



DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
PRESENTACIÓN DE OPOSICIÓN

1. Oposición a solicitud de:

- ☒ Patente de invención
☐ Registro de Diseño Industrial
☐ Patente de Modelo de Utilidad
☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

Número de expediente: 14-086-039

Solicitante: ABBVIE DEUTSCHLAND GMBH & CO. KG

Apoderado: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Título de la Nueva Creación: FORMULACIONES BASADAS EN DISPERSIONES SOLIDAS

Gaceta: 707 de 30 septiembre de 2014, No. de publicación 1123

2. Datos del Opositor

☐ Persona Natural

☒ Persona Jurídica

LAFRANCOL S.A.S.

Nombre o denominación / Razón social completa

Documento de identificación: C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☒ Otro ☐ Cuál

Número 890 301 463-8

Dirección Carrera 1 No. 46-84 Ciudad Cali

Teléfono (092) 449.30.51 Fax: E-mail:



Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del representante o apoderado:

REYES VILLAMIZAR JOSE LUIS

Apellidos y Nombre

79'152.473

Documento de identificación

44655

T.P. No.

Dirección del representante

Cra 17 No. 88-23 Of.205

Dirección electrónica

info@reyes-abogados.com

No. Fax

621.25.42

Número telefónico

621.26.31

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación

6. Fundamentos de la oposición

Causal: Incumplimiento de requisitos de patentabilidad (Título II, Capítulo I, Decisión 486 de 2000)

Justificación: VER ANEXO

Prórroga:

SI

☐

NO

☒

7. Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la solicitud No.

14 138 926

Fecha:

26-12-14

☒

Poder, si fuera el caso con el que se acredita la representación.

☒

Pruebas de los fundamentos de la oposición

☐

Copias para traslado

8. Firma

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

Nombre y apellidos

Firma

79.152.473

C.C.

44655

T.P.

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF:

EXPEDIENTE 14-086-039

TÍTULO SOLICITADO:

“FORMULACIONES BASADAS EN DISPERSIONES
SOLIDAS”

PUBLICACIÓN:

Gaceta 707 de 30 de septiembre de 2014, N° de
publicación 1123.

PRIORIDAD:

EP 11182792.9 26-09-2011

SOLICITANTE:

ABBVIE DEUTSCHLAND GMBH & CO. KG

APODERADO:

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

TRÁMITE:

PRESENTACION DE OPOSICIÓN

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR, mayor de edad, identificado como aparece al pie de mi firma, abogado en ejercicio, titular de la tarjeta profesional número 44655 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando en calidad de apoderado de la sociedad **LAFRANCOL S.A.S**, en ejercicio de lo dispuesto por el artículo 42 de la Decisión 486 de 2000, muy respetuosamente me permito formular la siguiente

I. PETICIÓN

Sírvase negar el beneficio patentario a la solicitud contenida en el expediente **14-086-039**, por no cumplir con lo dispuesto en la Decisión 486 de 2000, con base en los fundamentos que se expondrán a continuación.

II. LEGÍTIMO INTERÉS

Asiste a **LAFRANCOL S.A.S**, legítimo interés para presentar esta oposición, pues la eventual concesión de la solicitud restringiría injustificadamente el empleo de ciertas sustancias, derivados y procesos que a nuestro juicio carecen de nivel inventivo, en detrimento de sus legítimos intereses comerciales. De igual manera mis clientes están interesados, por su misma condición de industrias farmacéuticas, en evitar la concesión de privilegios de patente que incumplan los requisitos materiales de patentabilidad establecidos en las normas vigentes, y que supongan un riesgo para la libre competencia.

III. FUNDAMENTOS DE LA OPOSICIÓN

La solicitud colombiana en trámite 14-086-039, referida a formulaciones que contienen un producto disperso sólido, compuesto por un agente activo y un copolímero injertado de unidades de N-vinil lactama de polivinilo y polivinilacetato de poli(alquilenglicol), no cumple los requisitos materiales para otorgársele el privilegio de patente de invención, tal como puede determinarse al valorar los siguientes argumentos:

La formulación reclamada carece de claridad

La forma de caracterización de la materia reclamada carece de claridad pues a partir de la materia allí revelada, un técnico medianamente versado en la materia no tendría claridad sobre las características técnicas esenciales de la formulación de interés:

1. Una formulación *CARACTERIZADA PORQUE* comprende un producto disperso sólido compuesto por
 - (a) un agente activo que comprende al menos una unidad que puede operar como donante de enlaces de hidrógeno o una unidad que puede operar como donante de protones,
 - (b) un copolímero injertado de unidades de N-vinil lactama de polivinilo y polivinilacetato de poli(alquilenglicol) farmacéuticamente aceptable y
 - (c) un modificador del pH farmacéuticamente aceptable, donde el agente activo se selecciona entre los agentes activos de utilidad en la farmacia, los agentes activos de utilidad en la cosmética y los suplementos nutritivos y es un compuesto que presenta una solubilidad en agua, a una temperatura de 25oC y a un pH de 7,0, de 0,01 g/100 ml o menos.

Como se puede ver, se refiere a un agente activo sobre el cual no hay mayor información sobre su caracterización, simplemente que se refiere a *“menos una unidad que puede operar como donante de enlaces de hidrógeno o una unidad que puede operar como donante de protones...”*, *“...donde el agente activo se selecciona entre los agentes activos de utilidad en la farmacia, los agentes activos de utilidad en la cosmética y los suplementos nutritivos y es un compuesto que presenta una solubilidad en agua, a una temperatura de 25°C y a un pH de 7,0, de 0,01 g/100 ml o menos”*, lo cual no puede considerarse claro para el entendimiento de la materia de interés.

