

Formulasi dan evaluasi dissolving microneedles yang mengandung lidokain hidroklorida sebagai sistem penghantaran intradermal = Development of lidocaine hydrochloride-loaded dissolving microneedles as an intradermal local anaesthetic

Lissa Florencia Putri Sutrisna, author

Deskripsi Lengkap: <https://lib.ui.ac.id/detail?id=20520716&lokasi=lokal>

Abstrak

Lidokain hidroklorida (LiH) merupakan agen anestesi lokal tipe amida yang umum digunakan pada prosedur dermatologi. LiH dikategorikan sebagai BCS (biopharmaceutics classification system) kelas III, yakni memiliki kelarutan yang tinggi dan permeabilitas yang buruk. Tujuan dari penelitian ini adalah memformulasikan dan mengevaluasi sediaan dissolving microneedles (DMN) yang mengandung LiH dengan basis polimer berbeda, yaitu poli(vinil pirolidon) K30 (PVP-K30) dan asam hialuronat (AH), serta melakukan uji pelepasan obat secara *in vitro* dan *in vivo*. Evaluasi sediaan yang dilakukan adalah evaluasi fisik, karakterisasi kehilangan massa setelah pengeringan, karakteristik mekanis, simulasi penetrasi ke dalam kulit, pelarutan jarum dalam kulit, penetapan bobot teoritis, penetapan kadar menggunakan kromatografi cair kinerja tinggi, dan stabilitas kimia. Kemudian, dipilih satu formula terbaik dari masing-masing kelompok polimer yang dilanjutkan dengan uji pelepasan obat secara *in vitro* menggunakan sel difusi Franz dan uji permeasi secara *in vivo* menggunakan tikus galur Sprague-Dawley. Formula terpilih berdasarkan evaluasi sediaan adalah F3 (AH 10%) dan F5 (PVP-K30 25%). Berdasarkan uji pelepasan obat secara *in vitro*, jumlah obat terpermeasi dan terdeposisi di dalam kulit pada F3 adalah $247,1 \pm 41,85$ dan $98,35 \pm 12,86$ μg . Sedangkan, jumlah obat terpermeasi dan terdeposisi di dalam kulit pada F5 adalah $277,7 \pm 55,88$ μg dan $59,46 \pm 9,25$ μg . Berdasarkan uji permeasi obat secara *in vivo*, hanya satu tikus dari kelompok polimer PVP-K30 dengan konsentrasi 150,32 ng/mL terdeteksi pada plasma tikus. Oleh karena itu, LiH dapat diformulasikan ke dalam sediaan DMN dan mampu terdeposisi ke dalam kulit dengan kadar terpermeasi obat ke dalam sirkulasi sistemik yang masih tergolong aman.

.....Lidocaine hydrochloride (LiH) is an amide-type local anesthetic agent commonly used in dermatological procedures. LiH is categorized as BCS (biopharmaceutical classification system) class III, which has high solubility and poor permeability. This study aimed to formulate and evaluate lidocaine hydrochloride-loaded dissolving microneedles (LiH-DMN) with different polymers bases, namely poly(vinyl pyrrolidone) K30 (PVP-K30) and hyaluronic acid (HA), as well as conducting drug release test *in vitro* and *in vivo*. The evaluations consist of physical evaluation, characterization of loss on drying, mechanical strength characteristics, penetration into the skin, in-skin dissolution, determination of theoretical drug content, determination of drug content using high performance liquid chromatography, and chemical stability. Furthermore, the best formula was selected from each polymer group, followed by *in vitro* drug release using Franz diffusion cells and *in vivo* permeation test using Sprague-Dawley rats. The formulas selected based on the evaluation were F3 (HA 10%) and F5 (PVP-K30 25%). Based on the *in vitro* study, the amount of drug permeated and deposited in the skin at F3 was 247.1 ± 41.85 and 98.35 ± 12.86 μg , respectively. Meanwhile, the amount of drug permeated and deposited in the skin at F5 was 277.7 ± 55.88 and 59.46 ± 9.25 μg . *In vivo* drug permeation study showed that only one rat from PVP-K30 polymer group with a concentration of 150.32 ng/mL was detected on rat plasma. Therefore, LiH can be formulated into DMN and

able to be deposited in the skin with a safe concentration of drug permeated into the systemic circulation.