

CZU: 615.454.1.014.2:615.357

DEZVOLTAREA ȘI CARACTERIZAREA GELURILOR TERMOREVERSIBILE CU MOMETAZONĂ

Emőke Margit RÉDAI¹, Beáta FERENCZ¹, Robert-Alexandru VLAD¹,
Paula ANTONOAEA¹, Cornelia-Titiana Cotoi¹, Nicoleta TODORAN¹, Emese SIPOS²,
Adriana CIURBA¹

¹ *Disciplina de Tehnologie farmaceutică și cosmetologie;* ² *Disciplina de Industria medicamentului și management farmaceutic, Facultatea de Farmacie, Universitatea de Medicină, Farmacie, Științe și Tehnologie „George Emil Palade” din Târgu Mureș, România;*

Introducere. Formulările cu gelificare *in situ* sunt sisteme de eliberare a medicamentului, care există în formă lichidă la temperatura camerei și care după aplicarea pe mucoasa nazală, se transformă în geluri semisolide, ca răspuns la diverși stimuli chimici sau fizici. Încorporarea particulelor în sistemele de gelificare *in situ* este benefică pentru prelungirea eliberării medicamentului, reducerea frecvenței de administrare și a dozei de substanță activă, și pentru îmbunătățirea eficacității produselor farmaceutice [1,2].

Scopul lucrării. Scopul prezentei lucrării este dezvoltarea și caracterizarea unor sisteme termoreversibile cu conținut de furoat de mometazonă pentru administrare nazală.

Material și metode. S-au formulat geluri cu 0,05% furoat de mometazonă (MF) pe bază de Poloxamer 407 în concentrație de 14, 15 și 16 %, combinate cu trei tipuri de Carbopol 940, 71G și Ultrez 10. Gelurile sunt izotonizate cu clorură de sodiu, conțin PEG 400, conservant, iar neutralizarea Carbopolului s-a realizat cu trietanolamină. Gelurile cu și fără substanță activă au fost studiate în ceea ce privește transparență, temperatură de gelificare, pH-ul, textura, dimensiune particulelor, difuziunea substanței active prin membrană sintetică.

Rezultate și discuții: Gelurile clare și transparente devin ușor albicioase după suspendarea MF. Temperatura de gelificare variază între 26 și 28°C. După încorporarea substanței active, valorile pH-ului scad ușor, dar rămân în jurul valorii de 8, gelurile fiind ușor bazice. Prin analiza de textură s-a determinat mucoadezivitatea, care variază între 178 și 342 mJ la gelurile martor și 312 și 370 mJ la cele cu MF. Dimensiunea particulelor micronizate evaluată prin microscopie variază între 1,33±0,34 și 1,57±0,36 μm. Cantitatea de mometazonă eliberată după 120 de minute este între 50,60 și 59,79%.

Concluzii S-au realizat patru geluri cu conținut de Poloxamer 407 cu gelificare *in situ*. Temperatura de gelificare este influențată de concentrația de Poloxamer și tipul Carbopolului. Adezivitatea gelurilor crește cu încorporarea substanței active. După două ore gelurile cedează peste 50 % din substanța activă.

Cuvinte cheie: Poloxamer, Carbopol, sistem termoreversibil, mometazonă, analiză de textură.

Bibliografie.

1. Kolawole OM, Cook MT - In situ gelling drug delivery systems for topical drug delivery, Eur J Pharm Biopharm, 2023, 184:36-49, doi: 10.1016/j.ejpb.2023.01.007.
2. Konatham M, Gorle MT, Pathakala N, Bakshi V, Mamidiseti YD, Chinthakindi P et. al - In situ gel polymers: A review, Int J Appl Pharm, 2021, 13(1):86-90, doi: 10.22159/ijap.2021v13i1.39504.

CZU: 615.454.1.014.2:615.357

DEVELOPMENT AND CHARACTERIZATION OF THERMOREVERSIBLE HYDROGELS WITH MOMETASONE

Emőke Margit RÉDAI¹, Beáta FERENCZ¹, Robert-Alexandru VLAD¹,
Paula ANTONOAEA¹, Cornelia-Titiana COTOI¹, Nicoleta TODORAN¹, Emese SIPOS²,
Adriana CIURBA¹

¹Pharmaceutical Technology and Cosmetology Department; ²Pharmaceutical industry and management Department, Faculty of Pharmacy, „George Emil Palade” University of Medicine, Pharmacy, Science and Technology of Târgu Mureș, Romania.

Introduction. *In situ* gel-forming preparations are delivery systems existing as liquids at room temperature that will transform into gels after application in the nasal cavity triggered by chemical or physical stimuli. The incorporation of the active pharmaceutical ingredients in this delivery system offers prolonged drug liberation, reduction of daily administration, and enhanced efficacy [1,2].

Aim of the study. This study aimed to develop and characterize of *in situ* gel-forming delivery system with mometasone furoate (MF) for nasal administration.

Material and methods. 0.05% mometasone furoate containing Poloxamer 407-based systems were developed in three different concentrations 14, 15, and 16 %, combined with three different Carbopol types 940, 71G, and Ultrez 10. The gels were isotonized with sodium chloride, containing PEG 400 and a preservative. Carbopol was neutralized with triethanolamine. Gels with and without MF were analyzed for transparency, gelation temperature, pH, texture, particle size by microscopy and dissolution through a synthetic membrane.

Results and discussion. Transparent gels transform into opalescent slightly white gels after suspending MF. Gelation temperature varies between 26 and 28°C. pH values slightly decrease after suspending MF but remain around 8. Mucoadhesivity determined by texture analysis varies between 178 and 342 mJ for blank gels and 312 și 370 mJ for gels with MF. Particle size is between 1.33±0.34 and 1.57±0.36 μm. Dissolved MF after 120 minutes is between 50.60 and 59.79%.

Conclusions. Four Poloxamer 407-based *in situ* gel-forming delivery systems were developed. Gelation temperature was influenced by the concentration of Poloxamer and Carbopol type. Adhesivity increases by the suspension of MF. After 2 hours, more than 50 % of MF was dissolved.

Key words: Poloxamer, Carbopol, *in situ* gel-forming, mometasone, texture analysis.

Bibliography.

1. Kolawole OM, Cook MT - In situ gelling drug delivery systems for topical drug delivery, Eur J Pharm Biopharm, 2023, 184:36-49, doi: 10.1016/j.ejpb.2023.01.007.
2. Konatham M, Gorle MT, Pathakala N, Bakshi V, Mamidiseti YD, Chinthakindi P et. al - In situ gel polymers: A review, Int J Appl Pharm, 2021, 13(1):86-90, doi: 10.22159/ijap.2021v13i1.39504.

Authors' ORCID

Emőke Margit Ré dai <https://orcid.org/0000-0002-1186-4125>
Paula Antonoaea <https://orcid.org/0000-0002-8380-966X>
Cornelia-Titiana Cotoi <https://orcid.org/0009-0004-5519-5359>
Nicoleta Todoran <https://orcid.org/0000-0001-6474-6248>
Emese Sipos <https://orcid.org/0000-0002-1820-244X>
Adriana Ciurba <https://orcid.org/0000-0002-3456-4109>