En conexión con esto, las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5 y 6 referentes al **agente activo**, carecen de concisión pues se refieren a **resultados a alcanzar** por parte de tal agente (p.ej.: *operar como donante de enlaces de hidrógeno*) y a **materia general** como el caso de la denominación de funciones químicas (p.ej.: *grupos amino primario, amino secundario, hidroxilo, carbamilo...*) o de sus características fisicoquímicas (p.ej.: *agentes activos de utilidad en la cosmética y los suplementos nutritivos y es un compuesto que presenta una solubilidad en agua, a una temperatura de 25°C y a un pH de 7,0, de 0,01 g/100 ml o menos*).

De manera que en la definición de la formulación, la solicitante falla en divulgar cuales son los agentes activos de la misma que presentan los efectos técnicos divulgados que están relacionados con proveer dispersiones sólidas con perfiles de liberación deseados.

Por otro lado, se refiere a un modificador de pH: *“un modificador del pH farmacéuticamente aceptable”*, lo que no es considerado claro y conciso. Adicionalmente, las reivindicaciones 10 a 13 - relacionadas con tal parte estructural de la formulación - tampoco definen cual es el modificador de pH, sino que se ocupan de dar una definición general de estos agentes.

En conclusión, las reivindicaciones 1 a 6 y 10 a 13 fallan en divulgar las características técnicas esenciales de la materia de interés y la totalidad de las formulaciones que están dentro del alcance de esta reivindicación, carecen de soporte y sustento (basado en los ejemplos 1 a 4) en la descripción.

El método reclamado carece nivel inventivo

De acuerdo a lo mencionado por la reivindicación 1, la formulación reclamada carece de claridad y concisión, por lo que el método derivado de la misma no podría considerarse claro y conciso, y menos aún con nivel inventivo pues como se observa, se refiere a una simple operación unitaria de mezcla de los ingredientes:

*16. Un método para producir una formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-15, CARACTERIZADO PORQUE **comprende combinar íntimamente** un agente activo que comprende al menos una unidad que puede operar como donante de enlaces de hidrógeno o una unidad que puede operar como donante de protones, un modificador del pH farmacéuticamente aceptable y un copolímero injertado de unidades de N-vinil lactama de polivinilo y polivinilacetato de poli(alquilenglicol) farmacéuticamente aceptable.*

Por tanto, se resalta que el método reclamado no es claro, conciso ni tiene soporte en la descripción.

Excepciones a la Patentabilidad: Usos

Se observa que en el capítulo reivindicatorio se hace referencia a usos, lo cual no es aceptable en Colombia:

19. El uso de un modificador del pH farmacéuticamente aceptable, CARACTERIZADO PORQUE es en el incremento de la tasa de dispersión de un producto disperso sólido en un medio acuoso, con relación a la tasa de dispersión que podría obtenerse con un producto comparable en el mismo medio acuoso, así como en el incremento de la tasa de liberación de un agente activo desde un producto disperso sólido hasta un medio acuoso, con relación a la tasa de liberación que podría obtenerse desde un producto comparable hasta el mismo medio acuoso, donde el agente activo comprende al menos una unidad que puede operar como donante de enlaces de hidrógeno o una unidad que puede operar como donante de protones, se selecciona entre los agentes activos de utilidad en la farmacia, los agentes activos de utilidad en la cosmética y los suplementos nutritivos y es un compuesto que presenta una solubilidad en agua, a una temperatura de 25°C y a un pH de 7,0, de 0,01 g/100 ml o menos, donde el producto disperso sólido comprende

- (a) un agente activo,*
- (b) un copolímero injertado de unidades de N-vinil lactama de polivinilo y polivinilacetato de poli(alquilenglicol) farmacéuticamente aceptable y*

(c) un modificador del pH farmacéuticamente aceptable, y donde el producto comparable difiere del producto disperso sólido porque carece de un modificador del pH farmacéuticamente aceptable.

Novedad y nivel inventivo:

La materia de interés de la solicitante ya era divulgada por anterioridades como la publicación Internacional WO2011/064111, “**FILM-LIKE PHARMACEUTICAL DOSAGE FORMS**” (publicada el 03.06.2011) y la publicación internacional WO2010/034688, “**USE OF POLYETHER-BASED AND VINYL MONOMER-BASED COPOLYMERS AS BINDERS FOR DOSING FORMS COMPRISING SOLID ACTIVE INGREDIENTS**” (publicada el 01.04.2010), veamos:

R.1 CO- 14-086-039	WO 2011/064111	WO 2010/034688
Una formulación CARACTERIZADA PORQUE comprende un producto disperso sólido compuesto por	SI, (film-like dosages forms)	SI, formas farmacéuticas
un agente activo que comprende al menos una unidad que puede operar como donante de enlaces de hidrógeno o una unidad que puede operar como donante de protones	SI (one or more active substances; p.ej.: naproxeno) Example 6-1000 g of polymer, 200 g of Kollidon 30, 100 g of polyethylene glycol 1500 and 200 g of naproxen (melting point 157°C) were weighed into a Turbula mixing container and mixed for 10 minutes in the T10B Turbula mixer.	SI
un copolímero injertado de unidades de N-vinil lactama de polivinilo y polivinilacetato de poli(alquilenglicol) farmacéuticamente aceptable y	Si (an amphiphilic copolymer, N-vinyl monomers)	SI (Preferred polymers are obtained from: i) from 30 to 70 wt .-% N-vinyl lactam ii) 15 to 35 wt .-% vinyl acetate, and ... As the N-vinyl lactam N-vinylcaprolactam or N-vinylpyrrolidone or mixtures thereof into consideration. Preferably N-vinyl caprolactam is used.)
un modificador del pH farmacéuticamente aceptable,	Ejemplos (ácido tartárico)	SI (buffers)

Como se puede ver a continuación, la publicación WO2011/064111 revelaba las características técnicas esenciales divulgadas por la reivindicación principal (p.2):

Accordingly, film-like dosage forms comprising, as a film former, an amphiphilic copolymer and one or more active substances and, if appropriate, further pharmaceutical excipients were found.

The film-like dosages forms may comprise the amphiphilic copolymers in amounts of from 1 to 100% by weight, preferably from 10 to 90% by weight, particularly preferably from 40 to 70% by weight, based on the total amount of pharmaceutical excipients.

