



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	954686
(51) Kv.1k.6 - Int.c1.6	
A 61K 31/135, 9/20, 9/48	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	02.10.95
(24) Alkupaivä - Löpdag	24.03.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	02.10.95
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/EP94/00949
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
03.04.93 DE 4310963 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Knoll Aktiengesellschaft, Knollstrasse, 67061 Ludwigshafen, Germany, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Kolter, Karl, Sachsenweg 12, 67117 Limburgerhof, Germany, (DE)
2. Fricke, Helmut, Pfalzring 159, 67112 Mutterstadt, Germany, (DE)
3. Buehler, Volker, Liebigstrasse 2, 76135 Karlsruhe, Germany, (DE)
4. Mueller-Peltzer, Herbert, Uferstrasse 36, 69120 Heidelberg, Germany, (DE)

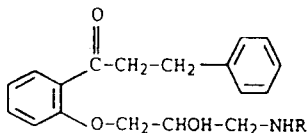
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Beta-fenyylipropiofenonijohdannaisia sisältävä retardmikrotabletti
Retardmikrotablett innehållande beta-fenylpropiofenonderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee lieriön muotoisia retardtabletteja, joilla on kupera tai tasainen ylä- ja alapuoli ja jotka sisältävät vaikuttavana aineena β-fenyylipropiofenonijohdannaisia, joilla on kaava (I)



(I)

jossa R on n-propyyli tai 1,1-dimetyyli-propyyli ja niiden farmakologisesti hyväksyttäviä suoloja, jolloin a) korkeus ja halkaisija ovat toisistaan riippumatta 1 - 3 mm, b) vaikutusainepitoisuus on 81 - 99,9 painoprosenttia mikrotablettista, ottamatta kuitenkaan huomioon mahdollisesti esiintyvän päällysteen painoa, c) vaikutusainetiheys on yli 1, d) USP:n Paddle-mallissa kierrosnopeuden ollessa 50 rpm on 3 tunnin kuluttua korkeintaan 80 % ja 24 tunnin kuluttua vähintään 80 % vaikuttavasta aineesta vapautunut, e) vapautumisnopeus on käytännöllisesti katsoen riippumaton tablettien puristusaineesta, ja f) tabletti ei sisällä mitään hidastavaa apuainetta, mutta 0,1 - 5 painoprosenttia liukuainetta ja 0 - 18,9 painoprosenttia muita tavanomaisia apuaineita, ja gelatiinikapselia, joka sisältää 3 - 200 tällaista tablettia, joissa vaikuttavan aineen

vapautumisnopeus on samanlainen tai erilainen, sekä menetelmää tablettien valmistamiseksi.

Uppfinningen avser retardtabletter i formen av en cylinder, vilka har en konvex eller slät övre och undre yta och vilka innehåller som det verkande ämnet β-fenylpropiofenonderivat med formeln (I), vari R är n-propyl eller 1,1-dimetylpropyl, och deras farmakologiskt godtagbara salter, varvid a) höjden och diametern är oberoende av varandra 1 - 3 mm, b) koncentrationen av den verkande beståndsdelens är 81 - 99,9 vikt-% av mikrotablettens, utan att ta i betraktande vikten av möjlig beläggning, c) den verkande beståndsdelens täthet är större än 1, d) efter tre timmar har högst 80 % och efter 24 timmar minst 80 % av den verkande beståndsdelens frigjorts vid användningen av USP Paddle-modellen då hastigheten är 50 rpm, e) frigörningshastigheten är praktiskt sätt oberoende av tablettens pressningstryck; och f) tablettens innehåller icke retarderande hjälpmedel, men 0,1 - 5 vikt-% glidämne och 0 - 18,9 vikt-% andra vanliga hjälpmedel och gelatinkapsel, som innehåller 3 - 200 sådana tabletter, vari den verkande beståndsdelens frigörningshastighet är den samma eller olika, och ett förfarande för framställningen av tablettarna.