



P2-PS-6

Nicotine - Magnesium Aluminum Silicate Microparticles:

In vitro Evaluations

Watchara Kanjanakawinkul¹, Satit Puttipipatkachom²,
Thaned Pongjanyakul^{1,*}

Introduction: Nicotine (NCT) has been used for smoking cessation. It can interact with magnesium aluminum silicate (MAS), a negatively charged clay, via electrostatic interaction and hydrogen bonding, leading to the formation of NCT-MAS complex flocculates. The aim of this study was to prepare NCT-MAS microparticles by using lyophilization in order to maintain the original morphology of the NCT-MAS flocculates. Effects of pH and NCT-MAS ratio on the characteristics of the microparticles were investigated. **Materials and method:** NCT-MAS microparticles were prepared by varying preparation pHs and NCT-MAS ratios. NCT (in aqueous solution) was dropped into MAS suspension at pH 4 or pH 7 to obtain NCT-MAS ratios of 0.05:1, 0.10:1, and 0.20:1. The microparticles were collected by filtration and dried by lyophilization. The general appearances and physicochemical properties of microparticles were investigated, such as crystallinity by PXRD, thermal behavior by DSC, mucoadhesion properties by texture analyzer, and drug release and permeation behavior by using Franz diffusion cell. **Results:** The obtained microparticles had an irregular shape. The size and NCT content of the microparticles increased from 105 to 200 μm and 4.7 to 15.7 %, respectively, when increasing the NCT amount. The shifting of basal spacing peak in PXRD patterns to lower angle indicated increasing of interlayer space of MAS which supposed that NCT could intercalate into the MAS layers. Intercalation of NCT into the MAS layers enhanced thermal stability of NCT and resulted in a sustained release of NCT after an initial burst release. Microparticles prepared at pH 4 gave a lower permeation rate of NCT across porcine mucosal membrane than those prepared at pH 7. All of microparticles had mucoadhesion properties for adhesion to the porcine mucosa. **Conclusion:** These findings can deduce that the preparation pHs and NCT-MAS ratios of NCT-MAS microparticles could alter physicochemical properties, NCT release and NCT permeation across mucosal membrane. The NCT-MAS microparticles showed a good potential for drug delivery system with enhancing NCT stability, sustaining NCT release, and having mucoadhesive properties.

Keywords: Nicotine, Magnesium aluminum silicate, Microparticles, Drug delivery system

¹ Faculty of Pharmaceutical Sciences, Khon Kaen University, Khon Kaen 40002, Thailand.

² Department of Manufacturing Pharmacy, Faculty of Pharmacy, Mahidol University, Bangkok 10400, Thailand.

* Corresponding Author: Tel: +66 8 5011 3176
e-mail : Thaned@kku.ac.th

P2-PS-7

ผลของแบ่งต่อคุณลักษณะของไฮโดรเจลที่เตรียมได้จากยางธรรมชาติ

จตุพร ประทุมเทศ^๑, วรวิภา ศิลอ่อน^๑, ชัยวุฒิ วัจจัน^๑,
อุษณา พัวเพิ่มพูลศิริ^{๑*}

