

21



220788 DE INVENCION

O. Nr. 21.151.

MALA REPRODUCCION
POR DEFECTO DEL ORIGINAL

220788

MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

"Procedimiento de preparación de tabletas compactas e impermeables al aire".

===

Solicitantes : E. & O. COLLET & Co. A/S, entidad noruega,
residente en Sandakerveien 109, B. OSLO,
Noruega.

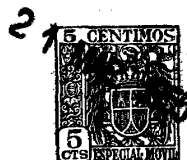
====

Las tabletas comprimidas se preparan generalmente de acuerdo con métodos conocidos, comprimiendo en una máquina corriente, para obtenerlas, un granulado constituido por una mezcla pulverizada que se prepara a su vez de tal modo que resbala o se mueve fácilmente y contiene, además de los materiales básicos adecuados tal, por ejemplo almidón o fécula, azúcar y similares, aglutinantes apropiados tales como goma arábica, gelatina y compuestos análogos y, en algunos casos, sustancias lubricantes tal como, por ejemplo, talco y, finalmente las sustancias activas. El



220788

- granulado se prepara generalmente de acuerdo con dos procedimientos distintos, bien por la llamada, granulación en seco, comprimiendo los componentes pulverulentos para formar unidades relativamente grandes, que luego
15. se muelen o desintegran en forma de granulados por medio de un molino conveniente, o por la llamada granulación en húmedo, mojando los componentes con una solución de gelatina, por ejemplo, después de lo cual esta masa se comprime a través de un tamiz para formar una masa
20. no-coherente, que luego se seca. Este granulado preparado de acuerdo con cualquiera de estos dos métodos, se comprime luego para formar las tabletas. Estas tendrán un aspecto mas o menos homogéneo y no son transparentes. Presentarán una fractura pulverulenta o amorfa y se aplastan fácilmente.
25. Pueden revestirse con sustancias azucaradas con objeto de evitar el sabor de la tableta y de facilitar la deglución. Este tipo de fabricación de tabletas se usa especialmente en la industria de productos farmacéuticos y a veces se emplea también en la fabricación de bombones.
30. Otro tipo de tabletas que pueden caracterizarse mejor como bombones o confites, se preparan partiendo de una masa deshidratada de mono- y di-sacaridos, que a temperaturas de 50°C. y superiores es líquida o plástica. Esta masa puede dividirse en pedazos convenientes, de dos
35. modos distintos. Un método consiste en hacer pasar la masa plástica y todavía caliente a través de dos rodillos grabados y rotativos, para formar una cinta en la que el grabado ha moldeado las tabletas unidas entre sí por una delgada película, cinta que después de enfriarse puede
40. cortarse o separarse, soltando las tabletas separadas.



2
220788

- Estas tabletas serán transparentes y generalmente tienen un aspecto homogéneo y una fractura vítrea u homogénea. El otro método, consiste en transformar, en máquinas especiales la masa plástica en una varilla, que por
45. medio de pistones o medios análogos convenientes se corta y se transforma en tabletas o bombones. En cuanto se refiere al aspecto y a las propiedades, las tabletas preparadas de acuerdo con los dos métodos anteriores, serán análogas. Este tipo de fabricación de tabletas o
50. bombones se emplea especialmente en la industria de bombonería.

- Los métodos antes descritos para la preparación de tabletas comprimidas partiendo de un granulado, se distinguen porque el producto constituye tabletas de forma
55. y peso exactamente idénticos, dado que la maquinaria empleada se ajusta fácilmente y, una vez ajustada para un tipo determinado de granulado, puede hacerse funcionar sin cambio alguno. La mayor parte de las sustancias se adaptan bien a la fabricación de tabletas de acuerdo con
60. estos métodos. Sin embargo, esto no ocurre con las sustancias fácilmente oxidadas, tal como los aceites etéreos y similares, dado que las tabletas preparadas de este modo no obtienen una textura suficientemente compacta.

- El otro procedimiento antes descrito para la
65. preparación de tabletas transparentes, se distinguen porque pueden incorporarse sustancias oxidables por el aire, por ejemplo, aceites etéreos y similares, que permanecen estables dado que la masa, después de endurecerse será impenetrable para el aire y protegerá completamente
70. estas sustancias. Por el contrario, este procedimiento no



220788

es adecuado para las tabletas destinadas a fines farmacéuticos, ya que fabricadas de acuerdo con el método del rodillo grabado, reciben fácilmente una forma asimétrica y poco satisfactoria. El método basado en el corte de una varilla, proporcionará con facilidad tabletas de

75. distintos pesos, y además las tabletas que pesan menos de 1000 mg. son de fabricación difícil.

