



H U 0 0 0 2 2 6 9 6 3 B 1

(19) **HU****MAGYAR KÖZTÁRSASÁG**  
**Magyar Szabadalmi Hivatal**(11) Lajstromszám: **226 963**(13) **B1**

## SZABADALMI LEÍRÁS

(21) A bejelentés ügyszáma: **P 02 02260**(22) A bejelentés napja: **2000. 06. 30.**(40) A közzététel napja: **2002. 11. 28.**(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi  
Közlöny és Védjegyértesítőben: **2010. 03. 29.**(51) Int. Cl.: **A61K 9/28** (2006.01)**C08K 3/34** (2006.01)**C08K 5/092** (2006.01)**C08K 5/053** (2006.01)

(86) A nemzetközi (PCT) bejelentési szám:

**PCT/US 00/40287**(87) A nemzetközi közzétételi szám: **WO 0104195**

(30) Elsőbbségi adatok:

**09/351,076 1999. 07. 09. US**

(72) Feltalálók:

**Jordan, Martin Philip, Orpington, Kent (GB);****Taylor, James, Cobham, Kent (GB)**

(73) Jogosult:

**BPSI Holdings, Inc., Wilmington, Delaware (US)**

(74) Képviselő:

**Ravadiits Imre, DANUBIA Szabadalmi és****Védjegy Iroda Kft., Budapest**(54) **Száraz filmbevonó összetétel és eljárás hordozók bevonására ennek alkalmazásával**

(57) Kivonat

A találmány tárgya gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok bevonására szolgáló száraz filmbevonó összetétel, melyre jellemző, hogy az összetétel tömegére vonatkoztatva 25–55% poli(vinil-alkohol)-t, lágyítóként polietilénlikolt vagy glicerint, és az összetétel tömegére vonatkoztatva 9–45% talkumot tartalmaz.

A találmány második tárgya eljárás hordozók, mint például gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők,

élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok és hasonlóak filmbevonására, oly módon, hogy egy vizes bevonódiszperzió képzéséhez a találmány szerinti bevonó összetétel komponenseit vízben elkeverik; a szubsztrátumokra filmbevonat képzéséhez hatásos mennyiségű bevonó összetételt visznek fel és a szubsztrátumokon a filmbevonatot megszáritják.

**HU 226 963 B1**

A találmány hordozók, mint például gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok és hasonló vízbevonására vonatkozik, különös tekintettel a hordozók bevonására poli(vinil-alkohol)-alapú bevonattal.

Poli(vinil-alkohol) (PVA) filmbevonatként való alkalmazását már korábban javasolták. A gyakorlati alkalmazást azonban gátolta azon polimerfajták ragadósága, melyek hideg vízben gyorsan oldódnak, lehetővé téve gazdaságos alkalmazásukat a vízbevonat eljárásban.

A Colorcon itt hivatkozott 08/466 939 számú amerikai szabadalmi bejelentése (jelenleg 5 885 617 számú szabadalmi irat) gyógyszer-tablettákhoz való nedvességzáró filmbevonó összetételt ismertet, ami poli(vinil-alkohol)-t, lecitint, és adott esetben folyásjavítót, és/vagy színezőanyagot, és/vagy szuszpendálószer tartalmaz. Ezt a bevonó összetételt a Colorcon (West Point, PA) OPADRY AMB védjeggyel árusítja.

Az OPADRY AMB filmbevonó összetétel kiváló nedvességzáró filmbevonatot képez. A PVA ragadósága következtében a gyógyszer-tabletták szórással való bevonásának sebessége 12 kg tablettát tartalmazó, 60,96 cm-es (24") edénnyel felszerelt O'Hara Lab Coat I bevonóberendezésben, OPADRY AMB-ből készített vízbevonó oldatot/diszperziót alkalmazva, kicsi (körülbelül 25–30 gramm/perc, összehasonlítva a más típusú bevonórendszerekkel, melyek 50–70 gramm/perc sebességgel szórhatóak). Míg a kis szórási sebesség hátrányos, ezt a hátrányt ellensúlyozza az OPADRY AMB bevonó összetétel nedvességzáró tulajdonsága olyan speciális alkalmazások esetében, ahol a gyógyszer-tabletta bevonásához nedvességzáró filmbevonatra van szükség.