บทนำ: ปัจจุบันการนำไฮโดรเจลไปประยุกต์ใช้ในการทางการแพทย์เป็นไปอย่างกว้างขวาง เนื่องจากสามารถใช้ในการดูดซับของเหลวและบรรจุสารหรือยาได้ ดังนั้นไฮโดรเจลจึงเป็นทางเลือกหนึ่งในการนำมาพัฒนาใช้เป็นวัสดุทางเภสัชกรรม ปัจจุบันไฮโดรเจลเป็นวัสดุสังเคราะห์ที่ได้จากการนำเข้าและมีราคาแพง เพื่อเป็นการส่งเสริมกระบวนการในการพึ่งตนเองทางอุตสาหกรรมการผลิต การศึกษาจึงมีวัตถุประสงค์เพื่อศึกษาผลของแบ่งต่อคุณลักษณะของไฮโดรเจลที่เตรียมได้จากยางธรรมชาติโดยการสร้างโครงร่างตาข่ายพอลิเมอร์แบบแทรกสอด โดยการผสมยางพาราและแบ่งธรรมชาติ 3 ชนิด ที่มีปริมาณอะไมโดสและอะไมโดเพคตินที่แตกต่างกัน (แบ่งชนิดที่ 1, 2 และ 3) **วิธีการทดลอง:** เตรียมยางด้วยวิธีพรีแร็คคัลพอลิเมอร์ไอโซไซยานู โดยมี โพแทสเซียมเปอร์ซัลเฟต (KPS) เป็นตัวริเริ่มปฏิกิริยา จากนั้นนำมาผสมกับแบ่งแต่ละชนิดที่อุณหภูมิห้อง (37 องศาเซลเซียส) และทำการศึกษาค่าผลของอัตราส่วนยางต่อแบ่ง และ ปริมาณของสารเชื่อมขวาง (*N,N'*-Methylenebisacrylamide, MBA) ต่อคุณสมบัติของไฮโดรเจล ได้แก่ คุณสมบัติการบวมพอง, คุณสมบัติการดูดซับน้ำและการเกิดโครงร่างตาข่าย **ผลการศึกษา:** จากการทดสอบคุณสมบัติการบวมพองและการดูดซับน้ำ พบว่าผลของแบ่งต่างกันให้ผลการบวมพองและการดูดซับน้ำแตกต่างกันอย่างมีนัยสำคัญทางสถิติ ($p < 0.05$) ที่ปริมาณสารเชื่อมขวาง 1 phr แบ่งชนิดที่ 3 ให้ผลการบวมพองเท่ากับ 83.63 ± 5.19 % ผลการดูดซับน้ำเท่ากับ 45.52 ± 1.52 % ซึ่งสูงกว่าที่พบในแบ่งชนิดที่ 1 (44.04 ± 2.52 %, 30.56 ± 1.20 %) และแบ่งชนิดที่ 2 (62.26 ± 3.36 %, 38.35 ± 1.28 %) และอัตราส่วนยางต่อแบ่ง 1:2 มีการบวมพองและการดูดซับน้ำสูงสุดเท่ากับ 121.25 ± 1.50 %, 54.78 ± 0.33 % ตามลำดับ เมื่อใช้ปริมาณสารเชื่อมขวางที่แตกต่างกัน ได้แก่ 1, 1.5, 2 และ 2.5 phr พบว่า ค่าการบวมพองและการดูดซับน้ำไม่มีความแตกต่างกันอย่างมีนัยสำคัญทางสถิติ ($p > 0.05$) ในแต่ละความเข้มข้นที่ทำการศึกษา โดยมีค่าการบวมพองและการดูดซับน้ำสูงสุดเท่ากับ 135.65 ± 1.07 %, 57.56 ± 0.19 % ตามลำดับ จากนั้นทำการศึกษาค่าการเกิดโครงร่างตาข่ายของพอลิเมอร์ด้วยวิธีโซลูเบิลแฟคชัน ซึ่งประกอบด้วย 2 ส่วนคือ สัดส่วนโซล (sol fraction) และสัดส่วนเจล (gel fraction) โดยสัดส่วนเจลเป็นส่วนที่พอลิเมอร์ไม่ละลายในตัวทำละลาย ขณะที่สัดส่วนโซลเป็นส่วนที่ไม่เกิดโครงร่างตาข่ายสามารถละลายในตัวทำละลาย พบว่าปริมาณสารเชื่อมขวาง MBA ที่ความเข้มข้น 1, 1.5, 2 และ 2.5 phr เกิดสัดส่วนเจลเท่ากับ 83.09 ± 0.28 %, 80.32 ± 0.44 %, 81.72 ± 0.86 % และ 82.82 ± 0.30 % ตามลำดับ (ที่ความเข้มข้น maleic acid คงที่, 2.5 phr) และที่ปริมาณสารเชื่อมขวาง 1 phr พบว่ามีค่า %polymer weight loss น้อยที่สุด แสดงให้เห็นว่าปริมาณสารเชื่อมขวางมีผลต่อการเกิดการเชื่อมขวางในระบบไฮโดรเจล **สรุปผล:** ชนิด, ปริมาณของแบ่งและปริมาณของสารเชื่อมขวางมีผลต่อคุณสมบัติการบวมพอง การดูดซับน้ำและการเกิดโครงร่างตาข่ายของไฮโดรเจลที่ได้จากยางธรรมชาติและแบ่ง โดยแบ่งชนิดที่ 3 อัตราส่วนยางต่อแบ่ง 1:2 ที่ปริมาณสารเชื่อมขวางที่ 1 phr มีความเหมาะสมในการนำมาพัฒนาใช้เป็นวัสดุทางเภสัชกรรมและปริมาณของสารเชื่อมขวางในระบบที่ต่างกันมีผลทำให้เกิดโครงร่างตาข่ายที่ต่างกันอีกด้วย

คำสำคัญ: ไฮโดรเจล, โครงร่างตาข่ายพอลิเมอร์แบบแทรกสอด, ยางธรรมชาติ, แบ่ง

^๑ ภาควิชาเภสัชเคมีและเทคโนโลยีเภสัชกรรม คณะเภสัชศาสตร์

^๒ ภาควิชาเคมี คณะวิทยาศาสตร์ มหาวิทยาลัยอุบลราชธานี อ.วารินชำราบ จ.อุบลราชธานี 34190

*ติดต่อผู้พิมพ์: อุษณา พัวเพิ่มพูลศิริ ภาควิชาเภสัชเคมีและเทคโนโลยีเภสัชกรรม คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยอุบลราชธานี อ.วารินชำราบ จ.อุบลราชธานี 34190 Tel: 089-946-8383, E-mail: utsana@gmail.com