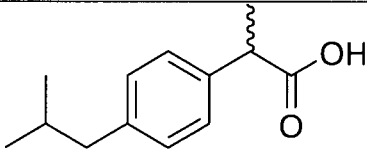
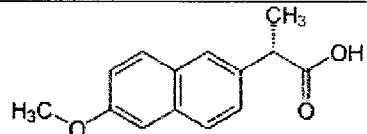
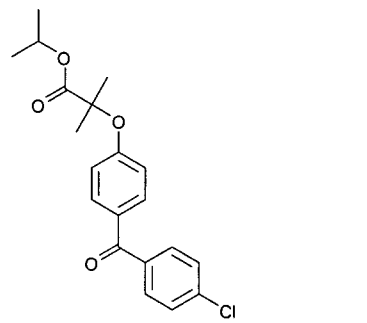
The content of active substance depends on its effective dose per dosage form.

Suitable amphiphilic copolymers are in particular copolymers of polyethers, N-vinyl monomers and further vinyl monomers.

Copolymers which are obtained by free radical polymerization of vinyl acetate and N-vinyl lactams in the presence of a polyether are preferred.

También vale destacar que los agentes activos de la reivindicación 7 de la solicitud en trámite, mencionados por su nombre químico, hacen referencia específica y respectivamente a **ibuprofeno, naproxeno y fenofibrato**, agentes ampliamente conocidos en el estado del arte:

7. La formulación de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADA PORQUE el agente activo se selecciona entre el ácido (RS)-2-(4-(2-metilpropil)fenil)propanoico, el ácido 2-{4-[(4-clorofenil)carbonil]fenoxi}-2-metilpropanoico y el ácido (2S)-2-(6-metoxinaftalen-2-il)propanoico.

ácido (RS)-2-(4-(2-metilpropil) fenil) propanoico	 Ibuprofeno
ácido (2S)-2-(6-metoxinaftalen-2-il)propanoico	 Naproxeno
ácido 2-{4-[(4-clorofenil)carbonil]fenoxi}-2-metilpropanoico	 fenofibrato

Se concluye entonces, que las formas farmacéuticas reclamadas carecen de novedad y nivel inventivo pues de acuerdo a la información divulgada por las anterioridades, un experto en la materia habría llegado a las dispersiones reclamadas por la solicitante que contienen un activo –ampliamente conocido-, un copolímero y un modificador de pH.

Además, la solución de adicionar un modificador de pH a las dispersiones sólidas para mejorar las propiedades de liberación de las mismas era obvio a la luz de los conocimientos propios del técnico versado en la materia.

Por tanto, rogamos se analicen los argumentos expuestos con el rigor y detenimiento habituales y que en consecuencia se decrete, además de la negación de la solicitud en comento, el archivo del expediente que la contiene.

IV. FUNDAMENTOS DE DERECHO

Son fundamentos de derecho el Capítulo I, (Requisitos de Patentabilidad) y el artículo 42 (Oposiciones) de la Decisión 486 de 2000.

V. PRUEBAS

Ruego que se tenga como tal, sin perjuicio de las que puedan presentarse al vencimiento de la prórroga solicitada, y de aquellas que el Despacho considere oficiosamente, las siguientes:

- Publicación Internacional WO2011/064111, "FILM-LIKE PHARMACEUTICAL DOSAGE FORMS" (publicada el 03.06.2011) (portada. P2, reivindicaciones)
- Publicación Internacional WO2010/034688, "USE OF POLYETHER-BASED AND VINYL MONOMER-BASED COPOLYMERS AS BINDERS FOR DOSING FORMS COMPRISING SOLID ACTIVE INGREDIENTS" (publicada el 01.04.2010) (portada)

VI. ANEXOS

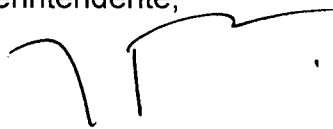
Para efectos del trámite correspondiente, me permito anexar al presente escrito los siguientes anexos:

1. Poder para actuar.
2. Constancia de pago de las tasas de tramitación de oposición.
3. El mencionado en el acápite de pruebas.

VII. NOTIFICACIONES

El suscrito recibirá notificaciones en la secretaría de su Despacho o en mi oficina localizada en la Carrera 17 No. 88-23, Oficina 205, Fax (1) 621.25.42 de esta ciudad. Lafrancol S.A. las recibirá en sus oficinas localizadas las recibirá en sus oficinas localizadas en la Carrera 1 N° 46-84 de Cali.

Señor Superintendente,



JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

C.C. 79.152.473 de Usaquén
T.P.A. 44.655 de C.S.J.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 138826

Bogotá D.C., Diciembre 26 de 2014 - 14:07:23

RECIBIDO DE : REYES Y REYES ABOGADOS

NI 900.048.328

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	223295133	26/12/2014	2.319.000.00
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	644247741	23/12/2014	2.680.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	POSICION POR CADA CLASE-MARCAS Y LEAS COMERCIALES	335.000.00	335.000.00
				\$335.000.00

SON: **TRESCIENTOS TREINTA Y CINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



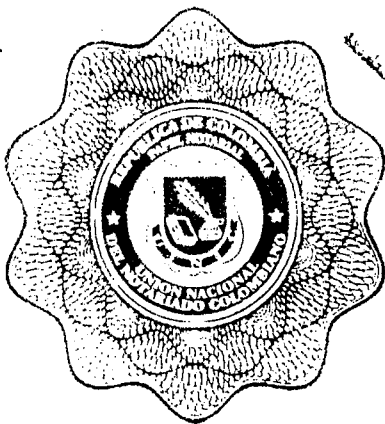
No. 14-086039- -00005-0000

Fecha: 2014-12-30 10:51:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 400 OPOSIOBSERVTER Folios: 19

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Diciembre 26 de 2014 - 14:07:25



1658 B

AA 8567146

REPUBLICA DE COLOMBIA

NOTARIA 33 DE BOGOTA D.C.

