

256018

P.- 19.363

US. Serial No 795.916



256018

MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar

P A T E N T E D E I N V E N C I O N

e n

E S P A Ñ A

por VEINTE años

a nombre de OLIV MATHELSON CHEMICAL CORPORATION, entidad norteamericana, establecida en 460 Park Avenue, Nueva York, N. Y., Estados Unidos de América, por:

"MEJORAS INTRODUCIDAS EN LA PREPARACION DE TABLETAS REVESTIDAS".

=====

Este invento se refiere a nuevas tabletas provistas de recubrimiento y mas específicamente a tabletas que posean un nuevo tipo de película (o capa) de recubrimiento sobre las mismas.

5

Es conocido en la práctica de la fabricación de tabletas el proporcionar una capa de recubrimiento sobre tabletas revestidas o sin revestir. En el caso de tabletas -

256018



5 sin revestir, la capa de recubrimiento actúa protegiendo la tableta de la disolución en la boca evitando con ello las sensaciones desagradables de sabor que normalmente van unidas a las medicaciones por vía oral, sin retrasar materialmente la desintegración de la tableta una vez que pasa la región bucal. En el caso de una tableta revestida, la película o capa de recubrimiento actúa protegiendo la tableta de los efectos de la humedad sin retrasar apreciablemente su desintegración y además proporciona una base que es susceptible simultáneamente del desarrollo de un brillo elevado y se adhiere asimismo a cualquier marca de identificación que se imprima en la misma.

10 Hasta ahora, la práctica ordinaria en esta técnica ha sido utilizar como capa de recubrimiento goma laca simple o modificada. Aunque la goma laca posee alguna de las propiedades, como la resistencia a la penetración por la humedad, no satisface totalmente las condiciones de una capa ideal de recubrimiento. Así, la goma laca tiene tendencia a volverse pegajosa y esto da lugar a la aglomeración y la pérdida de elegancia de la tableta individual. Por otra parte, la goma laca no actúa como base estable para las indicaciones que normalmente se imprimen en las tabletas para identificarlas en cuanto a su origen y contenido. Por otra parte, debido a su pegajosidad, la goma laca hace que el manejo de las tabletas sea más difícil aumentando así los costes de producción por tableta.

25 El objeto de este invento es proporcionar una nueva tableta revestida que contenga una capa de recubrimiento que posee todas las ventajas de estabilidad, facilidad de aplicación, adherencia para la impresión y capacidad de re-



256018

cibir un brillo elevado.

El objeto anterior y otros se consiguen, de acuerdo con este invento, mediante una tableta que contenga una película de recubrimiento que comprenda polímeros resinosos de terpenos, que tengan un punto de fusión en el intervalo de temperatura de 70° C a 135° C. El recubrimiento es aplicable a cualquier tableta que sea aceptable y útil farmacéuticamente. Las tabletas así recubiertas poseen todas las ventajas citadas anteriormente.

El recubrimiento puede aplicarse con facilidad a tabletas revestidas y sin revestir, utilizando las instalaciones ordinarias para el recubrimiento de tabletas. Así, si se desea, puede utilizarse una cubeta rotatoria de recubrimiento, en cuyo caso las tabletas se depositan primeramente en él y se ponen en contacto con una solución de la resina de recubrimiento. Para disolver la resina pueden utilizarse cualquiera de los disolventes derivados del petróleo, de bajo coste, disolventes del alquitrán de hulla, aceite mineral, hidrocarburos clorados, alcoholes de cadena larga y cetonas de cadena larga. La concentración de resina puede hallarse en el intervalo de 5-30% en peso del disolvente. La cubeta se cubre durante un breve período de tiempo con objeto de permitir que la resina entre en contacto con las tabletas antes de que se evapore el disolvente. Puede aplicarse una corriente de aire caliente a las tabletas en movimiento. Después de dejarlas un tiempo suficiente, se retira la tapa para permitir que el disolvente se evapore. En este momento se puede hacer pasar una corriente de aire ligeramente caliente sobre las tabletas con objeto de acelerar la evaporación. Una vez secas, las tabletas están

256018



en condiciones de ser impresas, pulimentadas o envasadas. Las tabletas así formadas son estables a la humedad, se imprimen y pulimentan con facilidad y están completamente exentas de pegajosidad.

