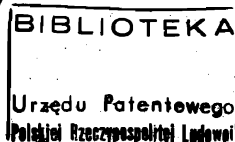




A61j 3/06



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 47372

Kl. 30 h, 9/02
Kl. internat. A 61 *5/06*

Tarchomińskie Zakłady Farmaceutyczne „Polfa“*)
Przedsiębiorstwo Państwowe

Warszawa, Polska

**Sposób wytwarzania powłoki na tabletkach, drażetkach, granulkach
i kapsułkach, odpornej na działanie soków żołądkowych**

Patent trwa od dnia 15 maja 1962 r.

Wynalazek dotyczy sposobu wytwarzania powłoki na tabletkach, drażetkach, kapsułkach i granulkach zawierających leki wrażliwe na działanie soków żołądkowych.

Jak wiadomo wiele leków jest nietrwałych w kwaśnym środowisku żołądka i dlatego przy stosowaniu ich np. w postaci tabletek muszą być zabezpieczone przed szkodliwym działaniem soków. Uzyskać to można powlekając tabletki odpowiednią powłoką nierozpuszczalną w soku żołądkowym, natomiast łatwo podlegającą rozszczepieniu w zasadowym środowisku jelit. Do wytwarzania takich powłok znalazły zastosowanie pochodne celulozy zwłaszcza ftalan acetylocelulozy. Związek ten nie nadaje się do zastosowania wprost, ponieważ tworzy on na tabletkach

powłokę sztywną, łatwo ulegającą pękaniu. W celu usunięcia tej niedogodności proponowano stosować różne substancje o charakterze plastyfikującym np. oleje roślinne, jak olej rycynowy, niepełne estry gliceryny z kwasami tłuszczowymi, zwłaszcza monostearynian gliceryny, ftalan dwuetylu oraz niektóre białka roślinne zwłaszcza zeinę.

Stwierdzono, że przy zastosowaniu ftalanu acetylocelulozy można otrzymać powłoki na tabletkach, kapsułkach itp., które w porównaniu z powłokami uzyskanymi według znanych sposobów wykazują szereg zalet takich jak sprężystość, gładkość oraz łatwość rozpadu tylko w pożądanym środowisku (w jelitach), jeżeli jako środek plastyfikujący zastosuje się pochodne estrów olejowych sorbitolu i jego bezwodników skondensowanych z polimerami tlenu etylenu, znanych jako Tweeny.

*) Właściciel patentu oświadczył, że twórcą wynalazku jest mgr Jerzy Laube.

W sposobie według wynalazku jako wspomniane pochodne stosuje się monostearynian polioksyetylenosorbitanu, monolaurynian polioksyetylenosorbitanu oraz monooleinian polioksyetylenosorbitanu w ilości 0,5—45% w stosunku do pozostałych składników powłoki, to jest ftalanu acetylocelulozy i acetonu (jako rozpuszczalnika). Najkorzystniej jest stosować monooleinian polioksyetylenosorbitanu znany jako Tween 80.

Dalszą korzyścią związaną ze stosowaniem Tweenów jest ułatwienie resorpcji leku do krwi z obiegu na skutek ich korzystnych właściwości powierzchniowo-czynnych i emulgujących.

Przykład. Przygotowane w znany sposób tabletki Erytromycyny (zasada nietrwała w środowisku kwaśnym) powleka się w bębnach drążowniczych mieszaniną, składającą się z 1 części wagowej ftalanu acetylocelulozy, 0,25 części wagowej Tweenu 80 i 8,75 części wagowych acetonu. Roztworem tym powleka się tabletki i suszy (na zmianę) tak długo, aż uzyska się około 10 do 20% przyrostu wagi tabletki. Tabletki odpowiednio do grubości warstwy powlekania

wykazują 3—4 godzinną odporność na działanie sztucznego soku żołądkowego zaś w soku jelitowym rozpadają się w ciągu 10—15 minut.

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania powłoki na tabletkach, drażetkach, granulkach i kapsułkach odpornej na działanie soków żołądkowych przy użyciu ftalanu acetylocelulozy jako środka powłokowego, znamieny tym, że stosuje się acetonowy roztwór ftalanu acetylocelulozy z dodatkiem 0,5—45% pochodnych estrów olejowych sorbitu i jego bezwodników skondensowanych z polimerami tlenku etylenu znanych jako Tweeny.
2. Sposób według zastrz. 1, znamieny tym, że stosuje się monooleinian polioksyetylenosorbitanu (Tween 80).

Tarchomińskie Zakłady
Farmaceutyczne „Polfa”
Przedsiębiorstwo Państwowe

Zastępca: mgr inż. Antoni Sentek
rzecznik patentowy