

In vitro-Ex vivo Characterization of Agarose – Carbopol 934[®] Based Buccal Mucoadhesive Tablets Containing Benzocaine and Tibezonium Iodide as Model Drugs

Muhammad A. SYED ^{1,2}, Ameer F. ZAHOOR ³, Muhammad S. IQBAL ⁴, Haroon K. SYED ¹, Ikram U. KHAN ¹, Muhammad A. SHAH ⁵, Sana HANIF ⁶, Noorul A. MOHSIN ⁷, Nayyer ISLAM ¹, Muzzamil IKRAM ⁸, Muhammad A. QAYYUM ⁹, Sana INAM ¹, & Muhammad IRFAN ^{1*}

¹ Faculty of Pharmacy, The University of Lahore, Lahore, Pakistan

² Department of Pharmaceutics, Faculty of Pharmaceutical Sciences, GC University Faisalabad, Pakistan

³ Department of Chemistry, GC University, Faisalabad, Pakistan

⁴ Department of Clinical Pharmacy, College of Pharmacy, Prince Sattam bin Abdulaziz University, Alkharj, Kingdom of Saudi Arabia

⁵ Department of Pharmacognosy, Faculty of Pharmaceutical Sciences, GC University Faisalabad, Pakistan

⁶ Faculty of Pharmacy, University of Sargodha, Sargodha, Pakistan

⁷ Department of Pharmaceutical Chemistry, Faculty of Pharmaceutical Sciences, GC University Faisalabad, Pakistan

⁸ Department of Radiology, Madinah Teaching Hospital, The University of Faisalabad, Faisalabad, Pakistan

⁹ Department of Chemistry, Division of Science & Technology, University of Education, Lahore, Pakistan

SUMMARY. The release of locally acting drugs can be targeted using mucoadhesive platform. Natural biodegradable polymers are considered as suitable contenders as mucoadhesive polymers. The aim of current research was to evaluate mucoadhesive role of agarose (AG) by preparing directly compressible tablets. AG was aided by carbopol[®] (CP) for simultaneous release of benzocaine (BZN) and tibezoneium iodide (TIB) from mucoadhesive tablets. In order to prepare tablets, ingredients were mixed geometrically and compressed using a ZP35 rotary tablet machine. The prepared tablets were characterized for physical, *ex vivo* mucoadhesive time (ET) and mucoadhesive strength (MS), swellability, erosion and *in vitro* drugs release. The solid state studies revealed that no unusual peak in the physical mixture of ingredients through FTIR and DSC analysis. Values of weight variation and friability tests of the tablet formulations complied with USP specifications which showed that variation in the polymers did not affect physical parameters of the tablets. The highest ET (24.3 h) and MS (22.6 g) values were associated with formulation T9. Maximum erosion was observed in T1 formulation with lowest concentration of AG (10%) used in the study. Similarly, higher SI was observed with T2 (74.02%) at 6 h. The optimized tablet formulation T2 showed complete drug release after 6 h with better swelling. In addition, when polymers were used alone, AG exhibited poor MS and ET values compared to CP whereas polymers used in combination (AG-CP) exhibited much better properties. Therefore, it was concluded that AG when combined with a mucoadhesive agent like CP have much improved potential to effectively deliver drugs.

RESUMEN. RESUMEN. La liberación de fármacos de acción local puede orientarse utilizando una plataforma mucoadhesiva. Los polímeros biodegradables naturales se consideran contendientes adecuados como polímeros mucoadhesivos. El objetivo de la investigación actual fue evaluar el papel mucoadhesivo de la agarosa (AG) mediante la preparación de tabletas comprimibles directamente. AG fue asistido por carbopol[®] (CP) para la liberación simultánea de benzocaína (BZN) y yoduro de tibezoneio (TIB) de tabletas mucoadhesivas. Para preparar las tabletas, los ingredientes se mezclaron geométricamente y se comprimieron utilizando una máquina rotatoria de tabletas ZP35. Los comprimidos preparados se caracterizaron por el tiempo mucoadhesivo (ET) físico y *ex vivo* y la fuerza mucoadhesiva (MS), capacidad de hinchamiento, erosión y liberación de fármacos *in vitro*. Los estudios de estado sólido revelaron que no hubo un pico inusual en la mezcla física de ingredientes a través del análisis FTIR y DSC. Los valores de las pruebas de variación de peso y friabilidad de las formulaciones de las tabletas cumplieron con las especificaciones de la USP que mostraron que la variación en los polímeros no afectó los parámetros físicos de

KEY WORDS: antiseptic., benzocaine, local anesthetic. mucoadhesive buccal tablets, tibezoneium iodide.

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

las tabletas. Los valores más altos de ET (24,3 h) y MS (22,6 g) se asociaron con la formulación T9. Se observó la máxima erosión en la formulación T1 con la concentración más baja de AG (10%) utilizada en el estudio. De igual forma, se observó mayor SI con T2 (74,02%) a las 6 h. La formulación de tableta optimizada T2 mostró una liberación completa del fármaco después de 6 h con mejor hinchazón. Además, cuando los polímeros se usaron solos, AG exhibió valores bajos de MS y ET en comparación con CP, mientras que los polímeros usados en combinación (AG-CP) exhibieron propiedades mucho mejores. Por lo tanto, se concluyó que AG, cuando se combina con un agente mucoadhesivo como CP, tiene un potencial mucho mayor para administrar fármacos de manera eficaz.
