

Industria y Comercio
SUPERINTENDE.



00 88901

**SOLICITUD
PATENTE DE
INVENCION**

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación 00000901 00000000 Folios 33
Fecha (Año): 2020-11-22 16:02:19
Trámite: 002 PATENTES D 1 REGISTRADO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social BIOCHEMIE GmbH
No. de Identificación _____
Representante Legal (Persona Jurídica) _____
País de Domicilio AUSTRIA
Departamento o Estado _____
Dirección _____
Ciudad KUNDL Teléfono _____

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre JIMENA ESCOBAR URIBE
Dirección y Domicilio CRA. 11A No. 84-78. OFICINA 305
Ciudad SANTAFÉ DE BOGOTÁ Teléfono 6162951/61

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es) 1. REINHARD ENTNER; 2. HERWIG JENNEWEL
Identificación _____
Dirección 1. BREITENBACH, AUSTRIA. 2. ARSAM, AUSTRIA.
Ciudad _____
Teléfono _____

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(34) Título de la Invención PROCESO PARA EL RECUBRIMIENTO DE NÚCLEOS DE TABLETAS, TABLETA DISPENSABLE
Y MEZCLA DE RECUBRIMIENTO PARA LA PRODUCCIÓN DE LA MISMA.

PRIORIDAD REIVINDICADA. sí ☒ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD: ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País AUSTRIA Fecha NOVIEMBRE 23, 1992 (31) No. Solicitud 1298/92

Para publicar a los ☒ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL A61K 9/30

23247

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

Proveer un proceso para el recubrimiento de núcleos de tabletas, comprendiendo este núcleo de tableta una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, el cual comprende rociar una solución o suspensión de recubrimiento que comprende un azúcar, o un almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, sobre las tabletas o los núcleos de tabletas, con la condición de que se excluyan agentes formadores de película en la solución o suspensión de recubrimiento, para obtener tabletas recubiertas, tales como tabletas recubiertas y las mezclas de recubrimiento correspondientes.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica No 18 377	☒
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC No 18.377	☒
Recibo de la tasa respectiva No 68, 107	☒
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	☐
Si se reivindica prioridad Andina.	
Copia de la primera solicitud	☐
Traducción oficial	☐
Si se reivindica prioridad Unionista.	
Copia certificada de la primera solicitud	☐
Nota. Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción simple	☐
Capítulo descriptivo	☒
Dibujos planos necesarios	☐
Capítulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propiedad según formato	☒
Tarjeta archivo temático según formato	☒
Extracto para publicación según formato	☒
Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms	☐
Otros documentos	☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA
NOMBRE


JONENA ESCOBAR URIBE

C.C. 39.779.452 Usaquén.

T.P. No. 68.228

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion 03000901 00000000 Folios 33
Fecha (AMD): 2000-11-22 16 02:19
Tramite C02 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA 68,107
FECHA : OCTUBRE 31 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No PAGO	Vr PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2044972	4 119 000 00

***** C O N C E P T O *****

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL DE PATENTE DE IN	608 000 00
		TOTAL	\$ 608 000 00

SOM SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No _____



OK

RECUBRIMIENTO

La presente invención se refiere a un recubrimiento, por ejemplo al recubrimiento de tabletas/nucleos de tabletas farmacéuticas

Las formas de dosificación farmacéutica para aplicación oral de un compuestos farmacéuticamente activo incluyen tabletas. Para la administración de un compuestos farmacéuticamente activo en forma de tableta, con frecuencia es necesario enmascarar un sabor desagradable, por ejemplo amargo, de un compuesto farmacéuticamente activo. Una posibilidad para enmascarar el sabor es el recubrimiento de película, con una película que sea soluble en los jugos gástricos, mediante la utilización de agentes formadores de película, lo cual da como resultado tabletas recubiertas con película

Los agentes formadores de película comunmente son polímeros que forman un cubrimiento continuo, elástico, y uniforme, por ejemplo como una piel, alrededor del nucleo de tableta, que cuando menos se puede separar parcialmente como una capa continua. Sin embargo, esta película en una tableta recubierta con película, puede proporcionar una barrera considerable a la penetración de los fluidos acuosos hacia adentro de los nucleos de la tableta, el cual es un requisito prevrô para la desintegración del nucleo de la tableta y la liberación de, por ejemplo, cantidades suficientes del compuestos farmacéuticamente

activo La liberación insuficiente del compuesto farmacéuticamente activo puede crear problemas, por ejemplo, tales como los descritos para las tabletas recubiertas con película que comprenden cefuroxima-axetil como un compuesto farmacéuticamente activo, de donde se sabe que se tiene que aplicar una capa muy delgada de un recubrimiento de película para asegurar una liberación suficiente Es difícil examinar y controlar estas capas tan delgadas, y se tienen que proporcionar métodos de prueba especiales y complejos, pero no específicos (por ejemplo, prueba de explosión de película) No se pueden excluir los espesores de película variables en diferentes tabletas recubiertas con película dentro del mismo lote, y no se puede garantizar el mismo comportamiento de liberación de cefuroxima-axetil a partir de diferentes tabletas recubiertas con película que comprendan cefuroxima-axetil para cada tableta, inclusive cuando se originen del mismo lote de producción