Általános alkalmazási célokra (vagyis amikor nincs szükség nedvességzáró tulajdonságra) a kis szórási sebesség az azzal járó járulékos költségek miatt nem elfogadható.

A polietilénlikol ismert lágyító, melyet a filmbevonatokban alkalmaznak a filmképző polimer üvegesedési hőmérsékletének csökkentésére, valamint a polimer ridegségének csökkentésére. Polietilénlikol alkalmazása a bevonórendszerben várhatóan ragadósabbá teszi a bevonórendszert, mint azt a Williams–Landel–Ferry egyenlet előre megjósolja. Ennek megfelelően polietilénlikol poli(vinil-alkohol)-hoz adagolása, ami már önmagában nagyon ragadós, várhatóan még ragadósabbá teszi a bevonórendszert, ezzel még rosszabbá téve a PVA ragadóságának problémáját.

A szakemberek azt is felismerték, hogy polietilénlikol adagolása a bevonórendszerhez csökkenti a filmbevonat szakítószilárdságát. A kisebb szakítószilárdság gyengébb filmet jelent, ami hátrányos.

Szakember számára várhatóan a polietilénlikol veszélyezteti a PVA filmbevonat nedvességzáró tulajdonságát.

Oldhatatlan anyagokat, például pigmenteket, csúsztatókat és folyásjavítókat rendszerint alkalmaznak a filmbevonó összetételekben. Például pigmentet használnak a filmbevonat színezésére, talkumot

csúsztatóként és töltőanyagként alkalmaznak a filmbevonó összetétel egyéb, költséges összetevői százalékos arányának csökkentésére. Oldhatatlan anyagok alkalmazása filmbevonó összetételben nem lehet ötletszerű, mivel, mint azt a terület szakértői felismerték, oldhatatlan anyagok adagolása filmbevonó összetételhez jellemzően csökkenti a filmbevonat szakítószilárdságát, ami azt jelenti, hogy az oldhatatlan anyagok filmbevonó rendszerbeli mennyiségének növelésével gyengébb filmhez jutunk.

Keith *et al.* 4 432 965 számú amerikai szabadalmukban nyújtott hatóanyag-leadású orális adagolási formát ismertetnek, mely tablettamagot tartalmaz, ami gyógyászatiilag hatásos mennyiségben tartalmaz kinit, ami nyújtott hatóanyag-leadású polimer bevonórendszerrel van bevonva, ami 5–20 tömeg% polietilénlikolt és 80–95 tömeg% poli(vinil-alkohol)-t tartalmaz. Keith *et al.* 4 432 965 számú amerikai szabadalmukban ismertetik, hogy poli(vinil-alkohol) és polietilénlikolt tartalmazó nyújtott hatóanyag-leadású bevonatuk lassan oldódik a gyomor- és bélnedvekben.

A találmány feladata volt, hogy poli(vinil-alkohol)-alapú, sima felületű, fényes, minimális ragadóságú, jó filmtapadású, és jó szakítószilárdságú bevonatot szolgáltatson.

A találmány másik feladata volt, hogy olyan poli(vinil-alkohol)-alapú filmbevonatot szolgáltatson, ami a hordozó, mint például gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok és hasonló felületére szórható, 55–60 gramm/perc bevonó folyadékszórási sebességgel. A találmány feladata volt továbbá, hogy gyorsan oldódó filmbevonatot biztosítson. Az itt ismertetett találmányunk ezeket és más célokat is megvalósít.

A találmánynak megfelelően a gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok és hasonló bevonására alkalmazandó találmány szerinti filmbevonó összetétel 1) poli(vinil-alkohol)-t, 2) lágyítót, például polietilénlikolt vagy glicerint, és 3) talkumot tartalmaz.

Előnyösen, a találmány szerinti száraz filmbevonó összetétel egyet vagy többet tartalmaz a következő összetevők közül: pigment/opacitásnövelők és lecitin.

