

REIVINDICACIONES

1. Una cápsula de gelatina blanda de liberación retardada caracterizada porque comprende:

- 5 a. un material de relleno; y
(b) una composición de la cubierta,

en donde el material de relleno comprende al menos un agente activo, y

en donde la composición de la cubierta comprende gelatina y un polímero dependiente del pH que comprende pectina y goma gellan, en donde la composición de la cubierta
10 no se rompe a un pH de 4 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato II de la USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

2. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de 5 a los 15 minutos, 30
15 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato USP II con paletas a 50 RPM, 900 ml medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

3. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 5 y 6 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un
20 Aparato II de USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

4. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada caracterizada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 6 y 7 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se
25 mide con un Aparato II de la USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

5. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 7 y 8 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un
30 Aparato USP II con paletas a 50 RPM, 900 ml medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

6. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 8 y 8.4 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un

Aparato II de USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

7. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta se deriva de una masa húmeda que comprende del 0.1 al 5% de goma gellan.
8. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con la reivindicación 7, caracterizada porque la masa húmeda comprende además de un 2 % a un 10 % de pectina.
9. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende además un plastificante.
10. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende además dextrosa.
11. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la pectina es pectina de bajo metoxilo.
12. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende de alrededor de 40 % en peso a alrededor de 80 % en peso de una gelatina, en base al peso total de la composición de la cubierta seca.
13. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende alrededor de 0.1 % en peso a alrededor de 10 % en peso o alrededor de 0.4 % en peso a alrededor de 5 % en peso de goma gellan, en base al peso total de la composición de la cubierta seca.
14. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende alrededor de 0.1 % en peso a alrededor de 10 % en peso o alrededor de 2 % en peso a alrededor de 20 % en peso de pectina, en base al peso total de la composición de la cubierta seca.
15. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con la reivindicación 10, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende de alrededor de 0.01 % en peso a alrededor de 2 % en peso de dextrosa, en base al peso total de la composición de la cubierta seca.
16. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con la reivindicación 9, caracterizada porque la composición de la cubierta comprende alrededor de 15 % en peso a

alrededor de 40 % en peso de un plastificante, en base al peso total de la composición de la cubierta seca.

17. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la gelatina se selecciona del grupo que consiste en gelatina de tipo A, gelatina de tipo B y mezclas de las mismas.

18. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la gelatina se selecciona del grupo que consiste en gelatina de pescado, gelatina de piel, gelatina de hueso y mezclas de las mismas.

19. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con la reivindicación 11, caracterizada porque la pectina de bajo metoxilo se selecciona del grupo que consiste en pectina amidada, pectina no amidada y combinaciones de las mismas.

20. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 9 o 16, caracterizada porque el plastificante es glicerol, sorbitol o combinaciones de los mismos.

21. La cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la proporción en peso de pectina a goma gellan es de alrededor de 1:10 a alrededor de 50:1; alrededor de 1:5 a alrededor de 40:1; alrededor de 1:1 a alrededor de 25:1 o alrededor de 10:1 a alrededor de 24:1.

22. Una cápsula de gelatina blanda de liberación retardada caracterizada porque comprende:

- a. un material de relleno; y
- (b) una composición de cubierta,

en donde el material de relleno comprende al menos un agente activo, y en donde la composición de la cubierta comprende gelatina y un polímero dependiente del pH que comprende pectina y goma gellan, en donde la composición de la cubierta no se rompe a un pH inferior a 8.4, inferior a 8.4, inferior a 8.3, inferior a 8.1, inferior a 8.0, inferior a 7.9, inferior a 7.8, inferior a 7.7, inferior a 7.6, inferior a 7.5, inferior a 7.4, inferior a 7.3, inferior a 7.2, inferior a 7.1, inferior a 7.0, inferior a 6.9, inferior a 6.8, inferior a 6.7, inferior a 6.6, inferior a 6.5, inferior a 6.4, inferior a 6.3, inferior a 6.2, inferior a 6.1, inferior a 6.0, inferior a 5.9, inferior a 5.8, inferior a 5.7, inferior a 5.6, inferior a 5.5, inferior a 5.4, inferior a 5.3, inferior a 5.2, inferior a 5.1, inferior a 5.0, inferior a 4.9, inferior a 4.8, inferior a 4.7, inferior a 4.6, inferior a 4.5, inferior a 4.4, inferior a 4.3, inferior a 4.2, inferior a 4.1, inferior a 4.0, inferior a 3.9, inferior a 3.8, inferior a 3.7, inferior a 3.6, inferior a 3.5, inferior a 3.4, inferior a 3.3, inferior a 3.2, inferior a 3.1, inferior a 3.0, inferior a 2.9, inferior a 2.8, inferior a 2.7, inferior a 2.6, inferior a 2.5, inferior a 2.4, inferior a 2.3, inferior a 2.2, inferior a 2.1, inferior a 2.0, inferior a 1.9, inferior a 1.8, inferior a 1.7, inferior a 1.6, inferior a 1.5, inferior a 1.4,

inferior a 1.3 or inferior a 1.2 durante un período de tiempo de 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos, 60 minutos, 90 minutos o 120 minutos cuando se mide con un Aparato USP II con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio.