5 En una forma preferida de realización de este invento, se utiliza para formar la capa de recubrimiento una resina compuesta esencialmente de polimeros de beta-pineno, que tengan un punto de fusión en el intervalo de 85° C a 125°C. Como disolvente de la resina puede utilizarse un hidrocarburo clorado, como los cloroalcanos y de preferencia 1,1, 10 1-tricloroetano. La solución de resina se prepara disolviendo un 5 a 25% aproximadamente de la resina en el disolvente que se desee. Si se desea disminuir la penetración de la resina en el núcleo de la tableta, la viscosidad de la 15 solución de resina puede ajustarse mediante la incorporación de un espesador. Entre los espesadores que pueden utilizarse se hallan los materiales celulósicos, como los ésteres celulósicos, y un espesador preferido es la etil-celulosa. El espesador puede añadirse hasta un 100% y de preferencia 20 un 20% en peso de la resina en la solución de la resina, o también puede añadirse la solución de resina a una solución de etil-celulosa.

 Además debe hacerse observar que el espesador posee 25 ventajosamente características como formador de películas, por sí mismo, aumentando así la resistencia a la humedad de la tableta recubierta. Además, puede añadirse al recubrimiento resinoso una pequeña cantidad de un colorante, si se prefiere tener una tableta coloreada. Es apropiado cualquier colorante no tóxico, compatible. Puede emplearse un colorante 30 como el amarillo de quinoleína. El colorante puede utilizar-

256048



se en suspensión o en una solución del recubrimiento de resina.

El material de recubrimiento se aplica a continuación a las tabletas. Pueden utilizarse los procedimientos usuales, como por ejemplo el método de recubrimiento en cubeta descrito aquí anteriormente. En el caso en que se desee un brillo elevado, las tabletas después de ser recubiertas de una capa pueden seguir rotando durante más tiempo, solas o en presencia de talco pulverizado consiguiéndose el pulimento deseado por la acción abrasiva.

Los ejemplos que siguen se presentan con objeto de ilustrar el invento debiendo entenderse específicamente que se presentan como ilustración y no como limitación.

EJEMPLO I

Cinco miligramos de tabletas revestidas de azúcar No. 3, preparadas por los métodos usuales de revestimiento, se colocan en un tambor de recubrimiento que se pone en marcha a continuación. A las tabletas en rodamiento se les añaden aproximadamente 20 ml. de una solución al 10% de una resina compuesta de polímeros de pineno, que tenían un punto de fusión de 85° C. aproximadamente (Piccolyte S-115) en 1,1,1-tricloroetano. La boca de la cubeta de recubrimiento se cubre inmediatamente durante un minuto. Se abre la tapa y las tabletas revestidas se hacen rodar hasta que desaparece la "pegajosidad" y el peligro de adherirse o aglomerarse -- unas con otras. En este momento se aplica aire frío. Cuando las tabletas se hallan exentas de pegajosidad se apartan y se colocan en bandejas en una estufa de aire caliente en circulación aproximadamente a 40° C hasta que se ha elimina-

256018



do todo el disolvente. Las tabletas se pulimentan a continuación colocándolas en un tambor de recubrimiento encerrado (la capa de cera consta de una parte en peso de cera -- carnauba y tres partes en peso de cera de abejas) dejando
5 que rueden las tabletas hasta que se alcance un brillo apropiado. Una aplicación adecuada de aire caliente a las tabletas en movimiento contribuye a la absorción de la cera y facilita el pulimento.

Las tabletas pueden imprimirse a continuación utilizando una máquina adecuada diseñada para este fin y después
10 pueden volver a pulimentarse según se describió anteriormente. Antes del pulimento puede aplicarse sobre la impresión un segundo recubrimiento de resina.

EJEMPLO II

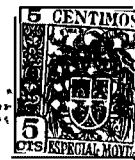
15 Las soluciones son las mismas que en el ejemplo I, excepto que se utiliza una solución al 20% de la resina.

Tres kilogramos de tabletas del No. 3 se liberan cuidadosamente de polvo y se colocan en una cubeta de recubrimiento de 40 cm. que se pone en movimiento a continuación.
20 Se añade suficiente solución de resina para cubrir uniformemente las tabletas. La cubeta se cubre momentáneamente -- hasta que la solución se atribuye uniformemente. Se aparta la tapa, se aplica aire frío y se dejan rodar las tabletas
25 hasta que desaparece la pegajosidad. Las tabletas se apartan de la cubeta y se distribuyen uniformemente en bandejas en una zona convenientemente ventilada hasta que se han eliminado todas las trazas de disolvente.

