

(19) DANMARK

(10) DK 2009 00284 L



(12) PATENTANSØGNING

Patent- og
Varemærkestyrelsen

(51) Int.Cl.⁸: **C 07 D 307/87 (2006.01)**

(21) Patentansøgning nr: **PA 2009 00284**

(22) Indleveringsdag: **2009-02-27**

(24) Løbedag: **2006-06-22**

(41) Alm. tilgængelig: **2009-02-27**

(62) Stamansøgning nr: **PA 2008 00075**

(30) Prioritet: **2005-06-22 DK PA 2005 00912**

(71) Ansøger: **H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9, 2500 Valby, Danmark**

(72) Opfinder: **Robert James Dancer, Sønderkær 53, 2650 Hvidovre, Danmark**
Hans Petersen, Guldagervej 11, 2720 Vanløse, Danmark
Ole Nielsen, Nystedvej 19, 2500 Valby, Danmark
Michael Harold Rock, Risbjergvej 28, 2650 Hvidovre, Danmark
Ken Liljegren, Langkær Vænge 10, 3500 Værløse, Danmark
Helle Eliassen, Munkekærgård 9, 4600 Køge, Danmark

(54) Benævnelse: **Krystallinsk base af escitalopram og smeltetabletter indeholdende escitalopram base**

(57) Sammendrag:

Den foreliggende opfindelse angår en smeltetablet, der har en hårdhed på mindst 22 N og en oral desintegrationstid på mindre end 120 s, og som indeholder en aktiv farmaceutisk bestanddel adsorberet på et vandopløseligt fyldstof, hvor den aktive farmaceutiske bestanddel har et smeltepunkt i området 40-100 °C, såvel som en fremgangsmåde til fremstilling af en sådan smeltetablet.

Patentkrav

- 5 1. Smeltetablet, der har en hårdhed på mindst 22 N og en oral desintegrationstid på mindre end 120 s, og som omfatter en aktiv farmaceutisk bestanddel adsorberet på et vandopløseligt fyldstof, ét eller flere desintegrationsmidler og eventuelt yderligere vandopløseligt fyldstof, hvor den aktive farmaceutiske bestanddel har et smeltepunkt i området 40-100 °C.
- 10 2. Smeltetablet ifølge krav 1, k e n d e t e g n e t ved, at den aktive farmaceutiske bestanddel har et smeltepunkt i området 40-90 °C.
- 15 3. Smeltetablet ifølge krav 1 eller 2, k e n d e t e g n e t ved, at den aktive farmaceutiske bestanddel er valgt fra gruppen bestående af escitalopram, ethosuximid, trimethadion, chlorambucil, disulfiram, fenofibrat, guaifenesin, lomustin, carisoprodol og perphenazin.
- 20 4. Smeltetablet ifølge krav 3, k e n d e t e g n e t ved, at den aktive farmaceutiske bestanddel er escitalopram.
- 25 5. Smeltetablet ifølge et hvilket som helst af kravene 1-4, k e n d e t e g n e t ved, at det vandopløselige fyldstof er valgt fra gruppen bestående af monosaccharider, disaccharider, sukkeralkoholer og polysaccharider.
- 30 6. Smeltetablet ifølge krav 5, k e n d e t e g n e t ved, at det vandopløselige fyldstof er valgt fra gruppen bestående af mannitol, sorbitol, glucose, mannose og lactose.
- 35 7. Smeltetablet ifølge et hvilket som helst af kravene 1-6, k e n d e t e g n e t ved, at den har en hårdhed på mindst 22 N.
8. Smeltetablet ifølge et hvilket som helst af kravene 1-7, k e n d e t e g n e t ved, at den har en oral desintegrationstid på mindre end 60 s.
9. Smeltetablet ifølge et hvilket som helst af kravene 1-8, k e n d e t e g n e t ved, at desintegrationsmidlerne er valgt fra gruppen bestående af mikrokrySTALLINSK cellulose, natriumstivelsesglycolat, croscarmellose-natrium, crospovidon og povidon.

10. Smeltetablet ifølge et hvilket som helst af kravene 1-9, k e n d e t e g n e t ved, at den har en slidstyrke på ikke mere end 1 %.
- 5 11. Fremgangsmåde til fremstilling af en smeltetablet ifølge et hvilket som helst af kravene 1-10, der omfatter:
- 10 a) blanding af det vandopløselige fyldstof og den aktive farmaceutiske bestanddel ved en temperatur over, omkring eller lidt under den aktive farmaceutiske bestanddels smeltepunkt, hvorved den aktive farmaceutiske bestanddel adsorberes på det vandopløselige fyldstof;
- 15 b) efterfulgt af afkøling til en temperatur under 40 °C;
- c) blanding af blandingen af den aktive farmaceutiske bestanddel og det vandopløselige fyldstof med ét eller flere desintegrationsmidler og eventuelt andre hjælpestoffer og
- d) presning af blandingen til tabletter med en hårdhed på mindst 22 N.