



279162

279162

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

a favor de:

ALTER, S.A., de nacionalidad española, residente en Madrid, calle de Mateo Inurria, 30, por:

"PROCEDIMIENTO DE OBTENCIÓN DE FORMAS FARMACEUTICAS SOLIDAS DE ACCION SOSTENIDA".

- - - - -

Memoria descriptiva

El objeto de esta patente es la obtención de formas farmacéu-
ticas sólidas de diversos medicamentos (antihistamínicos, simpato-
miméticos, tranquilizantes, hipoglucemiantes, etc.) con la carac-
terística de que dicho medicamento se cede lentamente después de
5 la ingestión y se consigue mantener un nivel terapéutico durante
10-12 horas.

Las ventajas que se alcanzan con este tipo de medicación son
fácilmente apreciables, tales como reducir las tomas, no tener que
interrumpir el sueño para administrar el medicamento, etc. Además
10 desde el punto de vista clínico se obtienen ventajas como alcanzar

279162



en el organismo un nivel más constante del medicamento sin las diferencias que aparecen al administrar repetidamente dosis únicas, la consecución de efectos clínicos con dosis inferiores, etc.

15 Para ello se ha utilizado una metódica consistente en recubrir gránulos del medicamento en cuestión con una mezcla de una grasa sólida, no tóxica y de un derivado celulósico sólido no tóxico. Este recubrimiento va desapareciendo paulatinamente a lo largo del tracto gastrointestinal con lo que tiene lugar una cesión continua del medicamento que contengan.

20 Para mayor explicación de este procedimiento para el que se solicita la presente patente de invención, se detallan a continuación los siguientes ejemplos:

Ejemplo 1

25 Se prepara por granulación seca un granulado de clorhidrato de N' - β -feniletibiguanidina con tamaño de gránulo entre los tamaños 20 y 30 con 12,5 % del producto activo.

30 Este granulado puede prepararse también recubriendo pequeños gránulos de azúcar o cualquier excipiente inerte con un jarabe que lleva incorporado el clorhidrato de N' - β -feniletibiguanidina. 10 Kg del granulado se colocan en una paila giratoria y se les añaden de manera continua 2,75 litros de una solución clorofórmica de aceite de ricino hidrogenado (8%) y etilcelulosa de 20 c.p.s. (2%). Después de la adición se secan con aire frío y se reparten los gránulos en cápsulas de gelatina a 50 mg de clorhidrato de N' - β -feniletibiguanidina por cápsula.

35 A la media hora de la ingestión de una cápsula se ha conseguido el nivel deseado de principio activo el cual se mantiene durante 10-12 horas.

Ejemplo 2

40 Se prepara por el mismo procedimiento del ejemplo anterior, un



279182

granulado que contenga el 10% de maleato de 2-(2-(2-dimetilaminoetil) benzil)piridina.

9 Kg del granulado se recubren con 2,7 litros de la misma solución que la utilizada en el ejemplo citado.

45 Se secan los gránulos con aire y se mezclan íntimamente con 1 Kg de granulado sin recubrir y se reparten en cápsulas de gelatina a 20 mg del principio activo por cápsula.

A la media hora de la ingestión de la cápsula se ha conseguido el nivel deseado, el cual se mantiene durante 10-12 horas.

50 Descrita la naturaleza y objeto de esta solicitud se declara que los puntos cuya protección se solicita por veinte años en España están comprendidos en las siguientes:

REIVINDICACIONES

- 55 1). Procedimiento para la obtención de formas farmacéuticas sólidas de cesión retardada caracterizado por el hecho de que el medicamento va en forma de gránulos obtenidos por granulación seca o por recubrimiento con dicho medicamento de núcleos de azúcar o de cualquier otro excipiente inerte.
- 60 2). Procedimiento según la reivindicación 1), caracterizado por que dichos gránulos se recubren con una mezcla de aceite de ricino hidrogenado y un derivado de la celulosa insoluble en agua pero dispersable tal como etilcelulosa y acetilbutirato de celulosa.
- 65 3). Procedimiento según las reivindicaciones 1) y 2), caracterizado por el hecho de que los gránulos ya preparados se pueden dispensar en una cápsula de gelatina.
- 70 4). Procedimiento según las reivindicaciones 1), 2) y 3), caracterizado por el hecho de que los gránulos contenidos en una cápsula pueden tener todos el mismo recubrimiento, ser una mezcla de gránulos con recubrimientos de distinto espesor o bien de gránulo-



los sin recubrir y recubiertos.

279162

5). PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE FORMAS FARMACEUTICAS SOLIDAS DE ACCION SOSTENIDA.

Esta Memoria consta de cuatro hojas foliadas y mecanografiadas por un solo lado de sus caras.

75

Madrid, 12 de Julio de 1962

aw