De una manera sorprendente, ahora hemos encontrado un proceso en donde se puede recubrir un núcleo de tableta que comprenda un compuesto farmacéuticamente activo sin el uso de agentes formadores de película, mientras que se logra un enmascaramiento satisfactorio de sabor, y se evita el efecto negativo de un recubrimiento de película sobre la liberación del compuesto farmacéuticamente activo, y que proporciona una tableta recubierta que se puede administrar directamente sin otro tratamiento De acuerdo con la presente invención, no se necesita

un recubrimiento delgado y complejo, debido a que el recubrimiento de acuerdo con la presente invención no proporciona una barrera considerable a la penetración de los fluidos acuosos hacia adentro de los núcleos de tabletas, y por lo tanto, no
5 afecta ni impide la desintegración del núcleo de tableta

En un aspecto, la presente invención proporciona un proceso para el recubrimiento de núcleos de tabletas, por ejemplo incluyendo un núcleo de tableta normal y un núcleo de tableta dispersable, comprendiendo el núcleo de tableta una cantidad
10 efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, por ejemplo, un compuesto farmacéuticamente activo que tenga un sabor desagradable, por ejemplo amargo, por ejemplo un compuesto farmacéuticamente activo seleccionado a partir de antibióticos, tales como penicilinas, por ejemplo amoxicilina, por ejemplo
15 amoxicilina sola o en combinación con ácido clavulánico, cefalosporinas, por ejemplo cefuroxima-axetil, macrólidos, tales como eritromicinas, antimigrañas, por ejemplo sumatriptano, o antipsicóticos, por ejemplo olanzapina, el cual comprende rociar una solución o suspensión de recubrimiento que comprende
20 un azúcar, por ejemplo, incluyendo azúcares, alcoholes de azúcar, o un almidón, por ejemplo incluyendo productos de almidón e hidrolizados de almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, sobre los núcleos de tabletas, con la condición de que se excluyan los agentes formadores de película en la suspensión o
25 en la solución para obtener tabletas recubiertas, por ejemplo,

que estén listas para administrarse sin un tratamiento adicional

- Un compuesto farmacéuticamente activo de acuerdo con la presente invención incluye toda clase de compuestos farmacéuticamente activo, de preferencia un compuesto que tenga un sabor desagradable, por ejemplo amargo, por ejemplo un compuesto seleccionado a partir de antibióticos, por ejemplo incluyendo
- penicilinas, por ejemplo incluyendo sales y/o solvatos de las mismas, por ejemplo incluyendo amoxicilina, por ejemplo en la forma de un trihidrato, por ejemplo amoxicilina sola o en combinación con ácido clavulánico o sales del mismo, tales como ácido clavulánico en la forma de una sal de potasio, penicilina V, por ejemplo incluyendo derivados terapéuticamente activo, oxacilina, cloxacilina, flucoxacilina, dicloxacilina, ampicilina,
 - cefalosporinas, por ejemplo incluyendo sales y/o solvatos de las mismas, tales como cefaclor, cefixima, cefalexina, cefradina, cefadroxil, cefroxadina, cefdinir, cefpodoxima-proxetil, cefuroxima-axetil,
 - macrólidos, por ejemplo incluyendo sales y/o solvatos de los mismos, por ejemplo incluyendo eritromicinas, tales como eritromicina A, claritromicina, azitromicina, roxitromicina,
 - antimigrañas, por ejemplo incluyendo sales y/o solvatos de los mismos, por ejemplo incluyendo sumatriptano, por ejemplo en la forma de un hemisulfato, succinato, o

- antipsicóticos, por ejemplo incluyendo sales y/o solvatos de los mismo, por ejemplo incluyendo olanzapina, de preferencia cefuroxima-axetil, cefpodoxima-proxetil, amoxicilina, sumatriptano, y olanzapina

5 Se puede utilizar un compuesto farmacéuticamente activo en cualquier modificación sólida conocida, por ejemplo, la cefuroxima-axetil se puede utilizar en una forma amorfa, en una forma cristalina, y en la forma de una solución sólida en un polímero, o de una dispersión sólida sobre un adsorbente, en donde la
10 cefuroxima-axetil no es cristalina ni amorfa, por ejemplo, que se puede obtener removiendo el solvente de una solución o una suspensión de cefuroxima-axetil y un polímero, o un adsorbente, respectivamente

Los antibióticos, antimigrañas, y antipsicóticos, como se
15 describen anteriormente, se dan a conocer, por ejemplo, en The Merck Index, 12ª edición, partidas 7220-7229, 617, 2402, 7230-7232, 7036, 2480, 3134, 628, 1962, 1975, 2021, 2032, 1963, 1993, 1971, 1991, 2002, 3720, 8433, 2400, 946, 9172, 6959