A találmánynak megfelelően, a hordozó, például gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok és hasonló, filmbevonására szolgáló eljárás szerint a 1) poli(vinil-alkohol)-t, 2) lágyítót, például polietilénlikolt vagy glicerint és 3) talkumot vízbe keverjük a vízbevonódiszperzió kialakításához; a bevonódiszperzió megfelelő mennyiségben való alkalmazásával filmbevonat képzünk a hordozón, és a filmbevonatot megszáritjuk a hordozón. Adott esetben, de előnyösen, egyet vagy többet a következő összetevők közül a vízbe keverünk a poli(vinil-alkohol)-lal, a lágyítóval és a talkummal a találmány szerinti bevonódiszperzió kialakításához: pigment/opacitásnövelő és lecitin.

A találmány magában foglalja a vízbevonódiszperziót, a bevont hordozót, például a bevont gyógyszer-tablettákat, a bevont táplálkozási kiegészítőket, a

bevont élelmiszereket, a bevont cukrászati formákat, a bevont mezőgazdasági magokat és hasonlókat is, és a találmány szerinti száraz bevonó összetétel előállítási eljárását.

A poli(vinil-alkohol) (PVA) a bevonat filmképzője. A találmányban hasznosnak talált poli(vinil-alkohol) típusa megfelel annak a poli(vinil-alkohol)-nak, ami olyan részben hidrolizált poli(vinil-acetát)-ot tartalmaz, melynek hidrolízisszázaléka nagyobb, mint 86,5 mol%, és előnyösen a 86,5–89,0 mol% között van.

Előnyösen a poli(vinil-alkohol) mikronizált, hogy a vizes bevonóoldat készítése során megkönnyítse a poli(vinil-alkohol) oldódását a vízben. Előnyösen a mikronizált poli(vinil-alkohol) részecskemérete a következő mennyiségekbe és mesh méretekre esik: 47,8% nagyobb, mint 200 mikrométer 28,7% 200 és 145 mikrométer közötti, 22,9% 145 és 100 mikrométer közötti, 0,5% 100 és 80 mikrométer közötti, és 0,1% kisebb, mint 80 mikrométer.

A polietilén-glikol lágyító, ami a találmány szerinti bevonatot kevésbé törékeny és kevésbé repedékeny teszt. A hasznosnak talált polietilén-glikol névleges molekulatömege nagyobb, mint 1000; a 3000-nél nagyobb molekulatömegű polietilén-glikol az előnyös.

A glicerín, egy másik lágyító, helyettesítheti a polietilén-glikolt. Nem várt módon azt tapasztaltuk, hogy ahelyett, hogy a filmbevonat ragadosságát növelte volna, mint az várható volt, a glicerín, amikor a találmány szerinti bevonó összetételben alkalmaztunk, csökkentette a kapott filmbevonat ragadosságát, mivel enyhe ragadósságcsökkenésként viselkedett.

A talkum csúsztatószer, és javítja a végső bevonat simaságát, mivel a talkum segíti a tabletták egymáson való átgördülését a bevonás során. Nem várt módon, a talkum 9 és 45% közötti mennyiségben, előnyösen 9 és 20% közötti mennyiségben, előnyösebben 10%-ban (a bevonat tömegére vonatkoztatva) növeli a bevonat szakítószilárdságát, ami erősebb filmet eredményez. Ez nagyon meglepő, mivel az várható, hogy a filmbevonat összetételben az oldhatatlan összetevő, például a talkum, mennyiségének növekedésével a filmbevonat szakítószilárdsága csökken.

A pigment/opacitásnövelő lehet bármely élelmiszeriparban jóváhagyott festék, opacitásnövelő, vagy színezék. Például a pigment/opacitásnövelő lehet „aluminium lake” színezék, vas-oxidok, titán-dioxid, vagy természetes színezékek. Példák az ilyen pigmentek/opacitásnövelőkre a Colorcon 4 543 370 számú (1985. szeptember 24-én) szabadalmában találhatók, melyre itt hivatkozunk.

A lecitinragadósság csökkentő. Azt tapasztaltuk, hogy: a lecitin felületaktív anyagként is viselkedik, segíti a vizes bevonó diszperz összetevőinek nedvesítését; a lecitin segíti a poli(vinil-alkohol) szolvatálását; a lecitin lágyítóként is hat, mivel a bevonatba nedvességet zár, így a bevonat flexibilis marad, nem válik törékeny.

