

①9 RÉPUBLIQUE FRANÇAISE
INSTITUT NATIONAL
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE
PARIS

①1 N° de publication :
(à n'utiliser que pour les
commandes de reproduction)

2 536 994

②1 N° d'enregistrement national :

82 20123

⑤1 Int Cl³ : A 61 K 9/10, 33/42.

①2

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

②2 Date de dépôt : 1^{er} décembre 1982.

③0 Priorité

④3 Date de la mise à disposition du public de la
demande : BOPI « Brevets » n° 23 du 8 juin 1984.

⑥0 Références à d'autres documents nationaux appa-
rentés :

⑦1 Demandeur(s) : GRIMBERG Georges Serge. — FR.

⑦2 Inventeur(s) : Georges Serge Grimberg.

⑦3 Titulaire(s) :

⑦4 Mandataire(s) : Madeuf.

⑤4 Composition pharmaceutique nouvelle à base de phosphate d'alumine.

⑤7 La composition pharmaceutique à base de phosphate d'alumine est caractérisée en ce que les particules de mucilage ou les particules équivalentes sont enrobées dans au moins une couche constituée par au moins un composant inerte vis-à-vis d'au moins un produit de la phase continue puis au moins un composant actif vis-à-vis d'au moins un produit de la phase continue sert au moins à enrober les particules de mucilage ou les particules équivalentes susmentionnées.

FR 2 536 994 - A1

D

La présente invention a pour objet une nouvelle composition pharmaceutique à base de phosphate d'alumine destinée à être dispersée dans une phase continue, cette nouvelle composition pouvant, par des formes diverses ou des adjonctions, présenter toujours un haut pouvoir de dispersion car les médicaments connus, à base de phosphate d'alumine, qui ont comme propriété d'être anti-acide, protecteur de la muqueuse oeso-gastro-duodénale, ne permettent pas d'obtenir un revêtement protecteur complet de la muqueuse et ne donnent pas entière satisfaction.

La présentation actuelle des compositions à base de phosphate d'alumine sont sous des formes différentes, par exemple en suspension, en granulés, en comprimés, en poudre, mais malgré ces différentes présentations on n'obtient pas le résultat recherché car la phase purement physique n'est pas toujours obtenue et la dispersion n'est pas bonne ce qui ne permet pas de bien tapisser les muqueuses.

C'est pourquoi la présente invention tend à remédier aux inconvénients ci-dessus en donnant une présentation du phosphate d'alumine sous une forme pulvérulente destinée à être dispersée dans une phase continue et notamment dans une phase aqueuse, ce qui permet non seulement d'obtenir une présentation pour enfants dont la répartition et l'absorption sont plus uniformes, mais également une facilité d'utilisation accrue sans longue préparation par les adultes.

Pour obtenir ce résultat on procède à une dispersion de la composition de phosphate d'alumine conforme à l'invention présentée sous différentes formes, cette dispersion étant effectuée de façon extemporanée.

Dans ce qui suit, on désigne par dispersion tous les corps composés d'au moins deux phases pharmaceutiquement utilisables, l'une des phases étant continue tandis que l'autre phase est discontinue et est répartie dans la première aussi uniformément que possible. Dans la présente invention, elle concerne des produits de base qui sont constitués par des particules de mucilage ou des particules équivalentes dans lesquelles le phosphate d'alumine mélangé et parfois associé

à ces particules se trouve au moment de cette dispersion noyé dans la masse en cours de gonflement dès que les particules de mucilage ou les particules équivalentes se trouvent en présence d'une solution aqueuse.

5 Conformément à l'invention, les particules de mucilage ou les particules équivalentes sont enrobées dans au moins une couche constituée par au moins un composant inerte vis-à-vis d'au moins un produit de la phase continue puis au moins un composant actif vis-à-vis d'au moins un produit de la
10 phase continue sert au moins à enrober les particules de mucilage ou les particules équivalentes susmentionnées.

Suivant une autre caractéristique de l'invention, lorsque la composition thérapeutique nouvelle constituée d'un mucilage enrobé et d'au moins un additif complémentaire
15 est mise dans une phase aqueuse ou une autre phase continue, on crée une dispersion au sein de laquelle les particules de phosphate d'alumine sont noyées entre les particules de mucilage de sorte qu'au moment de l'ingestion le phosphate d'alumine se trouve très largement dispersé et en une manière
20 uniforme.

Diverses autres caractéristiques de l'invention sont représentées à titre d'exemples non limitatifs.

On donne ci-après plusieurs exemples de la composition pharmaceutique nouvelle à partir du phosphate
25 d'alumine et d'un ou plusieurs composants actifs pouvant également renfermer des gélifiants, des édulcorants et des aromatisants.