Un núcleo de tableta como se utiliza en la presente se refiere a una tableta no recubierta, que comprende cuando menos
20 un compuesto farmacéuticamente activo Un núcleo de tableta útil de acuerdo con la presente invención puede estar en cualquier forma y configuración geométrica, y se puede obtener de acuerdo con, por ejemplo, y análogamente a, un método convencional
25 Un núcleo de tableta puede comprender, además del com-

puesto farmacéuticamente activo, excipientes farmacéuticamente aceptable, por ejemplo incluyendo excipientes tales como aglutinantes, rellenos, desintegrantes, aceleradores, acondicionadores de flujo, agentes de liberación, lubricantes, agentes humectantes, conservadores, colorantes, azúcar, sustitutos de azúcar, edulcorantes, y agentes saborizantes. Un núcleo de tableta se puede obtener según sea apropiado, por ejemplo, se puede obtener mezclando un compuesto farmacéuticamente activo con excipientes farmacéuticamente aceptables, por ejemplo incluyendo pasos de granulación, por ejemplo granulación húmeda o seca, e igualación (tamizado), y compresión de la mezcla obtenida. Para la producción de núcleos de tabletas, un compuesto farmacéuticamente activo puede estar en cualquier forma, por ejemplo incluyendo formas no granuladas y granuladas, formas extruidas.

Un núcleo de tableta comprende un núcleo de tableta de una tableta normal, y un núcleo de tableta de una tableta dispersable, es decir, una tableta que se desintegre rápidamente. Una tableta dispersable, por ejemplo, se puede utilizar para la producción de una solución o suspensión para beber, o se puede administrar como tal. Las tabletas generalmente dispersables consisten en núcleos de tabletas puros que no están recubiertos, por ejemplo debido a la barrera para la penetración de líquido en el caso del recubrimiento de película, que puede no permitir una desintegración rápida, por ejemplo que comprenda

además en el núcleo de tableta, edulcorantes, azúcares, saborizantes, y otros ingredientes que, por ejemplo, puedan permitir un enmascaramiento de sabor de un compuesto farmacéuticamente activo con un sabor desagradable, por ejemplo amargo

5 La mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención comprende un azúcar, por ejemplo incluyendo uno o más azúcares, un almidón, por ejemplo incluyendo uno o más almidones, o un azúcar y un almidón, incluyendo uno o más azúcares y uno o más almidones. Un azúcar incluye toda clase de azúcares
10 y compuesto que tengan una estructura química derivada a partir de una estructura de azúcar químico, por ejemplo alcoholes de azúcar, tales como sacarosa, lactosa, manitol. Un almidón incluye toda clase de almidones, y compuestos que tengan una estructura química derivada a partir de un almidón, por ejemplo
15 incluyendo almidones modificados, tales como almidón de papa, almidón de maíz, almidones solubles, hidrolizados de almidón, por ejemplo dextrinas, maltodextrina, ciclodextrinas. Una mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención de preferencia comprende un azúcar, por ejemplo uno o más azúcares,
20 res, y un almidón, por ejemplo uno o más almidones. La mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención puede comprender adicionalmente agentes divisores, por ejemplo incluyendo talco, pigmentos, por ejemplo incluyendo óxido de titanio, agentes colorantes, edulcorantes, por ejemplo incluyendo
25 aspartame, agentes saborizantes, agentes humectantes, por ejem-

plo incluyendo Texapon®, ésteres de ácido graso de sorbitán de polioxietileno, por ejemplo incluyendo POLYSORBATE 80®, conservadores y lubricantes, por ejemplo dióxido de silicio, por ejemplo Aerosil®, y agentes antiespumantes, por ejemplo Simeticona USP. Se excluyen los agentes formadores de película.

Una solución o suspensión de recubrimiento de acuerdo con la presente invención se puede obtener de acuerdo con, por ejemplo análogamente a, un método convencional, por ejemplo mezclando una mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención con un líquido que sea apropiado para recubrimiento rociado, por ejemplo incluyendo agua, un solvente orgánico miscible en agua (mezcla), o una mezcla de agua y un solvente orgánico miscible en agua (mezcla). Un solvente orgánico miscible en agua (mezcla) es un solvente (mezcla) apropiado para el recubrimiento rociado, por ejemplo, e incluye un solvente miscible en agua (mezcla) como es convencional.

Los núcleos de tabletas se recubren con la solución o suspensión de la mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención mediante rociado, por ejemplo, como sea apropiado, por ejemplo de acuerdo con, por ejemplo de una manera análoga a, un método convencional, por ejemplo utilizando equipo rociador convencional. La solución o suspensión de la mezcla de recubrimiento se rocía sobre los núcleos de tabletas en una cantidad suficiente para cubrir, por ejemplo, de una manera uniforme, la superficie de los núcleos de tabletas. El espesor

del recubrimiento no es crítico, debido a que el recubrimiento de acuerdo con la presente invención no establece una barrera a la penetración de agua de la tableta recubierta. De preferencia el peso del recubrimiento es el 20 por ciento y menos, más preferiblemente el 10 por ciento y menos, por ejemplo el 5 por ciento y menos, tal como del 0.5 al 20 por ciento, de preferencia del 1 al 15 por ciento, del peso de la tableta recubierta. Se prefiere que la forma o configuración geométrica del núcleo de tableta antes del recubrimiento sea la misma en la tableta recubierta después del recubrimiento. Una tableta recubierta de acuerdo con la presente invención puede tener características de desintegración y características de liberación muy similares del compuesto farmacéuticamente activo que tenga el núcleo de tableta antes del recubrimiento.