EJEMPLO III

30 Se preparan 55 ml. de una disolución de 2-1/2% de etil-

256018



5 celulosa y 0,05% de amarillo de quinoleína, utilizando como disolvente 1,1,1-tricloroetano, 55 ml. de una solución al 15% de una resina de β -pineno (p.f. 85° C) en el mismo disolvente se mezclan con la solución de etilcelulosa por medio del calor y a continuación se enfría a temperatura ambiente. La mezcla se aplica a las tabletas a temperatura ambiente en la forma que sigue:

10 3 kg. de tabletas de cloruro sódico del No. 2 se colocan en una cubeta de recubrimiento de 40 cm; Se añade una cantidad suficiente de solución resina-etilcelulosa para cubrir completamente las tabletas (110 ml.). Tan pronto como las tabletas se hallan rodando libremente, se aplica aire hasta que las tabletas estén completamente secas y libres de olor a disolvente. Se apartan muestras y se ensaya la desintegración el tiempo medio de desintegración en agua destilada a 37° C. es de unos 3 minutos). Se aplica a continuación un segundo recubrimiento (unos 60 ml.) y se prosigue el secado. El tiempo medio de desintegración después de dos recubrimientos es de unos 4 minutos.

20 Las tabletas poseen un recubrimiento liso, uniforme, y un aspecto brillante y cumplen las exigencias de una tableta aceptable provista de película.

EJEMPLO IV

25 5 kg. de tabletas minerales de vitamina usuales se recubren de azúcar de la manera usual. Después de secar lentamente el jarabe final de recubrimiento para disminuir al mínimo la cristalización del azúcar, se añaden a las tabletas en rodamiento 50 ml. de una disolución al 10% del polímero resinoso de beta-pineno (p.f. 85). Las tabletas se se-

30

256018



can mediante la aplicación de aire frío hasta que han desaparecido todos los restos de olor a disolvente. El pulimento de las tabletas se consigue dejando que las tabletas --
rueden en una cubeta rotatoria recubierta de cera, estando
5 cubierta con un capa de una mezcla 3:1 de cera de abejas y
cera carnauba. Las tabletas se imprimen a continuación con
las deseadas utilizando un aparato de imprimir de Hartnelt.
La película admite con facilidad la tinta.

Las tabletas impresas son superiores a las correspondientes tabletas que se abrillantaron con goma arábiga de
10 calidad farmacéutica y que se imprimieron a continuación. La
superioridad se hace patente por una mayor claridad del dibujo de las indicaciones y la ausencia de suluciones de continuidad en las mismas.

Esta solicitud que corresponde a la presentada en -
15 E.U.A., el 27 de Febrero de 1.959, bajo el Número 795.916,
se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

20 - N O T A -

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de In
vención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

25 1º. - Mejoras introducidas en la preparación de tabletas revestidas según las cuales el revestimiento comprende una película de una resina de polímeros terpénicos que funde por encima de 70 a 135º C.

30 2º. - Mejoras según el punto 1º, según las cuales la película se deposita sobre una tableta revestida.

256018 256018



3º. - Mejoras según el punto 1º, según las cuales la película se deposita sobre una tableta sin revestir.

4º. - Mejoras según el punto 1º, según las cuales el terpeno consiste esencialmente en beta pinenos.

5 5º. - Mejoras según el punto 4º, según las cuales el recubrimiento pelicular contiene adicionalmente una cantidad secundaria de ésteres celulósicos.

10 6º. - Mejoras según el punto 5º, según las cuales el recubrimiento pelicular contiene una cantidad secundaria de un colorante inocuo compatible.

7º. - Mejoras según se reivindican en los puntos anteriores, según las cuales las tabletas se ponen en contacto íntimo con una solución que comprende una resina de polímeros terpénicos que funde por encima de 70º C.

15 8º. - Mejoras introducidas en la preparación de tabletas revestidas.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede, y con los fines que se han especificado.

20 Esta Memoria consta de nueve hojas escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, 18

F. J.

1137

HIG. 12