ESCRITURA PUBLICA NUMERO: 1 6 5 8

- - MIL SEISCIENTOS CINCUENTA Y OCHO - -

FECHA DE OTORGAMIENTO: CUATRO (4) DE

JULIO - - - - -

DEL AÑO DOS MIL DOS (2002). -----

ACTO: -----

1.- PODER ESPECIAL.-----

OTORGADO POR: LAFRANCOL S.A., con Nit. No. - - -

890.301.463-8 - - - - -

a favor de: JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR, con C.C.No.

79.152.473 de Usaquén - Bogotá.-----

DIANA BEATRIZ LOPEZ

NOTARIA TREINTA Y TRES (33) DE BOGOTA D.C.

EN LA CIUDAD DE BOGOTA, DISTRITO CAPITAL,
DEPARTAMENTO DE CUNDINAMARCA, REPUBLICA DE COLOMBIA,

ANTE MI, DIANA BEATRIZ LOPEZ, - - - - -

NOTARIA TREINTA Y TRES (33) - - - - -

DE ESTE CIRCULO SE OTORGA LA ESCRITURA PUBLICA QUE
SE CONSIGNA EN LOS SIGUIENTES TERMINOS:-----

COMPARECIO: JUAN MARIA RENDON, mayor de edad,
vecino de Bogotá, D.C, identificado con la cédula de
ciudadanía número 17.125.100 - - - - -

Expedida en Bogotá - - - - -

Y manifestó:-----

PRIMERO: Que obra en su carácter de Representante
Legal de en nombre y representación de LAFRANCOL
S.A, sociedad comercial organizada y existente
conforme a las leyes colombianas, con domicilio y
sede principal en Cali - Valle, constituida mediante
escritura pública número

De la Notaría

De fecha

Reformada en distintas oportunidades, según consta en el certificado expedido por la Cámara de Comercio de Cali - Valle.-----

SEGUNDO: Que en tal carácter, por este público instrumento, concede PODER ESPECIAL, PERO AMPLIO Y SUFICIENTE a **JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR**, mayor de edad, vecino de Bogotá, D.C, identificado con la cédula de ciudadanía número 79.152.473 de Usaquén, abogado en ejercicio, portador de la T.P.No. 446 55 del C.S. de la J., domiciliado en Bogotá, D.C, República de Colombia, con dirección en la carrera 17 No. 88-23, Oficina 205, de la misma ciudad, como su representante con poder especial, amplio y suficiente, para obtener la protección los derechos de propiedad industrial y de libre competencia de Lafrancol S.A., a cuyo efecto lo autorizo, par que nos represente ante cualesquiera entidad o persona, ejerza o no jurisdicción, especialmente ante las el orden administrativo, contencioso, administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos:-----

a.- Obtención, formulación de oberservaciones y oposición a patentes de invención, modelos y dibujos industriales y el registro de licencias de uso de esos derechos.-----

b.- Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los procesos civiles, penales, administrativos o contencioso- administrativos relacionados con estos derechos u otros de diferente naturaleza, acciones y procesos que



10583

AA 8567152

promueva Lafrancol S.A., o se
promuevan contra esta y.-----

c.- Para que en todos los asuntos
arriba determinados, tanto en
los términos señalados por los
artículos 42 y complementarios

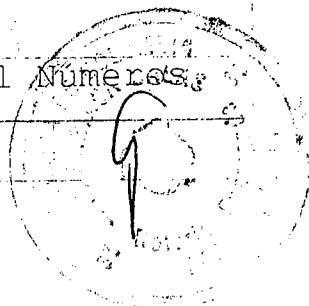
de la decisión 486 de la Comunidad Andina como del
artículo 70 del C.P.C. pueda sustituir este
mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del
proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar y
ratificar los actos de agentes oficiosos y ceder a
título gratuito y/o oneroso, licenciar, inscribir
contratos de cesión y de licencia, inscripción de
prendas, levantamiento de prendas, inscribir
derechos de retención y en general todos los asuntos
que se deban tramitar ante la Superintendencia de
Industria y Comercio.-----

Manifestamos que de la veracidad de las
declaraciones del contenido y autenticidad de los
documentos anexos en éste instrumento público sólo
respondemos los comparecientes.-----

HASTA AQUI LA MINUTA PRESENTADA

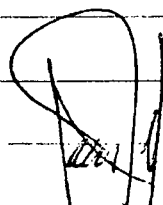
OTORGAMIENTO Y AUTORIZACION: Leído el presente
instrumento Público por los comparecientes y
advertidos de la formalidad de su contenido, dentro
del término legal, lo hallaron conforme con sus
intenciones y lo aprobaron en todas sus partes y
firmaron junto con la Suscrita Notaria quien da fe y
lo autoriza. -----

Se utilizaron las hojas de papel Notarial Números
AA 8567146, 8567152.



DERECHOS NOTARIALES: \$ 49.600.00

RESOLUCION No. 4188 del 28 de Diciembre del 2001


JUAN MARIA RENDON

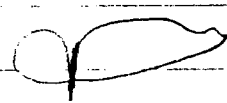
C.C. No. 17.125.100 de Bogotá

LAFRANCOL S.A.

Nit. No. 890.301.463-8

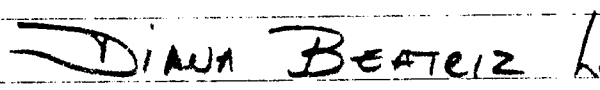
TEL: 622-04-66.

ACEPTO :


JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR

C.C. No. 29.152.473

TEL: 621-2631


DIANA BEATRIZ LOPEZ

NOTARIA 33 DE BOGOTA D.C.

n.c.a.