En otro aspecto la presente invención proporciona un proceso para el recubrimiento de núcleos de tabletas, por ejemplo incluyendo un núcleo de tableta normal y un núcleo de tableta dispersable, comprendiendo este núcleo de tableta una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, el cual comprende rociar una solución o suspensión de recubrimiento que se origine a partir de una mezcla de recubrimiento que consista en un azúcar, por ejemplo incluyendo azúcares, alcoholes de azúcar, o un almidón, por ejemplo incluyendo productos de almidón e hidrolizados de almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, y opcionalmente de agentes de división,

y/o pigmentos, y/o agentes colorantes, y/o edulcorantes, y/o agentes saborizantes, y/o agentes humectantes, y/o conservadores y/o lubricantes (abrillantadores), y/o agentes antiespumantes, sobre los núcleos de tabletas, para obtener tabletas recubiertas, por ejemplo que estén listas para administrarse sin un tratamiento adicional

La tabletas recubiertas obtenidas de acuerdo con la presente invención son novedosas

En otro aspecto, la presente invención proporciona una tableta recubierta, por ejemplo incluyendo tabletas normales y tabletas dispersables, por ejemplo listas para administrarse sin un tratamiento adicional, la cual comprende una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, recubierto con una mezcla de recubrimiento consistente en un azúcar, por ejemplo incluyendo azúcares, alcoholes de azúcar, o un almidón, por ejemplo incluyendo productos de almidón e hidrolizados de almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, y opcionalmente agentes de división, y/o pigmentos y/o agentes colorantes, y/o edulcorantes, y/o agentes saborizantes, y/o agentes humectantes, y/o conservadores, y/o lubricantes, y/o agentes antiespumantes

Una mezcla de recubrimiento utilizada de acuerdo con la presente invención es novedosa

En otro aspecto, la presente invención proporciona una mezcla de recubrimiento para la producción de tabletas recu-

biertas, por ejemplo incluyendo tabletas normales y tabletas dispersables, por ejemplo listas para administrarse sin un tratamiento adicional, comprendiendo el núcleo de tableta de la tableta recubierta una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, en donde la mezcla de recubrimiento consiste en un azúcar, por ejemplo incluyendo azúcares, alcoholes de azúcar, o un almidón, por ejemplo incluyendo productos de almidón e hidrolizados de almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, y opcionalmente agentes de división, y/o pigmentos, y/o agentes colorantes, y/o edulcorantes, y/o agentes saborizantes, y/o agentes humectantes, y/o conservadores, y/o lubricantes (abrillantadores) y/o agentes antiespumantes

Una tableta dispersable que comprenda un núcleo de tableta que comprenda un compuesto farmacéuticamente activo, y cuyo núcleo de tableta sea recubierto, son novedosos Hemos encontrado que el tiempo de desintegración de un núcleo de tableta dispersable sin un recubrimiento, y del núcleo de tableta correspondiente (idéntico) que esté recubierto con un recubrimiento de acuerdo con la presente invención, es muy similar, por ejemplo prácticamente el mismo

En otro aspecto, la presente invención proporciona una tableta dispersable que comprende un núcleo de tableta que comprende una cantidad efectiva de un compuesto farmacéuticamente activo, en donde el núcleo de tableta está recubierto, por

ejemplo recubierto con una mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención, por ejemplo, y el tiempo de desintegración de la tableta no recubierta es muy similar a aquél de una tableta recubierta correspondiente, por ejemplo, conteniendo ambas tabletas los mismos ingredientes en las mismas cantidades, por ejemplo, siendo el tiempo de desintegración determinado de acuerdo con los métodos convencionales, por ejemplo de acuerdo con un método como se describe en las Farmacopeas para pruebas de desintegración, por ejemplo la tableta cuyo tiempo de desintegración se va a determinar se pone en agua de un pH neutro y de una temperatura de 20°C, para tabletas dispersables, o 37°C para tabletas no dispersables, se determina la desintegración de la tableta visualmente, y se determina el tiempo de desintegración

Un núcleo de tableta recubierto en una tableta dispersable puede tener varias ventajas

- un recubrimiento de acuerdo con la presente invención puede impedir la desintegración de la tableta y la liberación del compuesto activo ya en la boca de un paciente, como es posible con las tabletas no recubiertas, al contacto con la saliva u otro líquido, lo cual puede ser desagradable para el paciente,

- una tableta dispersable recubierta está mejor protegida de las influencias del medio ambiente que una tableta no recubierta, lo cual puede dar como resultado una mejor estabi-

lidad, más alta vida de anaquel, y una pureza más alta de la tableta recubierta, por ejemplo, cuando se almacena,