- 5 **23.** Un proceso para preparar una cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-22 caracterizado porque comprende los pasos de:

preparar un material de relleno que comprende un agente activo; y

- 10 encapsular el material de relleno con una composición de cubierta, en donde la composición de la cubierta comprende gelatina y un polímero dependiente del pH que comprende pectina y goma gellan, en donde la composición de la cubierta no se rompe a un pH de 4 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato II de la USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

- 15 **24.** El proceso de conformidad con la reivindicación 23, caracterizado porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de 5 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato USP II con paletas a 50 RPM, 900 ml medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

- 20 **25.** El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 23-24, caracterizado porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 5 y 6 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato II de USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

- 25 **26.** El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 23-25, caracterizado porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 6 y 7 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato II de la USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

- 27.** El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 23- 26, caracterizado porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 7 y 8 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato USP II con paletas a 50 RPM, 900 ml medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

- 30 **28.** El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 23-27, caracterizado porque la composición de la cubierta no se rompe a un pH de entre 8 y 8.4 a los 15 minutos, 30 minutos, 45 minutos o 60 minutos cuando se mide con un Aparato II de USP con paletas a 50 RPM, 900 ml de medio ácido HCL 0.1 N ajustado a pH con solución amortiguadora de fosfato.

29. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 23-28, caracterizado porque comprende además preparar la composición de la cubierta.

30. El proceso de conformidad con la reivindicación 29, caracterizado porque la preparación comprende mezclar la gelatina, la pectina y la goma gellan para formar una masa de gel húmedo.

5 **31.** El proceso de conformidad con la reivindicación 30, caracterizado porque la preparación comprende además formar una cinta de composición de cubierta a partir de la masa de gel húmedo.

32. El proceso de conformidad con la reivindicación 31, caracterizado porque la cinta de composición de la cubierta tiene un grosor que oscila entre alrededor de 0.0508 cm (0.020 pulgadas) y alrededor de 0.127 cm (0.050 pulgadas).

10 **33.** El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 23-32, caracterizado porque comprende además secar la cápsula de gelatina blanda de liberación retardada.

34. Un método para ajustar el perfil de disolución dependiente del pH de la cápsula de gelatina blanda de liberación retardada, que consta de un material de relleno encapsulado en una composición de cubierta, de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-22, el método
15 caracterizado porque comprende ajustar la cantidad de al menos uno de gelatina, pectina y goma gellan en la composición de la cubierta para alcanzar un perfil de disolución objetivo dependiente del pH en un intervalo de pH de alrededor de 1.2 a alrededor de 8.4.

35. Un método para tratar, prevenir o mejorar una afección caracterizado porque comprende administrar a un sujeto que lo necesite la cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de
20 acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-22 o una cápsula de gelatina blanda de liberación retardada preparada mediante el proceso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 23-33.

36. Un método para administrar un agente activo a una ubicación objetivo dentro del tracto gastrointestinal, el método caacterizado porque comprende administrar a un sujeto la cápsula de gelatina blanda de liberación retardada de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-22 o una
25 cápsula de gelatina blanda de liberación retardada preparada mediante el proceso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 23-33,

en donde la composición de cubierta de la cápsula de gelatina blanda de liberación retardada se disuelve/desintegra en un pH de la ubicación objetivo en hasta alrededor de 120 minutos, en hasta alrededor de 90 minutos, en hasta alrededor de 60 minutos, en hasta alrededor de
30 30 minutos, o en hasta alrededor de 15 minutos, y

en donde la composición de la cubierta de la cápsula de gelatina blanda de liberación retardada no se disuelve/desintegra o no se disuelve/desintegra sustancialmente en un pH que es más bajo que el pH de la ubicación objetivo en hasta aproximadamente 120 minutos, en hasta

alrededor de 90 minutos, en hasta alrededor de 60 minutos, en hasta alrededor de 30 minutos o en hasta alrededor de 15 minutos.

5

10

15

20

25

30

35