

Studying the Effect of Variables on Acyclovir Microsponge

Noor Y. Fareed^{*1} and Hanan J. Kassab^{**}

^{*}Department of Pharmaceutics, College of Pharmacy, University of Basra, Basra, Iraq.

^{**}Department of Pharmaceutics, College of Pharmacy, University of Baghdad, Baghdad, Iraq.

Abstract

The aim of the present investigation was to develop a microsponge delivery system of acyclovir to control its release when applied topically thereby reducing dosing frequency and enhancing patient compliance. The microsponge was produced by oil in oil emulsion solvent diffusion method. The effect of different formulation and process variables such as internal phase volume, polymer type, drug polymer ratio, stirring speed and stirring duration on microsponge production yield, loading efficiency, particle size, and *in vitro* drug release was evaluated. The results showed that the microsponge F2 prepared from Eudragit RS polymer had optimum physical properties regarding loading efficiency of $99.71 \pm 0.7\%$ and production yield which was 85%. Also, F2 showed 66% drug release through 8 hours. Accordingly, the oil in oil emulsion solvent diffusion method is an effective technique to formulate microsponge with maximum production yields and loading efficiency for acyclovir.

Keywords: Microsponge, Acyclovir, Controlled topical release, Oil in oil emulsion solvent diffusion method.

دراسة تأثير المتغيرات على اسفنجيات الاسايكلوفير المايكروية نور يوسف فريد^{*}، و حنان جلال كساب^{**}

^{*} فرع الصيدلانيات، كلية الصيدلة، جامعة البصرة، البصرة، العراق.

^{**} فرع الصيدلانيات، كلية الصيدلة، جامعة بغداد، بغداد، العراق.

الخلاصة

الغرض من الدراسة المقدمة هو تصنيع وتقييم عقار الاسايكلوفير كاسفنجيات مايكرويه للتحكم بتحرر العقار عند وضعه على الجلد لغرض تقليل عدد الجرعات اليومية وزيادة امتثال المريض للعلاج. حضرت الاسفنجيات المايكرويه بواسطة طريقة شبه المستحلب المتضمن انتشار المذيب إلى المكون الخارجي الزيتي ثم اختبر تأثير متغيرات طريقة التحضير كنسبة الدواء إلى البوليمر، سرعة الخلط، مدة الخلط، نوع البوليمر، وحجم المذيب في الطور الداخلي للمستحلب. كما تم تقييم الاسفنجيات بالنسبة إلى حجم الجسيمات، الحصىلة الإنتاجية، كفاءة التحميل، خصائص السطح وتحرر الدواء خارج الجسم. أثبتت النتائج ان التركيبة (٢) أبدت أفضل الخصائص الفيزيائية للاسفنجيات المايكروية، كقابلية الإنتاجية بمقدار $99.71 \pm 0.7\%$ ، وقابلية التحميل التي كانت 85% . كما أن التركيبة (٢) أبدت تحرر للدواء خارج الجسم 66% خلال ٨ ساعات. من خلال نتائج الدراسة تبين نجاح طريقة شبه المستحلب المتضمن انتشار المذيب إلى المكون الخارجي الزيتي لتحضير أسفنجيات الاسايكلوفير المايكروية بقدرة إنتاجية وكفاءة تحميل عالية.

الكلمات المفتاحية: اسفنجيات، الاسايكلوفير، التحكم بتحرر العقار، طريقة شبه المستحلب المتضمن انتشار المذيب.

Introduction

Microsponges are polymeric porous microspheres used for controlled delivery of medications⁽¹⁾. This technology has been used for topical formulations and recently for oral administration. Microsponges are biologically safe and are believed to contribute towards reducing side effects, improved stability, increased elegance and enhanced formulation flexibility⁽²⁾. Even though microsponges are very small in size; they are not able to permeate the skin and are not absorbed systemically; therefore, they are considered drug delivery systems for topical use.

Microsponges accumulate in the tiny nooks and crannies of the skin, and release slowly the entrapped drug as the skin requires⁽³⁾.

Microsponges MS can be incorporated into a wide variable of pharmaceutical dosage form, like tablets⁽⁴⁾, capsules⁽⁵⁾, powders, creams⁽⁶⁾, topical emulsions⁽⁷⁾, gels⁽⁸⁻¹⁰⁾, etc. Acyclovir ACV was the first antiviral to be approved for the treatment of viral infections such as herpes simplex, varicella zoster virus and Epstein Barr infections⁽¹¹⁾. ACV is hydrophilic in nature having water solubility of 2.5mg/ml at 37° C. The chemical structure of ACV is shown in Figure 1.

¹Corresponding author E-mail: nalbassam@ymail.com

Received: 8 / 8 / 2018

Accepted: 3 / 10 / 2018