- las tabletas dispersables no recubiertas puede contener polvo, por ejemplo, que se origine de la abrasión inevitable, por ejemplo durante el empaque y el transporte, por ejemplo, comprendiendo este polvo al compuesto farmacéuticamente activo, por ejemplo, que puede ser desagradable sobre su administración, y esta abrasión y polvo se pueden impedir en una tableta dispersable recubierta de acuerdo con la presente invención,

- se puede utilizar una tableta dispersable de acuerdo con la presente invención para la producción de una solución o suspensión para beber, eliminando el comportamiento desfavorable de las tabletas recubiertas con película, que es que un recubrimiento de película convencional, debido a su característica de formar una estructura de tipo de piel continua, permanece en el líquido de la solución para beber en la forma de pedazos o segmentos continuos de película

En otro aspecto, la presente invención proporciona el uso de una mezcla de recubrimiento de acuerdo con la presente invención, en la producción de tabletas recubiertas, por ejemplo incluyendo tabletas normales y tabletas dispersables, las cuales comprenden en el núcleo de la tableta una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo

En otro aspecto, la presente invención proporciona table-

tas que contienen un ingrediente activo que tiene un sabor amargo, caracterizadas porque se recubren con azúcares, derivados de azúcar, alcoholes de azúcar y sus derivados, tales como sacarosa, lactosa, o manitol, todos los almidones, productos de almidón, derivados de almidón, tales como almidón de papa, almidón soluble, e hidrolizados de almidón, tales como dextrinas, maltodextrina, ciclodextrinas, en donde se pueden utilizar solos en cualquier combinación unos con otros

En los siguientes ejemplos, todas las temperaturas se dan en grados Celsius

Procedimiento general - Recubrimiento rociado

Una suspensión homogeneizada que comprende una mezcla de recubrimiento, se rocía sobre núcleos de tableta, hasta que los núcleos de tabletas quedan uniformemente cubiertos con el recubrimiento. Se obtiene una tableta recubierta que tiene la misma configuración geométrica que el núcleo de tableta antes del recubrimiento. El peso del recubrimiento es menor del 20 por ciento, por ejemplo menor del 10 por ciento del peso de la tableta recubierta

Ejemplo 1

Tabletas recubiertas que comprenden un granulado de cefuroxima-axetil

A) Núcleos de tabletas

Por tableta, se disuelven 608 miligramos de cefuroxima-
axetil, 243 miligramos de un polímero de polivinilpirrolidona
(Kollidone VA64®) y 6 miligramos de laurilsulfato de sodio (Texapon®) en una mezcla de acetona y agua bajo calentamiento suave. La solución obtenida se seca por pulverización, y se obtiene un granulado que se mezcla por tableta con 110 miligramos de una carboximetilcelulosa de Na (Ac-di-Sol®), 30 miligramos de dióxido de silicio (Aerosil 200®), y 5 miligramos de estearato de magnesio. La mezcla obtenida se compacta, y el material compactado se rompe y se iguala a través de un tamiz. El material igualado obtenido se mezcla por tableta con 90 miligramos de manitol (Pearlitol SD 20), 30 miligramos de celulosa microcristalina (Avicel PH 200®), 40 miligramos de polivinilpirrolidona reticulada (Polyplasdone®) 14 miligramos de talco, 3 miligramos de estearato de magnesio, 6 miligramos de laurilsulfato de sodio (Texapon®), 40 miligramos de carboximetilcelulosa de Na (Ac-di-Sol®), y 6 miligramos de dióxido de silicio (Aerosil 200®) y la mezcla obtenida se comprime para obtener núcleos de tabletas.

20

B) Recubrimiento

Los núcleos de tabletas que se pueden obtener como se describe en el Ejemplo 1A) se recubren con las siguientes mezclas de recubrimiento (las cantidades están en porcentaje (peso/peso) por el peso total de la mezcla de recubrimiento).

25

1) Manitol (21 4 por ciento), almidón soluble (21 4 por ciento), dióxido de silicio (Aerosil 200®) (2 0 por ciento), talco (31 8 por ciento), dióxido de titanio (21 4 por ciento),
5 Aspartame (2 0 por ciento)

Se disuelven el manitol y almidón soluble, en agua Los componentes restantes se suspenden en la solución resultante, la cual se homogeneiza Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados como se describe en el
10 procedimiento general anterior

2) Manitol (32 por ciento), almidón soluble (20 por ciento), talco (28%), dióxido de titanio (18 por ciento), aspartame (2 0 por ciento)

15 Se disuelven el manitol y el almidón soluble en agua Se dispersan talco, dióxido de titanio, y aspartame en agua Las dos mezcla resultantes se combinan y se homogeneizan Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados descritos en el procedimiento general anterior
20

Ejemplo 2

Los núcleos de tabletas que se puede obtener como se describe en el Ejemplo 1 A), se recubren con la siguiente mezcla
25 de recubrimiento (las cantidades están en porcentaje (pe-

so/peso) por el peso total de la mezcla de recubrimiento)

Manitol (60 6 por ciento), almidón (6 1 por ciento), talco (18 2 por ciento), dióxido de titanio (12 1 por ciento), aspartame (2 6 por ciento), laurilsulfato de sodio (Texapon®) (0 4 por ciento)

