

A 61 K 9

Ans.nr.: 3652/82

Indleveret: 13 aug 1982

Løbedag: 13 aug 1982

Alm. tilgængelig: 14 feb 1984

Prioritet: -

A/S ALFRED *BENZON; København, DK.

**Opfinder: Stig *Roswall; DK, Lene Birgitte
*Thorhus; DK.**

**Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbu-
reau**

**Fremgangsmåde til fremstilling af et kombi-
nationspræparat**

SAMMENDRAG

3652-82

Et farmaceutisk oralt polydepotpræparat med forsinket afgivelse fremstilles ved, at individuelle enheder, som omfatter et aktivt stof, og som er overtrukket med et i det væsentlige vanduopløseligt, men vanddiffunderbart overtræk, der betinger en kontrolleret afgivelse, blandes med partikler af et aktivt stof, hvis gennemsnitsstørrelse er mindst én tierpotens mindre end de overtrukne enheder under betingelser, der resulterer i, at de mindre partikler adhærer til overfladen af overtrækket i et i det væsentlige ensartet lag. De overtrukne enheder har en gennemsnitsstørrelse på ca. 0,1-1,5 mm, og de fine partikler har en gennemsnitsstørrelse på ca. 1-50 µm og findes i præparatet i en mængde på ikke mere end 25 vægtprocent, fortrinsvis ikke mere end ca. 10 vægtprocent og især ikke mere end ca. 5 vægtprocent, og fortrinsvis ikke mere end 1 vægtprocent beregnet ud fra vægten af de overtrukne enheder. Blandingen udføres i nærværelse af et antiadhæsiv, som modvirker elektrostatisk opladning, såsom talkum eller colloiddt siliciumdioxid. Det aktive stof, der afgives kontrolleret, kan fx være kaliumchlorid, medens det hurtigt udløsende aktive stof fx kan være et diuretikum. Overtrækket, der betinger en kontrolleret afgivelse, indeholder et filmdannende polymerstof såsom Eudragit® E 30 D, en blødgører og et hydrofobt stof.

Ved denne fremgangsmåde er det blevet muligt at kombinere et aktivt stof, som det af forskellige årsager foretrækkes at administrere i et polydepotpræparat med kontrolleret afgivelse, fx fordi det virker irriterende på maveslimhinden, eller fordi det har en relativt kort halveringstid, med et hurtigt udløsende aktivt stof til et kombinationspræparat, hvorved doseringsregimen forenkles og patientefterlevelsen således forbedres.