Az egyes összetevők mennyisége tömeg%-ban a találmány szerinti száraz bevonó összetételben a következő:

| Összetevő                         | Elfogadható mennyiség (%) | Előnyös mennyiség (%) |
|-----------------------------------|---------------------------|-----------------------|
| Poli(vinil-alkohol)               | 25–55                     | 38–46                 |
| Polietilén-glikol (vagy glicerín) | 5–30                      | 10–25                 |
| Talkum                            | 9–45                      | 9–20                  |
| Pigment/opacitásnövelő            | 0–40                      | 20–30                 |
| Lecitin                           | 0–10                      | 0–4                   |

A következő példák illusztrálják a találmányt. A példákban minden egység és százalék tömegre vonatkozik.

#### 1. példa

A következő készítmény száraz összetevőit száraz pormalomban, – például PK keverő – keverjük össze 25 percig, vagy addig, amíg homogén elegyhez jutunk, ami a találmány szerinti száraz filmbevonat egyik készítményét eredményezi.

Adott esetben, a találmány szerinti száraz filmbevonó összetétel bolygókeverővel, mint például Hobart bolygókeverővel granulálható. Miután a száraz filmbevonó összetételt a keverőbe töltöttük, és a keverőt bekapcsoltuk, a megfelelő mennyiségű vizet lassan adagoljuk mindaddig, amíg az összetétel enyhén tapadó granulátumot képez. A granulátumot 1-2 mm-es szitán juttatjuk keresztül, majd 30 °C-os kemencében addig szárítjuk, míg a nedvességtartalom kisebb lesz, mint 5%. Az összetételt ekkor ismét 1-2 mm-es szitán átrostáljuk, ami után pormentes granulátum formában felhasználásra alkalmas. Ha nem granuláljuk, az összetétel örölhető például kalapácsos törőben (Apex Machinery, Dartford, Anglia). A granulálás más módszerei, például porlasztva granulálás és hengerlése tömörítés alkalmazható.

A találmány szerinti (20% szilárdanyag-tartalmú) bevonódiszperzió kialakításához az eredményül kapott filmbevonat összetétel 300 grammját 1200 gramm desztillált vízbe diszpergáljuk, és ennek a diszperzióknak 1500 grammját a találmány szerinti bevonat tablettákra való kialakításához bevonóberendezés alkalmazásával 10 kg tablettára szórjuk, melyek elméleti tömegnövekedése 3%. A tablettákat 12–14 fordulat/perc forgási sebességgel forgatjuk a bevonóberendezésben. 60–70 °C-os forró levegőt alkalmazunk a szórt bevonatdiszperzióban lévő víz elpárologtatásához, és a tabletták 38–42 °C-on tartásához. A bevonás során a bevonódiszperzió szórási sebessége 60 gramm/perc.

A bevonóeljárás elvégzése után a tabletták sima felületűek, kiváló jelzésleolvashatósággal. A tabletták filmbevonata nagyon jó, hosszan tartó fényességgel, minimális ragadósággal, jó filmtapadással, és jó szakítószilárdsággal (körülbelül 10–15 MPa) rendelkeznek.

| Összetevő           | Százalék | Gramm |
|---------------------|----------|-------|
| Poli(vinil-alkohol) | 44,00%   | 440,0 |
| Talkum              | 20,00%   | 200,0 |

Táblázat (folytatás)

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Pigment/opacitásnövelő | 20,15%   | 201,5  |
| PEG 3000               | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

A következő, 2–16. példákban az egyes készítmények összetevőit az 1. példához hasonlóan összekeverjük, bevonóoldatot készítünk belőle, és a tablettákon alkalmazzuk, hogy sima felületű, kiváló, hosszan tartó fényességű, minimális ragadósságú, jó filmtapadású és jó szakítószilárdságú, – jellemzően 10 és 16 MPa közötti – filmbevonatot kapjunk.