Se disuelven el manitol y aspartame, en agua, y se agita el almidón previamente hinchado en agua en la solución obtenida. La mezcla resultante se mezcla con los ingredientes restantes, y la mezcla obtenida se homogeneiza. Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados como se describe en el procedimiento general anterior

Ejemplo 3

Tabletas recubiertas que comprenden cefuroxima-axetil en una forma amorfa

A) Núcleos de tabletas

Por tableta, se mezclan 608 miligramos de cefuroxima-axetil en una forma amorfa (correspondientes a 500 miligramos de cefuroxima), 110 miligramos de celulosa microcristalina, 80 miligramos de carboximetilcelulosa de Na (Ac-di-Sol®) y 4 miligramos de estearato de magnesio, y la mezcla obtenida se compacta. El material compactado obtenido se rompe y se iguala a través de un tamiz. El material tamizado obtenido se mezcla por tableta con 60 miligramos de polímero de polivinilpirrolid-

dona reticulada (Crospovidone®), 6 miligramos de dióxido de silicio (Aerosil 200®), 20 miligramos de talco, 4 miligramos de estearato de magnesio, y 9 miligramos de laurilsulfato de sodio (Texapon®), y la mezcla obtenida se comprime para obtener núcleos de tabletas

B) Recubrimiento

Los núcleos de tabletas que se pueden obtener como se describe en el Ejemplo 3 A) se recubren con la siguiente mezcla de recubrimiento (las cantidades están en porcentaje (peso/peso) por el peso total de la mezcla de recubrimiento)

1) Manitol (33.2 por ciento), almidón (10.0 por ciento), lactosa (19.9 por ciento), talco (21.2 por ciento), dióxido de titanio (14.1 por ciento), aspartame (1.4 por ciento), laurilsulfato de sodio (Texapon®) (0.2 por ciento)

Se disuelven el manitol, la lactosa, y el aspartame, en agua, y se agita almidón previamente hinchado en agua en la solución obtenida. La mezcla resultante se mezcla con los ingredientes restantes, y la mezcla obtenida se homogeneiza. Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados como se escribe en el procedimiento general anterior.

2) Manitol (26.7 por ciento), almidón soluble (16.7 por ciento), almidón de maíz (16.7 por ciento), talco (22.5 por ciento), dióxido de titanio (15 por ciento), aspartame (1.6 por

ciento), simeticona USP (0.8 por ciento)

El almidón de maíz se hincha previamente en agua. Se dispersan talco, dióxido de titanio, aspartame, y simeticona USP en la mezcla obtenida. Se disuelven el manitol y el almidón soluble en agua. Las dos mezclas resultantes se combinan y se homogeneizan. Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados descritos en el procedimiento general anterior.

10

Ejemplo 4

Los núcleos de tabletas que se pueden obtener como se describe en el Ejemplo 3A), se recubren con la siguiente mezcla de recubrimiento (las cantidades están en porcentaje (peso/peso) por el peso total de la mezcla de recubrimiento).

15

Manitol (21.8 por ciento), almidón soluble (21.8 por ciento), talco (32.5 por ciento), dióxido de titanio (21.8 por ciento), aspartame (2.1 por ciento)

Se disuelven el manitol y el almidón soluble en agua. La mezcla resultante se mezcla con los ingredientes restantes, y la mezcla obtenida se homogeneiza. Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados como se describe en el procedimiento general anterior.

25

Ejemplo 5

Tabletas recubiertas dispersables que comprenden trihidrato de amoxicilina

A) Núcleos de tabletas

5 Por tableta, se mezclan 1,163 miligramos de trihidrato de amoxicilina, 57 miligramos de celulosa microcristalina, y 3 miligramos de estearato de magnesio, y la mezcla obtenida se compacta. El material compactado obtenido se rompe y se iguala a través de un tamiz. El material tamizado obtenido se mezcla
10 por tableta con 120 miligramos de polímero de polivinilpirrolidona reticulada (Crospovidone®) 30 miligramos de talco, 3 miligramos de dióxido de silicio (Aerosil 200®), 4 miligramos de estearato de magnesio, 2 miligramos de aspartame, y 18 miligramos de agente saborizante, y la mezcla obtenida se comprime para
15 obtener núcleos de tabletas.

Los núcleos de tabletas obtenidos muestran un tiempo de desintegración en agua de 1-3 minutos a 20°C.

