

Formulation and Optimization of Solid Lipid Nanoparticle of Gemifloxacin Mesylate for Pulmonary Delivery by Using Box-Behnken Design

Ganesh Kumar GUDAS¹, Venkata Naga JYOTHI², Patlolla ALIVELU³,
Badri NAGARANI¹, Shyam PANGA⁴, Roshini SURYAVANSHI⁴ & Kola VENU⁴*

¹ Department of Pharmaceutics, Srikrupa Institute of Pharmaceutical Sciences,
Siddipet, Telangana, India-502277

² Department of Pharmaceutics, K.L. College of Pharmacy, KLEF Deemed to be University,
Guntur, Andhrapradesh, India-522501

³ Department of Pharmaceutics, Arya College of Pharmacy, Sangareddy,
Telangana, India-502285

⁴ Department of Pharmacy, Sevashikshan Prasarak Mandal's DR.N.J.
Paulbudhe College of Pharmacy, Ahmednagar, Maharashtra, India-414003

SUMMARY. Gemifloxacin mesylate is an oral broad-spectrum antibacterial agent used in the treatment of acute bacterial exacerbation of chronic bronchitis and mild-to moderate pneumonia. The aim of the present study was to formulate and optimize a solid lipid nanoparticle system to deliver Gemifloxacin mesylate to the lungs. Gemifloxacin mesylate -loaded solid lipid nanoparticles were prepared by the hot emulsification method by using Precirol as lipid, surfactant and co-surfactant such as Poloxamer 188 & Soy lecithin in various concentrations. A three-factor, three-level Box-Behnken design was used to explore and optimize the main effects, interaction effects, and quadratic effects of the formulation ingredients on the performance of the solid lipid nanoparticle there by total 17 formulations were made with above concentrations. The impact of various processing variables was assessed on the particle size, entrapment efficiency and dissolution time. The size and morphology of the prepared nanoparticles were studied using scanning electron microscope. particle size, entrapment efficiency and *in vitro* dissolution time of optimized formulation GF10 were predicted and confirmed to be 126 ± 6 nm, 92.4 ± 3.63 %, and 98.35 ± 2.45 at 12 h, respectively. Since the preparation and evaluation of the selected formulation within the laboratory yielded acceptable results with low error percent, the modeling and optimization was justified. Our results provide fundamental data for the application of solid lipid nanoparticles in pulmonary delivery system of Gemifloxacin mesylate.

RESUMEN. El mesilato de gemifloxacina es un agente antibacteriano oral de amplio espectro que se utiliza en el tratamiento de la exacerbación bacteriana aguda de la bronquitis crónica y la neumonía leve a moderada. El objetivo del presente estudio fue formular y optimizar un sistema de nanopartículas lipídicas sólidas para administrar mesilato de gemifloxacina a los pulmones. Las nanopartículas lipídicas sólidas cargadas con mesilato de gemifloxacina se prepararon mediante el método de emulsión en caliente utilizando Precirol como lípido, surfactante y cosurfactante como Poloxamer 188 y lecitina de soja en varias concentraciones. Se utilizó un diseño Box-Behnken de tres factores y tres niveles para explorar y optimizar los efectos principales, los efectos de interacción y los efectos cuadráticos de los ingredientes de la formulación en el rendimiento de la nanopartícula lipídica sólida; por lo tanto, se realizaron un total de 17 formulaciones con las concentraciones anteriores. Se evaluó el impacto de varias variables de procesamiento en el tamaño de partícula, la eficiencia de atrapamiento y el tiempo de disolución. El tamaño y la morfología de las nanopartículas preparadas se estudiaron mediante microscopio electrónico de barrido. Se predijo y confirmó que el tamaño de partícula, la eficiencia de atrapamiento y el tiempo de disolución *in vitro* de la formulación optimizada GF10 eran 126 ± 6 nm, 92.4 ± 3.63 % y 98.35 ± 2.45 a las 12 h, respectivamente. Dado que la preparación y evaluación de la formulación seleccionada en el laboratorio arrojó resultados aceptables con un bajo porcentaje de error, se justificaron el modelado y la optimización. Nuestros resultados proporcionan datos fundamentales para la aplicación de nanopartículas lipídicas sólidas en el sistema de administración pulmonar de mesilato de gemifloxacina.

KEY WORDS: Box- Behnkenm, gemifloxacin mesylatem, solid lipid nanoparticles.

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