## 2. példa

| Összetevő           | Százalék | Gramm  |
|---------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol) | 44,00%   | 440,0  |
| Talkum              | 20,00%   | 200,0  |
| Titán-dioxid        | 20,15%   | 201,5  |
| PEG 3000            | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin             | 3,50%    | 35,0   |
|                     | 100,00%  | 1000,0 |

## 3. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 35,00%   | 350,0  |
| Talkum                 | 25,00%   | 250,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 29,00%   | 290,0  |
| PEG 3000               | 11,00%   | 110,0  |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

## 4. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 25,00%   | 250,0  |
| Talkum                 | 25,42%   | 254,2  |
| Pigment/opacitásnövelő | 27,08%   | 270,8  |
| PEG 3000               | 17,08%   | 170,8  |
| Lecitin                | 5,42%    | 54,2   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

## 5. példa

| Összetevő           | Százalék | Gramm |
|---------------------|----------|-------|
| Poli(vinil-alkohol) | 35,00%   | 350,0 |
| Talkum              | 35,00%   | 350,0 |

| Összetevő | Százalék | Gramm  |
|-----------|----------|--------|
| PEG 3000  | 20,00%   | 200,0  |
| Lecitin   | 10,00%   | 100,0  |
|           | 100,00%  | 1000,0 |

## 6. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,00%   | 440,0  |
| Talkum                 | 18,35%   | 183,5  |
| Pigment/opacitásnövelő | 20,15%   | 201,5  |
| PEG 3000               | 14,00%   | 140,0  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

## 7. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,00%   | 440,0  |
| Talkum                 | 20,00%   | 200,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 22,50%   | 225,0  |
| PEG 3000               | 10,00%   | 100,0  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

## 8. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,00%   | 440,0  |
| Talkum                 | 20,00%   | 200,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 20,00%   | 200,0  |
| PEG 3000               | 12,00%   | 120,0  |
| Lecitin                | 4,00%    | 40,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

## 9. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,65%   | 446,5  |
| Talkum                 | 20,00%   | 200,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 20,00%   | 200,0  |
| PEG 3000               | 15,35%   | 153,5  |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

## 10. példa

| Összetevő           | Százalék | Gramm |
|---------------------|----------|-------|
| Poli(vinil-alkohol) | 44,00%   | 440,0 |
| Talkum              | 20,00%   | 200,0 |

Táblázat (folytatás)

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Pigment/opacitásnövelő | 20,15%   | 201,5  |
| PEG 3000               | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

11. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,00%   | 440,0  |
| Talkum                 | 10,00%   | 100,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 30,15%   | 301,5  |
| PEG 3000               | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

12. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 46,00%   | 460,0  |
| Talkum                 | 18,00%   | 180,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 20,15%   | 201,5  |
| PEG 3000               | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

13. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 38,00%   | 380,0  |
| Talkum                 | 20,00%   | 200,0  |
| Pigment/opacitásnövelő | 26,15%   | 261,5  |
| PEG 3000               | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

14. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,00%   | 440,0  |
| Talkum                 | 10,15%   | 101,5  |
| Pigment/opacitásnövelő | 30,00%   | 300,0  |
| PEG 3000               | 12,35%   | 123,5  |
| Lecitin                | 3,50%    | 35,0   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

15. példa

| Összetevő              | Százalék | Gramm  |
|------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)    | 44,63%   | 446,3  |
| Talkum                 | 19,85%   | 198,5  |
| Pigment/opacitásnövelő | 20,00%   | 200,0  |
| PEG 3000               | 12,86%   | 128,6  |
| Lecitin                | 2,66%    | 26,6   |
|                        | 100,00%  | 1000,0 |

16. példa

| Összetevő                  | Százalék | Gramm  |
|----------------------------|----------|--------|
| Poli(vinil-alkohol)        | 47,65%   | 476,5  |
| Talkum                     | 19,67%   | 196,7  |
| Szójalecitin               | 6,33%    | 63,3   |
| Glicerín                   | 5,35%    | 53,5   |
| TiO <sub>2</sub>           | 2,31%    | 23,1   |
| FD & C Red 40 színezék*    | 15,08%   | 150,8  |
| FD & C Yellow 61 színezék* | 3,41%    | 34,1   |
| FD & C Blue 2 színezék*    | 0,20%    | 2,0    |
|                            | 100,00%  | 1000,0 |

\* A U. S. Food and Drug Administration kódszáma.

