System

Mohammed JAFAR ¹*, Hajer S. ALGHAMDI ¹, Mohammed S. KHALID ²,
Maryam J. AL-HUSSAIN ¹, Sarah A. ALGHAMDI ¹, Zainab Y. ALAHAMAD ¹ & Ali M. ALMOUMEN ¹

¹ Department of Pharmaceutics, College of Clinical Pharmacy, Imam Abdulrahman Bin Faisal University, P.O. Box 1982, Dammam-31441, Saudi Arabia.

² Department of Pharmacology, College of Clinical Pharmacy, Imam Abdulrahman Bin Faisal University, P.O. Box 1982, Dammam-31441, Saudi Arabia.

SUMMARY. This study was aimed at improving the analgesic activity and at minimizing the gastric ulceration potential of ibuprofen sodium through gastric buoyant *in situ* gelling system. Box-Behnken design was employed to optimize the formulations. The optimized gastric floating *in situ* gel with short floating lag time (0.8 min), low viscosity (105.75 cps), and optimum *in vitro* drug release at 24th h was obtained using an optimized combination of CaCO₃ (1.2 % w/v); gellan gum (0.4 % w/v) and ibuprofen sodium (1.5 % w/v). The analgesic effect of optimized formulation was found to be better than that of pure ibuprofen sodium (7.61 ± 0.23) at 4th h. Ulcerogenic study showed that optimized floating gel formulation produce less damage (almost 43% less) to the gastric mucosa than the severe gastric injury produced by pure ibuprofen sodium. Thus buoyant *in situ* gel approach was found to be promising in enhancing the analgesic effect and minimizing the gastric ulceration potential of ibuprofen sodium.

RESUMEN. Este estudio tuvo como objetivo mejorar la actividad analgésica y minimizar el potencial de ulceración gástrica del ibuprofeno sódico a través del sistema de gelificación *in situ* flotante gástrico. El diseño de Box-Behnken se empleó para optimizar las formulaciones. Se obtuvo un gel *in situ* gástrico optimizado con un corto tiempo de demora de flotación (0,8 min), baja viscosidad (105,75 cps) y liberación óptima del fármaco *in vitro* a las 24 h usando una combinación optimizada de CaCO₃ (1,2% p/v), goma gellan (0,4% p/v) e ibuprofeno sódico (1,5% p/v). El efecto analgésico de la formulación optimizada resultó ser mejor que el del ibuprofeno sódico puro (7.61 ± 0.23) a las 4 h. Un estudio ulcerogénico mostró que la formulación optimizada de gel flotante produce menos daño (casi un 43% menos) en la mucosa gástrica que la lesión gástrica grave producida por el ibuprofeno de sodio puro. Por lo tanto, se encontró que el enfoque de gel *in situ* flotante era prometedor para mejorar el efecto analgésico y minimizar el potencial de ulceración gástrica del ibuprofeno sódico.

KEY WORDS: Box-Behnken design, GRDDS, ibuprofen, *in vitro* drug release, *in vivo* activity.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: mjomar@iau.edu.sa