B) Recubrimiento

Mezcla de recubrimiento (las cantidades están en porcentaje (peso/peso) por el peso total de la mezcla de recubrimiento
20

Manitol (17.9 por ciento), almidón soluble (17.9 por ciento), maltodextrina (17.9 por ciento), talco (26.7 por ciento), dióxido de titanio (17.9 por ciento), aspartame (1.7 por ciento)

25 Se disuelven el manitol, la maltodextrina, y el almidón

soluble en agua La mezcla resultante se mezcla con los ingredientes restantes, y la mezcla obtenida se homogeneiza La suspensión homogeneizada obtenida se rocía sobre los núcleos de tabletas obtenidos en el paso A) Se obtienen tabletas recubiertas uniformes que tienen la misma forma geométrica que el núcleo de tableta no recubierto El peso del recubrimiento por tableta es menor del 10 por ciento del peso de la tableta Las tabletas recubiertas obtenidas muestran un tiempo de desintegración en agua de 1 2 minutos a 20°C El tiempo de desintegración se determina de acuerdo con los métodos convencionales descritos anteriormente

Ejemplo 6

Tabletas recubiertas que comprenden sumatriptano en la forma de una sal con ácido succínico (succinato de sumatriptano)

Se preparan núcleos de tabletas recubiertos de 25 miligramos, 50 miligramos, y 100 miligramos que comprenden a los ingredientes (miligramos por tableta) estipulados en la siguiente tabla, mediante granulación húmeda, mezcla, y compresión

De acuerdo con un método convencional, para obtener núcleos de tabletas y recubrir los núcleos de tabletas obtenidos con una suspensión acuosa de una mezcla de recubrimiento que contiene los ingredientes estipulados en la siguiente tabla

TABLA

	Ingrediente	mg/tableta		
NUCLEO		100 mg	50mg	25 mg
	Succinato de sumatriptano	140 00	70 00	35 00
	Monohidrato de lactosa	116 00	58 00	29 00
	Celulosa microcristalina (Avicel 200®)	35 00	17 50	8 75
	Carboximetilcelulosa de Na (Ac-D1-Sol®)	4 50	2 25	1 13
	Estearato de magnesio	4 50	2 25	1 13
MEZCLA DE RECUBRIMIENTO		Porcentaje en peso por el recubrimiento total		
	Almidón de maíz	7 1 a 7 2		
	Manitol	15 3		
	Almidón soluble	15 3		
	Monohidrato de lactosa	21 2 a 21 4		
NUCLEO		100 mg	50 mg	25 mg
	Acido graso de sorbitan de polioxietileno (Polysorbato 80®)	3 5 a 3 7		
	Aspartame	1 5		
	Talco	21 3 a 21 4		

	Dióxido de titanio	14 2 a 14 3
	Colorante	0 a 0 5

Se obtienen tabletas recubiertas uniformes, con un peso del recubrimiento de aproximadamente el 4 por ciento del peso total de la tableta recubierta

5 Ejemplo 7

Tabletas recubiertas que comprenden cefpodoxima-proxetil

A) Núcleos de tabletas

Por tableta, se mezclan 260 miligramos de cefpodoxima-proxetil (correspondientes a 200 miligramos de cefpodoxima), 42 miligramos de celulosa microcristalina, 50 miligramos de carboximetilcelulosa de Na (Ac-di-Sol®), y 3 miligramos de estearato de magnesio, y la mezcla obtenida se compacta. El material compactado obtenido se rompe y se iguala a través de un tamiz. El material tamizado obtenido se mezcla por tableta con 76 miligramos de lactosa, 3 miligramos de dióxido de silicio (Aerosil 200®), 3 miligramos de estearato de magnesio, y 3 miligramos de laurilsulfato de sodio (Texapon®), y la mezcla obtenida se comprime para obtener núcleos de tabletas.

B) Recubrimiento

Mezcla de recubrimiento (las cantidades están en porcentaje (peso/peso) por el peso total de la mezcla de recubrimiento)

Manitol (26 5 por ciento), almidón soluble (39 7 por ciento), talco (18 6 por ciento), dióxido de titanio (11 9 por ciento), aspartame (1 3 por ciento), simeticona USP (2 0 por ciento)

5 Se disuelven el manitol y el almidón soluble en agua Se dispersan talco, dióxido de titanio, aspartame y simeticona USP en agua Las dos mezclas resultantes se combinan y se homogeneizan Se obtiene una suspensión homogeneizada útil para el recubrimiento rociado, y se realiza el recubrimiento, y se obtienen los resultados descritos en el procedimiento general anterior

10

REIVINDICACIONES

1 Un proceso para el recubrimiento de núcleos de tabletas, comprendiendo el núcleo de tableta una cantidad efectiva
5 de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, el cual comprende rociar una solución o suspensión de recubrimiento que comprende un azúcar o un almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón sobre las tabletas o núcleos de tabletas, con la condición de que se excluyan los agentes formadores de película
10 en la solución o suspensión de recubrimiento, para obtener tabletas recubiertas

2 Un proceso para el recubrimiento de núcleos de tabletas, comprendiendo el núcleo de tableta una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, el cual
15 comprende rociar una solución o suspensión de recubrimiento que se origine a partir de una mezcla de recubrimiento que consista en un azúcar o un almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, y opcionalmente agentes de división, y/o pigmentos, y/o agentes colorantes, y/o edulcorantes, y/o agentes saborizantes,
20 y/o agentes humectantes, y/o conservadores, y/o lubricantes (abrillantadores), y/o agentes antiespumantes sobre las tabletas o núcleos de tabletas, para obtener tabletas recubiertas