30 A fentebb említett készítmények száraz összetevőit megfelelő méretű élelmiszer-feldolgozó gépbe töltjük és 5 percig erőteljesen kevertetjük, amíg homogén lesz. 5 perc után a készítmény folyadék összetevőit (glicerín, lágyító) a feldolgozógépbe töltjük és további 3 percig folytatjuk a kevertetést a találmány szerinti száraz bevonó összetétel előállításához. A készítmény 90 grammját 360 gramm tisztított vízben diszpergáljuk és 45 percig kevertetjük a 20% szilárdanyag-tartalmú, szórásra alkalmas vizes bevonódiszperzió előállításához.

35 2,0 kg 0,95 cm-es (3/8") standard konkáv placebót és 1,0 kg hasonló átmérőjű, 0,324 g-os (5 grain) aszpirinmagot tartalmazó összesen 3,0 kg-os tablettatöltet a 4 keverőlappal és 6 csúszásgátló rúddal felszerelt 38,1 cm-es (15") O'Hara Labcoat I bevonóedénybe töltjük. A vizes bevonódiszperziót a tablettára szórjuk 1 Spraying System Gun 1/8 VAU SS és Masterflex digitális vezérlőpulttal, 1 7518-02 szivattyúfejes perisztaltikus szivattyú alkalmazásával. A bevonóeljárás során a porlasztó levegő 172 kPa (25 psi) nyomású, a mintázó levegő 241,3 kPa nyomású (35 psi), a bemenő levegő 70 °C-os, a kimenő levegő 48 °C-os marad, az edény sebessége 16 fordulat/perc, a bevonófolyadék adagolási sebessége 20 g/perc [ami megfelel 50–60 gramm/percnek a 60,96 cm-es (24") edénnyel felszerelt O'Hara Lab Coat I bevonóberendezésben], a teljes bevonási idő 22 perc. A tablettákon 3,0% elméleti szárazbevonattömeg-növekedéssel hozunk létre fémbevonatot, ami kiváló, hosszan tartó fénnel, minimális ragadós-

sággal, jó tapadással, és jó szakítószilárdsággal (körülbelül 10–15 MPa) rendelkeznek.

A találmány szerinti vizes bevonódiszperzió előállítható a találmány szerinti bevonó összetétel egyedi komponenseinek közvetlenül vízhez adagolásával, és összekeverésével.

Előnyösen, a bevonódiszperziót 10–30% szilárdanyag-tartalommal állítjuk elő.

A Williams–Landel–Ferry-egyenlet által előre jelzett szemben azt tapasztaltuk, hogy a találmányunk minimális ragadósságú filmbevonatot szolgáltat.

Azt tapasztaltuk, hogy a találmány szerinti vizes bevonódiszperzió alkalmazásával a bevonóoldat 60 gramm/perces [12 kg tablettát tartalmazó 60,96 cm-es (24") edény] szórási sebessége érhető el. Ez meglepő, mivel a területen jártas szakember számára ismert, hogy a ragadós polimerekhez ragadósságuk miatt kis szórási sebességre van szükség. Ennek megfelelően, a poli(vinil-alkohol)-hoz, ami nagyon ragadós polimer, várhatóan kis szórási sebességre lenne szükség. Például, a Colorcon PVA-alapú OPADRY AMB tartalmú bevonó összetételéből készült bevonóoldat az abban lévő PVA ragadóssága miatt kis szórási sebességet igényel [például 25–30 gramm/perc 12 kg tablettát tartalmazó 60,96 cm-es (24") edény].

A szakember számára ismert, hogy oldhatatlan anyagok, például pigmentek, csúsztatók, és folyásjavítók adagolása a filmbevonó összetételhez jellemzően csökkenti a filmbevonat szakítószilárdságát. Meglepő módon azt tapasztaltuk, hogy a csúsztatóként és töltőanyagként alkalmazott oldhatatlan talkum bevétele a találmány szerinti filmbevonó összetételbe 9–45% közötti, előnyösen 9–20% közötti, előnyösebben 10%-os mennyiségben a bevonó összetétel tömegére vonatkoztatva, és a találmány szerinti filmbevonó diszperzióba 9–45% közötti, előnyösen 9–20% közötti, előnyösebben 10%-os mennyiségben a filmbevonó diszperzió nemvizes összetevőinek tömegére vonatkoztatva, inkább növeli, mint csökkenti a filmbevonat szakítószilárdságát.