Es segunda COPIA (FOTOCOPIA)

tomada de su original que se expide conforme al

Artículo 79 del Decreto 960 de 1970 en 06

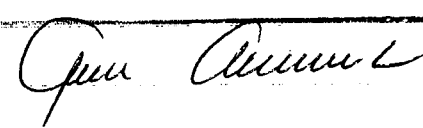
hojas útiles con destino a Jose Luis Reyes

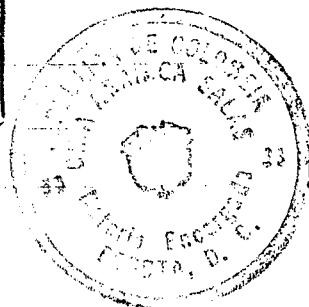
Villamizar

Santafé de Bogotá

NOT. Dcto. 1772/79

05 JUL. 2002





(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
3 June 2011 (03.06.2011)

(10) International Publication Number
WO 2011/064111 A1

(51) International Patent Classification:

A61K 47/10 (2006.01) A61K 31/00 (2006.01)
A61K 47/34 (2006.01) A61K 9/00 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/EP2010/067384

(22) International Filing Date:

12 November 2010 (12.11.2010)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

09176929.9 24 November 2009 (24.11.2009) EP
61/264,259 25 November 2009 (25.11.2009) US

(71) Applicant (for all designated States except US): BASF SE [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): DJURIC, Dejan [RS/DE]; Schwetzingen Platz 2, 68165 Mannheim (DE). KOLTER, Karl [DE/DE]; Sudetenstr.1, 67117 Limburg-erhof (DE). HERTING, Michael Gerrit [DE/DE]; Wald-parkdamm 6, 68163 Mannheim (DE).

(74) Common Representative: BASF SE; 67056 Lud-wigshafen (DE).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— with international search report (Art. 21(3))

(54) Title: FILM-LIKE PHARMACEUTICAL DOSAGE FORMS

(57) Abstract: Film-like pharmaceutical dosage forms, comprising, as film formers, amphiphilic copolymers and one or more ac-tive substances.

WO 2011/064111 A1

Film-like pharmaceutical dosage forms

Description

- 5 The present invention relates to film-like pharmaceutical dosage forms based on amphiphilic copolymers as film formers.

The invention describes physiologically tolerated active substance-containing films for use in humans or animals.

10

The films can be used as plaster inlays and wound dressings and in particular also for oral administration.

- 15 In the case of film-like dosage forms which can be administered orally, also referred to as "oral strips", the higher permeability of the buccal mucosa in comparison with the skin can be utilized. Because of this and also because of possible circumventing of the first pass effects, it is also possible to realize higher absorption rates or higher bioavailabilities.

- 20 The major advantage of oral films in pharmacy is that they can readily be used both in pediatrics and in geriatrics. They can be readily metered and can generally be taken readily without additional liquid. Because of this, this novel drug form is particularly suitable for therapy in the case of difficulties in swallowing, nausea, attacks of dizziness and emotional disturbances.

25

- Typically, polymers are used for producing films. As further additives, further polymers, active substances, plasticizers or aromas may also be added. Melt extrusion or the evaporation method are known and established as production methods according to the prior art. The following may be mentioned as examples here:
- 30 hydroxypropylmethylcellulose (hypromellose), hydroxypropylcellulose, starch and modified starch, pullulan, pectin, gelatin and carboxymethylcellulose (Dixit and Puthli, Journal of Controlled Release 139 (2009) 94-107).

- 35 The problem in the preparation of such film-like dosage forms consists however in the choice of a suitable base material for the films. This base material, which is intended to form the matrix of the film, must be readily processable to give films; furthermore, the active substance must be capable of being readily incorporated and, for reasons relating to drug safety, the film must have a high mechanical strength in combination with a good release profile for the active substance.

40

A major disadvantage of the films known to date is that they have too low a dissolving power for active substances and the active substance is therefore present in crystalline

form, with the result that it has poor bioavailability. Moreover, a grainy sensation in the mouth may be produced thereby. Two-phase systems generally entail the problem of homogeneity and of uniformity of content. The flexibility, too, is frequently low, with the result that they can easily break or tear. The polymers known to date tend to be hydrophilic and, owing to their high glass transition temperature and high viscosity, are scarcely extrudable, extrudable only at high temperature or difficult to produce from solutions by knife coating. In the knife coating process, inhomogeneities and air inclusions frequently occur.

- Amphiphilic copolymers, such as graft polymers, obtained by free radical polymerization of vinyl acetate and N-vinyl lactams in the presence of a polyether, are known per se.

WO 2007/051743 discloses the use of water-soluble or water-dispersible copolymers of N-vinyl lactam, vinyl acetate and polyethers, as solubilizers for pharmaceutical, cosmetic, food, agrotechnical or other technical applications. It is stated very generally therein that the corresponding graft polymers can also be processed in the melt with the active substances.

WO 2009/013202 discloses that such graft polymers of N-vinyl lactam, vinyl acetate and polyethers are melted in an extruder and mixed with pulverulent or liquid active substances and can be processed to give tablets.

It was an object of the present invention to provide improved film-like dosage forms which have advantages over the prior art with respect to production and handling of the films, mechanical strength and release behavior.

Accordingly, film-like dosage forms comprising, as a film former, an amphiphilic copolymer and one or more active substances and, if appropriate, further pharmaceutical excipients were found.

The film-like dosage forms may comprise the amphiphilic copolymers in amounts of from 1 to 100% by weight, preferably from 10 to 90% by weight, particularly preferably from 40 to 70% by weight, based on the total amount of pharmaceutical excipients.

The content of active substance depends on its effective dose per dosage form.

Suitable amphiphilic copolymers are in particular copolymers of polyethers, N-vinyl monomers and further vinyl monomers.

Copolymers which are obtained by free radical polymerization of vinyl acetate and N-vinyl lactams in the presence of a polyether are preferred.

Corresponding copolymers are obtained by free radical polymerization of a mixture of

- i) from 30 to 80% by weight of N-vinyl lactam,
- ii) from 10 to 50% by weight of vinyl acetate and
- 5 iii) from 10 to 50% by weight of a polyether,

with the proviso that the sum of i), ii) and iii) is equal to 100% by weight.