EXEMPLE 1

Composition pharmaceutique ingérable :

30	- Phosphate d'alumine	1.000	g
	- Gomme de Guar en poudre	2.478	g
	- Huile de silicone	12,5	g
	- Mono-oléate de sorbitane	6,44	g
	- Polysorbate 80	3,22	g
35	- Silice micronisée	50,00	g
	- Sucre	6.000	g
	- Saccharinate de sodium	10	g

- Cyclamate de sodium 40 g
- Noix de coco (Arôme en poudre) 200 g

Lorsque le patient mélange le produit ainsi obtenu dans une phase aqueuse, la gomme de Guar se disperse puis se met à gonfler et au moment du gonflement emprisonne le phosphate d'alumine. Ce phénomène se poursuit in vivo.

On remarque que, dans cet exemple, la gomme de Guar peut être remplacée notamment par des alginates, de la gélatine, des gommes ou des celluloses.

Mais il est remarquable que le produit obtenu soit dans tous les cas de belle apparence, fabriqué rapidement et sans irrégularités. Il peut être aisément conditionné et conservé en récipients, en vue de la dispersion lors de l'utilisation ou transformé sous toute forme galénique convenable telle que comprimés, sachets, etc.

Dans tous les cas, si on disperse la présente composition en milieu liquide, de l'eau par exemple, quelles que soient les proportions entre le produit et l'eau, la répartition sera obtenue rapidement à froid, de façon homogène, sans appareillage spécial. La consistance du gel obtenu variera pour un produit donné, d'une part, avec le temps, d'autre part, avec la quantité relative de poudre et d'eau.

Il suffit pour cela d'opérer le mélange progressivement et de remuer ensuite ce mélange à l'aide d'une cuiller ou de la mesurette, qui a servi au dosage, jusqu'à un premier degré d'épaississement du gel.

EXEMPLE 2

Une composition pharmaceutique est pratiquement identique tant dans sa composition qualitative que dans sa composition quantitative mais on remplace la gomme de Guar en poudre par des particules de mucilage.

Dans la majorité des cas, il est ajouté à la composition, tant dans l'exemple 1 que dans l'exemple 2, un produit tensio-actif thérapeutiquement acceptable.

Le produit ainsi obtenu peut être utilisé comme anti-acide, protecteur de la muqueuse oeso-gastro-duodénale et contre le météorisme.

Il constitue donc une nouvelle forme galénique du phosphate d'alumine, principe actif connu en lui-même.

Les essais classiques réalisés sur ce produit permettent de constater que les propriétés bénéfiques du phosphate d'alumine ne sont pas diminuées et que cette nouvelle forme galénique présente de plus des avantages appréciables sur le plan de l'administration et de la tolérance.

REVENDEICATIONS

1 -Composition pharmaceutique à base de phosphate d'alumine, caractérisée en ce que les particules de mucilage ou les particules équivalentes sont enrobées dans au moins
 5 une couche constituée par au moins un composant inerte vis-à-vis d'au moins un produit de la phase continue puis au moins un composant actif vis-à-vis d'au moins un produit de la phase continue sert au moins à enrober les particules de mucilage ou les particules équivalentes susmentionnées.

10 2 - Composition pharmaceutique suivant la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle est constituée d'un mucilage enrobé et d'au moins un additif complémentaire puis est mise dans une phase aqueuse ou une autre phase continue. On crée ainsi une dispersion au sein de laquelle les particu-
 15 les de phosphate d'alumine sont noyées entre les particules de mucilage de sorte qu'au moment de l'ingestion le phosphate d'alumine se trouve très largement dispersé et d'une manière uniforme.

20 3 - Composition pharmaceutique suivant l'une des revendications 1 et 2, caractérisée en ce qu'elle comprend un ou plusieurs édulcorants et un ou plusieurs aromatisants.

4 - Composition pharmaceutique suivant l'une au moins des revendications 1 à 3, caractérisée en ce qu'elle contient au moins un produit actif qui est tensio-actif.

25 5 - Composition pharmaceutique suivant l'une au moins des revendications 1 à 4 , caractérisée en ce qu'elle contient :

	- Phosphate d'alumine	1.000	g
	- Gomme de Guar en poudre	2.478	g
30	- Huile de silicone	12,5	g
	- Mono-oléate de sorbitane	6,44	g
	- Polysorbate 80	3,22	g
	- Silice micronisée	50,00	g
	- Sucre	6.000	g
35	- Saccharinate de sodium	10	g
	- Cyclanate de sodium	40	g
	- Noix de coco (Arome en poudre)	200	g

6 - Composition pharmaceutique suivant l'une des revendications 1 à 5, caractérisée en ce qu'elle est appliquée en tant qu'anti-acide, protecteur de la muqueuse oeso-gastro-duodénale, et contre le météorisme.

5 7 - Composition pharmaceutique suivant l'une des revendications 1 à 6, caractérisée en ce qu'elle est utilisable sous différentes formes galéniques.