A találmánynak megfelelően a talkum olyan mennyiségben alkalmazható, ami csökkenti a PVA mennyiségét a filmbevonatban, ezáltal csökkentve a filmbevonó összetétel költségeit anélkül, hogy ez a filmbevonat szakítószilárdságának csökkenéséhez vezetne.

Azt is tapasztaltuk, hogy a találmány szerinti bevonat jó nedvességzáró tulajdonságú. Ez szintén meglepő, mivel a polietilénlikol és a hasonló hidrofíll lágyítók várhatóan a PVA nedvességzáró tulajdonságainak romlását eredményezik. Míg a hidroxipropilmetilcellulóz és polietilénlikolt tartalmazó OPADRY filmbevonó diszperzióból készült filmbevonat vízgőz-áteresztési sebessége körülbelül 40, és a polietilénlikolt nem tartalmazó OPADRY AMB összetételből készült filmbevonat vízgőz-áteresztési sebessége körülbelül 6, a találmány alapján készült filmbevonat vízgőz-áteresztési sebessége körülbelül 10.

Továbbá a Keith *et al.* 4 432 965 amerikai szabadalmának tapasztalataival szemben azt tapasztaltuk, hogy a találmány szerinti filmbevonattal bevont tabletták gyorsan oldódnak.

## SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Gyógyszertabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok bevonására szolgáló száraz filmbevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy az összetétel tömegére vonatkoztatva 25–55% poli(vinil-alkohol)-t, lágyítóként polietilénlikolt vagy glicerint, és az összetétel tömegére vonatkoztatva 9–45% talkumot tartalmaz.
2. Az 1. igénypont szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy a poli(vinil-alkohol) részlegesen hidrolizált poli(vinil-acetát)-ot tartalmaz, amely több, mint 86,5 mol%-ban, előnyösen 86,5–89,0 mol%-ban hidrolizált.
3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy a poli(vinil-alkohol) mennyisége 25–55%, előnyösen 38–46%, az összetétel tömegére vonatkoztatva.
4. Az 1–3. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy a polietilénlikol-molekulatömege 400–20 000, előnyösen 3000.
5. Az 1–4. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy a lágyító mennyisége 5–30%, előnyösen 10–25% az összetétel tömegére vonatkoztatva.
6. Az 1–5. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy a talkum mennyisége 9–20%, előnyösen 10% az összetétel tömegére vonatkoztatva.
7. Az 1–6. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy pigmentet/opacitásnövelőt tartalmaz.
8. A 7. igénypont szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy a pigment/opacitásnövelő mennyisége legfeljebb 40%, előnyösen 20–30% az összetétel tömegére vonatkoztatva.
9. Az 1–8. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy lecitint is tartalmaz.
10. A 9. igénypont szerinti bevonó összetétel, *azzal jellemezve*, hogy lecitin mennyisége legfeljebb 10%, előnyösen legfeljebb 4% az összetétel tömegére vonatkoztatva.
11. Folyékony filmbevonó diszperzió gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok bevonására, *azzal jellemezve*, hogy az 1–10. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel komponenseit és vizet tartalmaz.
12. Eljárás hordozók, mint például gyógyszer-tabletták, táplálkozási kiegészítők, élelmiszerek, cukrászati formák, mezőgazdasági magok és hasonló filmbevonására, *azzal jellemezve*, hogy
  - egy vizes bevonódiszperzió képzéséhez az 1–10. igénypontok bármelyike szerinti bevonó összetétel komponenseit vízben elkeverjük,
  - a szubsztrátumokra filmbevonat képzéséhez hatáskor mennyiségű bevonó összetételt viszünk fel,
  - a szubsztrátumokon a filmbevonatot megszáritjuk.