According to an embodiment of the invention, preferred copolymers, obtainable from:

10

- i) from 30 to 70% by weight of N-vinyl lactam
- ii) from 15 to 35% by weight of vinyl acetate and
- iii) from 10 to 35% by weight of a polyether, are used.

15 Particularly preferably used copolymers are obtainable from:

- i) from 40 to 60% by weight of N-vinyl lactam
- ii) from 15 to 35% by weight of vinyl acetate and
- iii) from 10 to 30% by weight of a polyether.

20

Very particularly preferably used copolymers are obtainable from

- i) from 50 to 60% by weight of N-vinyl lactam
- ii) from 25 to 35% by weight of vinyl acetate and
- 25 iii) from 10 to 20% by weight of a polyether.

The proviso that the sum of the components i), ii) and iii) is equal to 100% by weight is also true for the preferred and particularly preferred compositions.

30 N-vinylcaprolactam or N-vinylpyrrolidone or mixtures thereof are suitable as the N-vinyl lactam. N-vinylcaprolactam is preferably used.

Accordingly, an amphiphilic copolymer of N-vinylcaprolactam, vinyl acetate and polyether is particularly preferred.

35

Polyethers serve as the grafting base. Suitable polyethers are preferably polyalkylene glycols. The polyalkylene glycols may have molecular weights of from 1000 to 100 000 Da [Dalton], preferably from 1500 to 35 000 Da, particularly preferably from 1500 to 10 000 Da. The molecular weights are determined starting from the OH

40 number measured according to DIN 53240.

Particularly preferred polyalkylene glycols are polyethylene glycols. Furthermore,

We claim:

- 5 1. A film-like pharmaceutical dosage form comprising, as film formers, amphiphilic copolymers and one or more active substances.
2. The dosage form according to claim 1, comprising, as film formers, amphiphilic copolymers of polyethers, N-vinyl monomers and further vinyl monomers.
- 10 3. The dosage form according to claim 1 or 2, comprising, as film formers, copolymers which are obtained by free radical polymerization of vinyl acetate and N-vinyl lactams in the presence of a polyether.
- 15 4. The dosage form according to any of claims 1 to 3, comprising, as film formers, amphiphilic copolymers which are obtained by free radical polymerization of a mixture of i) from 30 to 80% by weight of N-vinyl lactam, ii) from 10 to 50% by weight of vinyl acetate and iii) from 10 to 50% by weight of a polyether, with the proviso that the sum of i), ii) and iii) is equal to 100% by weight.
- 20 5. The dosage form according to any of claims 1 to 4, comprising, as a film former, a copolymer of N-vinyl caprolactam, vinyl acetate and a polyether.
- 25 6. The dosage form according to any of claims 1 to 5, comprising, as film formers, amphiphilic copolymers in amounts of from 1 to 100% by weight, based on the total amount of pharmaceutical excipients.
- 30 7. The dosage form according to any of claims 1 to 6, comprising, as film formers, amphiphilic copolymers in amounts of from 10 to 90% by weight, based on the total amount of pharmaceutical excipients.
- 35 8. The dosage form according to any of claims 1 to 7, comprising, as film formers, amphiphilic copolymers in amounts of from 40 to 70% by weight, based on the total amount of pharmaceutical excipients.
- 40 9. The dosage form according to any of claims 1 to 8, comprising, as further pharmaceutical excipients, further polymers, active substances, plasticizers, colorants, antioxidants, emulsifiers, surfactants, stabilizers, preservatives, fillers, gel formers, sweeteners, acidifying agents, lubricants or aromas or mixtures thereof.
10. The dosage form according to any of claims 1 to 9, comprising, as further polymers, povidone, copovidone, polyvinyl alcohols, polyvinyl alcohol-

polyethylene glycol graft copolymers, polyethylene glycols, poloxamers, pullulan, starch, modified starches, gelatin, hydroxyalkylated cellulose derivatives, carboxyalkylated cellulose derivatives, acrylic acid-methacrylic acid copolymers or mixtures thereof.

5

11. The dosage form according to any of claims 1 to 10, comprising disintegrants.

10

12. The dosage form according to any of claims 1 to 11, comprising mucoadhesive polymers from the group consisting of polycarbophil, polyacrylic acid, carrageenan, guar gum, alginates, galactomannans, pectins, chitosan and cellulose ethers.

15

13. The dosage form according to any of claims 1 to 12, comprising from 0.1 to 50% by weight, based on the total formulation, of active substance.

20

14. A process for the preparation of film-like dosage forms according to any of claims 1 to 13, wherein film formers, active substances and, if appropriate, further excipients are mixed and the mixture is shaped into a film.

25

15. The process according to claim 14, wherein the shaping is effected by melt extrusion.

16. The process according to claim 14, wherein film formers, active substances and, if appropriate, further excipients are mixed in solution, the solution is drawn to give a film and a film forms as a result of evaporation of the solvent.

17. The process according to claim 16, wherein water, alcohols, ketones, esters, hydrocarbons, amides or mixtures thereof are used as the solvent.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
1. April 2010 (01.04.2010)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2010/034688 A2

PCT

- (51) Internationale Patentklassifikation:
A61K 9/16 (2006.01) A61K 9/20 (2006.01)
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2009/062199
- (22) Internationales Anmeldedatum:
21. September 2009 (21.09.2009)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
08165113.5 25. September 2008 (25.09.2008) EP
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BASF SE** [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **MEYER-BÖHM, Kathrin** [DE/DE]; Pfünzingerstr. 43, 90537 Feucht (DE). **DOBRAWA, Rainer** [DE/DE]; Hunsrückstr. 21, 70469 Stuttgart (DE). **MASCHKE, Angelika** [DE/DE]; Roritzer Straße 6, 93047 Regensburg (DE). **KOLTER, Karl** [DE/DE]; Sudetenstr. 1, 67117 Limburgerhof (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: **BASF SE**; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts (Regel 48 Absatz 2 Buchstabe g)