Este invento combina las ventajas de los dos métodos antes mencionados, Las tabletas se preparan comprimiendo un granulado o un polvo, sólido a la

80. temperatura ordinaria pero que funde o se aglutina entre si para formar una masa compacta, a temperatura algo superior, por ejemplo, por encima de unos 40°C. Esta masa puede por ejemplo, estar constituida por completo o parcialmente por mono-, di- y poli-sacáridos,

85. polialcoholes similares al azúcar tales como el sorbitol, el manitol y eventualmente, además, por adiciones de gelatina o goma arábica, y puede prepararse mezclando los componentes mencionados y calentando la mezcla,

90. por cuyo medio el agua puede eliminarse eventualmente por evaporación. La masa se enfría luego a la temperatura ambiente con lo cual forma una masa dura, transparente u homogénea, impermeable al aire. Durante una cierta etapa del proceso de enfriamiento, mientras la masa está

95. todavía caliente y conserva todavía la plasticidad, pueden incorporarse, por agitación, ingredientes terapéuticos u otros que se deseen, por ejemplo, aceites etéreos, extractos o componentes pulverulentos que se dispersan finamente en la masa. Esta, endurecida a la temperatura

100. ambiente, se muele hasta constituir un polvo basto que



220788

- puede considerarse como un granulado y que luego se comprime en forma de tabletas, con preferencia en una máquina corriente para obtenerlas. Después de comprimir- las, las tabletas son opacas y se parecen a las tabletas
105. corrientes obtenidas de una masa molida. Dado que las partículas individuales solo se han comprimido mecánicamente entre sí, el aire puede penetrar al interior de la tableta a través de las fisuras. Sin embargo, a causa de la composición especial del granulado, estas
110. tabletas pueden calentarse luego y se fundirán o aglutinarán entre sí las partículas constitutivas para formar una masa compacta y adquirir aproximadamente la misma consistencia y aspecto que la masa primitiva tenía antes de desmenuzarse para transformarla en polvo, sin
115. que se altere la forma de las tabletas. El grado de calefacción debe limitarse antes del punto en que las tabletas se deforman. La calefacción, sin embargo, puede realizarse a temperaturas superiores, si las tabletas antes y/o después de aglutinarse se revisten total o parcialmente,
120. dado que en este caso será inferior el riesgo de deformación. El revestimiento puede incluso impedir la deformación de las tabletas revestidas e incluso si la calefacción se realiza hasta un punto tal que la masa de la tableta se funda y adopte la forma líquida en el interior
125. del revestimiento.

Los ejemplos siguientes aclaran el procedimiento.

EJEMPLO 1.

Se calentaron a 145°C. con objeto de eliminar agua,

21 MAR
220788
5
SECRETARÍA DE SALUD

- 130. 300 gramos de jarabe de glucosa
- 700 " " azúcar granulado
- 100 " " agua

Después de enfriarse la masa a 90°C. se incorporan, por agitación 25 g. de aceite cítrico y 25 g. de ácido cítrico

- 135. pulverizado. A continuación se enfría la masa a 20°C., se mueve en un molino para transformarla en polvo basto y se comprime en tabletas de 500 mg. que luego se colocan en una bandeja y se introducen en una estufa calentándolas, a 55°C. durante una hora. Las tabletas al cabo de este

- 140. tiempo se habrán aglomerado, fundido o prácticamente fundido, formando una masa compacta impermeable y coherente, que mantendrá el aceite cítrico completamente confinado en toda la tableta y protegido del todo contra la acción del aire.

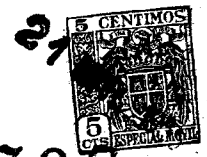
145. EJEMPLO 2.

La preparación del polvo basto y la fabricación de las tabletas, igual que en el ejemplo 1. Las tabletas se revisten con un jarabe de azúcar al 55% y una mezcla de 30% de azúcar pulverizado, 10% de talco y 10% de fécula

- 150. o almidón, hasta que el peso de la tableta revestida llega a 500 mg. A continuación se lleva a cabo la calefacción colocando las tabletas revestidas, durante 10 horas, en una estufa a 70°C.

N O T A

- 155. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.



220788

160. También se hace constar que el invento corresponde a una Patente presentada en Noruega con fecha 25 de Marzo de 1954, bajo el nº 112379, acogiendo por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, y siendo lo que constituye la esencia del referido

165. invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España: "Procedimiento de preparación de tabletas compactas e impermeables al aire"; caracterizándose por lo siguiente:

170. 1ª.- Procedimiento de preparación de tabletas compactas e impermeables al aire, caracterizado porque un polvo constituido por una masa básica, sólida a la temperatura ambiente pero que funde a temperatura algo superior, de unos 40°C. y más elevada, en cuya masa se dispersan las sustancias activas deseadas, por ejemplo
175. medicinas, colores, sustancias aromatizantes o similares, se comprime en forma de tabletas, y las tabletas así obtenidas se calientan a una temperatura en la que se aglutinan o funden, para transformarse en compactas sin perder su forma exterior.

180. 2ª.- Procedimiento, según lo especificado en la reivindicación 1ª, caracterizado porque las tabletas antes y/o después de aglutinarse, se revisten, de un modo en esencia conocido, por ejemplo, con azúcar .

185. 3ª.- Procedimiento, según lo especificado en la reivindicación 2ª, caracterizado porque la calefacción se verifica a una temperatura suficientemente elevada para que la masa encerrada en el interior del revestimiento se transforme total o parcialmente, al estado líquido.



220788

4º.- Procedimiento de preparación de tabletas compactas e impermeables al aire; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria que consta de ocho hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

21 MAR. 1955

E. & O. COLLET & Co. A/S.

J. GÓMEZ ACEBO Y MODET
F.F.