3 Una tableta recubierta que comprende una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo,
25 recubierta con una mezcla de recubrimiento consistente en un

azúcar, o un almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, y
opcionalmente agentes de división, y/o pigmentos, y/o agentes
colorantes, y/o edulcorantes, y/o agentes saborizantes, y/o
agentes humectantes, y/o conservadores, y/o lubricantes (abri-
5 llantadores) y/o agentes antiespumantes

4 Una mezcla de recubrimiento para la producción de ta-
bletas recubiertas, comprendiendo el núcleo de tableta de esta
tableta recubierta una cantidad efectiva de cuando menos un
compuesto farmacéuticamente activo, en donde la mezcla de recu-
10 birmiento consiste en un azúcar o un almidón, o una mezcla de
un azúcar y un almidón, y opcionalmente agentes de división,
y/o pigmentos, y/o agentes colorantes, y/o edulcorantes, y/o
agentes saborizantes, y/o agentes humectantes, y/o conservado-
res, y/o lubricantes (abrillantadores) y/o agentes antiespumantes
15 tes

5 El uso de una mezcla de recubrimiento de acuerdo con
la reivindicación 4, en la producción de tabletas recubiertas,
las cuales comprenden en el núcleo de tableta, una cantidad
efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo

20 6 Una tableta dispersable que comprende un núcleo de
tableta que comprende una cantidad efectiva de un compuesto
farmacéuticamente activo, en donde el núcleo de tableta está
recubierto

7 Un proceso, una tableta recubierta, una mezcla de re-
25 cubrimiento, el uso, o una tableta dispersable de acuerdo con

cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el compuesto farmacéuticamente activo tiene un sabor desagradable

8 Un proceso, una tableta recubierta, una mezcla de recubrimiento, el uso, o una tableta dispersable de acuerdo con la reivindicación 7, en donde el compuesto farmacéuticamente activo se selecciona a partir de cefuroxima-axetil, cefpodoxima-proxetil, amoxicilina, sumatriptano, u olanzapina

9 Un proceso, una mezcla de recubrimiento, o el uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, 4 a 5, y 7 a 8, en donde un núcleo de tableta es un núcleo de tableta dispersable

10 Tabletetas que contienen un ingrediente activo que tiene un sabor ~~amargo~~, caracterizadas porque se recubren con azúcares, derivados de azúcar, alcoholes de azúcar y sus derivados, tales como sacarosa, lactosa, o manitol, todos los almidones, productos de almidón, derivados de almidón, tales como almidón de papa, almidón soluble, e hidrolizados de almidón, tales como dextrinas, maltodextrina, ciclodextrinas, en donde se pueden utilizar solos o en cualquier combinación unos con otros

RESUMEN

5

Un proceso para el recubrimiento de núcleos de tabletas, comprendiendo este núcleo de tableta una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto farmacéuticamente activo, el cual
10 comprende rociar una solución o suspensión de recubrimiento que comprende un azúcar, o un almidón, o una mezcla de un azúcar y un almidón, sobre las tabletas o los núcleos de tabletas, con la condición de que se excluyan agentes formadores de película en la solución o suspensión de recubrimiento, para obtener ta-
15 bletas recubiertas, tales como tabletas recubiertas y las mezclas de recubrimiento correspondientes

20

* * * * *

Nota: Se retira el folio 31
correspondiente al extracto
para publicación

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante — 1 []
- Nombre e identificación del inventor — 1 []
- Título o nombre de la invención — 1 []
- Descripción — 3 []
- Reivindicaciones — 27 []
- Resumen — 1 []
- Comprobante de Pago — 2 []
- Poder, cuando proceda []
- Copia de la primera solicitud de patente, si reivindica prioridad, señalándola expresamente []
- Firma del solicitante o apoderado | []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Nombre e identificación del peticionario []
- Nombre e identificación del inventor o diseñador []
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse []
- Representación gráfica []
- Comprobante de pago []
- Poder, cuando proceda []
- Firma del solicitante o apoderado []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Firma Responsable

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
F Radicación: 00300901 00002200 Folios 33
Fecha (RED): 2000-11-22 16:02:19
Trámite 002 PATENTES D 1 REGISTRAR 411 PRESENTAR
Dependencia: 0000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador 334 12 21-23-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@ic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

Se retiraron los folios 32 y 33
correspondientes a la tarjeta
para el archivo temático y a la
tarjeta para el archivo de propietario
cod 202010
Dic 14/00



36
32

INFORME DE PROTOCOLO

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Expediente 00-88901

Fecha 23 de Noviembre del 2000

Se certifica que

Desde fecha 21 de Mayo de 1998,
del folio 97907 al folio 97908 del
libro de Protocolo N° 338, obra el poder
N° 18377 conferido por BIOCHEMIE
GMBH

domiciliado(a) en Kundl, Australia

al doctor JIMENA ESCOBAR URIBE Y/O IGNACIO
ESCOBAR URIBE

Facultad para desistir Si

OBSERVACIONES: Luego de revisar el protocolo de la
referencia, se encontró que dentro del mismo no reposa la
traducción oficial del poder

Revisado 202022

Carrera 13 No 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador 334 12 21
Fax 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D C , Colombia