WO 2010/034688 A2

(54) Title: USE OF POLYETHER-BASED AND VINYL MONOMER-BASED COPOLYMERS AS BINDERS FOR DOSING FORMS COMPRISING SOLID ACTIVE INGREDIENTS

(54) Bezeichnung : VERWENDUNG VON COPOLYMEREN AUF BASIS VON POLYETHERN UND VINYLMONOMEREN ALS BINDEMITELE FÜR FESTE WIRKSTOFFHALTIGE DOSIERUNGSFORMEN

(57) Abstract: Use of water-soluble or water-dispersible copolymers obtained through radically-initiated polymerization of a mixture of i) 30 to 80 wt.-% of N-vinyl lactam, ii) 10 to 50 wt.-% of vinyl acetate and iii) 10 to 50 wt.-% of a polyether as a binder for the manufacture of dosing forms comprising solid active ingredients, said copolymers being conditioned in that the total of i), ii) and iii) is equal to 100 wt.-%.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von wasserlöslichen oder wasserdispersiblen Copolymerisaten, die erhalten werden durch radikalisch initiierte Polymerisation einer Mischung aus i) 30 bis 80 Gew.-% N-Vinylactam, ii) 10 bis 50 Gew.-% Vinylacetat und iii) 10 bis 50 Gew.-% eines Polyethers, mit der Maßgabe, dass die Summe von i), ii) und iii) gleich 100 Gew.-% ist, als Bindemittel für die Herstellung von festen wirkstoffhaltigen Dosierungsformen.

Verwendung von Copolymeren auf Basis von Polyethern und Vinylmonomeren als Bindemittel für feste wirkstoffhaltige Dosierungsformen

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Copolymeren, die durch Polymerisation von Vinylacetat und N-Vinyllactamen in Gegenwart eines Polyethers erhalten werden, als Bindemittel, insbesondere als Trockenbindemittel, für feste wirkstoffhaltige Dosierungsformen, insbesondere Tabletten.

10

Bindemittel verbessern die Verpressbarkeit von wirkstoffhaltigen Formulierungen zu festen Dosierungsformen durch Verbesserung der Partikelhaftung.

15

Kriterien des Qualitätsstandards bei der Prüfung von komprimierten Dosierungsformen wie den Tabletten sind gemäß dem Europäischen Arzneibuch Gleichförmigkeit der Masse (Gewichtseinheitlichkeit), Bruchfestigkeit, Friabilität und Zerfall.

20

Cellulosepulver, zum Beispiel mikrokristalline oder mikrofeine Cellulosen, führen zu sehr harten Tabletten, beeinträchtigen aber die Fließfähigkeit der Tablettiermischung.

Weitere Bindemittel wie Hydroxypropylmethylcellulosen oder Polyvinylpyrrolidone stellen sehr effektive Feuchtbindemittel dar.

25

Zu den Trockenbindemitteln für die Granulation ohne Zusatz von Lösungsmitteln oder die Direktverpressung kommen Hydroxypropylcellulosen oder Copovidon (Copolymer aus N-Vinylpyrrolidon und Vinylacetat im Gewichtsverhältnis 60:40) in Betracht.

30

Häufig vermögen die bisher bekannten Bindemittel, insbesondere solche, die als Trockenbindemittel geeignet sind, den verschiedenen Kriterien für die Qualitätsstandards nur teilweise zu genügen. So verhalten sich Tablettenfestigkeit und Zerfallszeit oft wie Antipoden. Auch die Friabilität, also der Abrieb, kann sowohl bei weichen Tabletten durch Kantenabrieb als auch bei sehr harten Tabletten durch Deckeltendenzen unbefriedigend hoch sein.

35

Es bestand daher die Aufgabe, neue und verbesserte Bindemittel, insbesondere Trockenbindemittel, für pharmazeutische, kosmetische, lebensmitteltechnische, agrotechnische oder sonstige technische Anwendungen bereitzustellen, die hinsichtlich Bruchfestigkeit und Friabilität der Dosierungsformen verbesserte Eigenschaften aufweisen.

40

Aus der WO 2007/051743 ist die Verwendung von Copolymerisaten, die durch Polymerisation von N-Vinyllactam, Vinylacetat und Polyethern erhalten werden, als Löslichkeitsvermittler für in Wasser schwerlösliche Wirkstoffe bekannt.

45

Die Aufgabe wurde erfindungsgemäß gelöst durch die Verwendung von wasserlöslichen oder wasserdispersierbaren Copolymerisaten, die erhalten werden durch radikalisch initiierte Polymerisation einer Mischung aus

Die Schüttdichte des Granulats betrug bei 0,63 g/mL bestimmt mit dem Schütt- / Stampfvolumeter nach Ph.Eur. Das Fließverhalten des Granulats bestimmt mittels Pfrengle - Trichter wies einen Böschungswinkel von 26,6° und eine Auslaufzeit von 7,2 Sekunden auf.

5

Anschließend wurde das Granulat zu Tabletten verpresst. Vor der Tablettierung des fertigen Granulats wurden 5 Gew.-% Sprengmittel (Crospovidone; Kollidon® CL) und 0,5 Gew.-% Schmiermittel (Magnesiumstearat) zugegeben.. Die gesamte Masse wurde erneut durch ein Sieb der Maschenweite 1,0 mm gegeben, in eine Glasflasche gefüllt, verschlossen und 5 min im Turbula –Mischer gemischt. Die Pressmischung wurde auf einer Exzenterpresse (Exzenterpresse EK0) mit 18kN zu 12mm großen Tabletten verpresst.

10

Die Tabletten wiesen folgende Eigenschaften auf:

15

Bruchfestigkeit: 80 N
Friabilität: 0.2 %
Zerfall: 50 s

20 Beispiel 4: Sintergranulate; Prozentangaben [Gew.-%]

Formulierung 1	Formulierung 2	Formulierung 3	Formulierung 4
50 % Polymerisat A	50 % Polymerisat A	50 % Polymerisat A	40 % Polymerisat A
30 % Lactose	30 % Lactose	25 % Lactose	35 % Lactose
20 % Fenofibrat	15 % Itraconazol	20 % Cinnarizin	20 % Cinnarizin
-	5 % PEG 400	PEG 5 % 600	5 % PEG 600

Die Herstellung der Granulate erfolgte in einem Zweischnckenextruder mit 16 mm Schneckendurchmesser (L/D Verhältnis = 40) der Firma ThermoFisher Polylab, der drucklos mit offenem Kopf betrieben wurde. Granuliert wurde bei 100 rpm Schnecken- drehzahl und einer Zylindertemperatur (ab dem 2. Zylinderelement) von 80°C.

25

	Formulierung 1	Formulierung 2	Formulierung 3	Formulierung 4
Böschungswinkel	28 °	30 °	30 °	31 °
Fließgeschwindigkeit	8 sec	7 sec	8.1 sec	7.5 sec
Schüttdichte	0.6 g/ml	0.65 g/ml	0.55 g/ml	0.58 g/ml
Mittlerer Partikel- durchmesser	350 µm	420 µm	342 µm	380 µm

Patentansprüche

1. Verwendung von wasserlöslichen oder wasserdispergierbaren Copolymerisaten, die erhalten werden durch radikalisch initiierte Polymerisation einer Mischung aus
- 5
- i) 30 bis 80 Gew.-% N-Vinylactam,
 - ii) 10 bis 50 Gew.-% Vinylacetat und
 - iii) 10 bis 50 Gew.-% eines Polyethers,
- 10 mit der Maßgabe, dass die Summe von i), ii) und iii) gleich 100 Gew.-% ist, als Bindemittel für die Herstellung von festen wirkstoffhaltigen Dosierungsformen.
2. Verwendung nach Anspruch 1, wobei ein Copolymerisat erhalten aus
- 15
- i) 30 bis 70 Gew.-% N-Vinylactam
 - ii) 15 bis 35 Gew.-% Vinylacetat, und
 - iii) 10 bis 35 Gew.-% eines Polyethers
- eingesetzt wird.
3. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, wobei ein Copolymerisat erhalten aus
- 20
- i) 40 bis 60 Gew.-% N-Vinylactam
 - ii) 15 bis 35 Gew.-% Vinylacetat
 - iii) 10 bis 30 Gew.-% eines Polyethers
- eingesetzt wird.
- 25 4. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 3, zur Herstellung von Tabletten.
5. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 4, wobei das Bindemittel in Mengen von 1 bis 20 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Dosierungsform, eingesetzt wird.
- 30
6. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 5, das Bindemittel in Mengen von 1 bis 10 Gew.-% in den Dosierungsformen eingesetzt wird.
7. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 6, als Trockenbindemittel eingesetzt werden.
- 35
8. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 7, wobei die Bindemittel als Trockenbindemittel für die Direkttablettierung eingesetzt werden.
- 40 9. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 6, wobei die Bindemittel in Form von Feuchtgranulaten oder Wirbelschichtgranulaten eingesetzt werden.

10. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 6, als Bindemittel in Form von Sintergranulaten.
11. Verwendung nach Anspruch 10, wobei die Sintergranulate bei Temperaturen von 50 bis 100 °C erhalten werden.
12. Verwendung nach Anspruch 11, wobei die Sintergranulate bei Temperaturen von 70 bis 100 °C erhalten werden.
13. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 6 und 9 bis 12, wobei die Bindemittel in Gegenwart von weiteren pharmazeutischen Hilfsstoffen granuliert werden.
14. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 6 und 9 bis 13, wobei die Bindemittel in Gegenwart von pharmazeutischen Wirkstoffen granuliert werden.
15. Verfahren zur Herstellung von festen pharmazeutischen Dosierungsformen, dadurch gekennzeichnet, dass man als Bindemittel wasserlösliche oder wasserdispergierbaren Copolymerisate, die erhalten werden durch radikalisch initiierte Polymerisation einer Mischung aus
- iv) 30 bis 80 Gew.-% N-Vinylactam,
v) 10 bis 50 Gew.-% Vinylacetat und
vi) 10 bis 50 Gew.-% eines Polyethers,
- mit der Maßgabe, dass die Summe von i), ii) und iii) gleich 100 Gew.-% ist, mit pharmazeutischen Wirkstoffen und gegebenenfalls weiteren pharmazeutischen Hilfsstoffen vermischt und die Mischung anschliessend in die feste Dosierungsform überführt.
16. Verfahren nach Anspruch 16, dadurch gekennzeichnet, dass man das Bindemittel trocken mit den pharmazeutischen Wirkstoffen und gegebenenfalls den weiteren pharmazeutischen Hilfsstoffen vermischt und die trockene Mischung in die festen Dosierungsformen überführt.
17. Verfahren nach Anspruch 16, dadurch gekennzeichnet, dass man das Bindemittel in Form von Granulaten in die festen Dosierungsformen einarbeitet.
18. Verfahren nach Anspruch 17, dadurch gekennzeichnet, dass man die Granulate durch Feuchtgranulation, Wirbelbettgranulation oder Sintergranulation erhält.
19. Verfahren nach einem der Ansprüche 17 oder 18, dadurch gekennzeichnet, dass man weitere pharmazeutische Hilfsstoffe in die Granulate einarbeitet.

20. Verfahren nach einem der Ansprüche 17 bis 19, dadurch gekennzeichnet, dass man pharmazeutische Wirkstoffe in die Granulate einarbeitet.
21. Verfahren nach einem der Ansprüche 15 bis 19, dadurch gekennzeichnet, dass
5 man die Mischung aus Bindemittel, pharmazeutischen Wirkstoffen und gegebenenfalls weiteren pharmazeutischen Hilfsstoffen durch Verpressen in die festen Dosierungsformen überführt.