



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 46404

Kl. 30 h, 9/02
Kl. internat. A 61 k

Farmaceutyczna Spółdzielnia Pracy „Isopharm“*)

Warszawa, Polska

Sposób powlekania tabletek farmaceutycznych powłoką nierozpuszczalną w soku żołądkowym

Patent trwa od dnia 10 listopada 1961 r.

Przedmiotem wynalazku jest sposób powlekania tabletek farmaceutycznych nierozpuszczalną w soku żołądkowym powłoką z ftalanu acetylocelulozy, plastyfikowanego olejem rybnym i zawierającego równocześnie emulgator.

Znane sposoby powlekania tabletek za pomocą lakierów lub syropów opartych na żywicach naturalnych, jak sandaraka, mastyka lub szlak, nie zabezpieczają tych preparatów, działających skutecznie jedynie w alkalicznym środowisku dwunastnicy i jelit, przed niekorzystnym działaniem kwaśnego soku żołądkowego.

Powłoki z żelatyny zdenaturowanej alkoholowym roztworem kałafonii spełniają warunek odporności na kwaśne środowisko soków

żołądkowych, lecz równocześnie ich grubość jest nierównomierna, w wyniku czego część tabletek pokryta grubszymi powłokami pozostaje po zażyciu nierozpuszczona.

Ponadto sposoby wytwarzania powłok z wymienionych materiałów są na ogół uciążliwe i długotrwałe, wymagając na przykład obróbki jednej szarży tabletek przez okres trwający do 3 dni.

Wymaganą odporność na działanie soku żołądkowego przy równoczesnej łatwości rozpuszczania się w alkalicznym środowisku dwunastnicy i jelit wykazują powłoki, składające się z ftalanu acetylocelulozy plastyfikowanego ftalanem dwuetylowym. Plastyfikator ten okazał się jednak toksyczny, gdyż poraża system nerwowy (The Extra Pharmacopoea). Natomiast znane powłoki tabletek wytwarzane z ftalanu acetylocelulozy plastyfikowanego olejem rybnym lub innym olejem roślinnym, albo też

*) Właściciel patentu oświadczył, że współtwórcami wynalazku są mgr Piotr Liberski, mgr Marian Borówka i mgr Jerzy Surowiecki.

z ftalanu acetylocelulozy plastyfikowanego niepełnymi estrami gliceryny i kwasów tłuszczowych, służą zasadniczo do zamaskowania przykrego smaku i poprawienia wyglądu tabletek, ponieważ zarówno w wodzie jak i w soku żołądkowym ulegają bardzo szybkiemu rozprowadzeniu i podobnie jak powłoki z samego ftalanu acetylocelulozy nie zapewniają dostatecznej odporności tabletek na sok żołądkowy.

Stwierdzono, że powłokę opartą na ftalanie acetylocelulozy można uodpornić na działanie soku żołądkowego, jeżeli jako plastifikator ftalanu acetylocelulozy zastosowuje się olej rycynowy łącznie z niepełnymi estrami gliceryny i kwasów tłuszczowych, zwłaszcza z monostearynianem gliceryny, które równocześnie spełniają rolę emulgatora.

Optymalny rezultat uzyskuje się, gdy zawartość oleju rycynowego czystego wynosi 0,5 — 3% wagowych, a zawartość emulgatora 3 — 10% wagowych w stosunku do roztworu ftalanu acetylocelulozy. Uzyskana przy tym powłoka jest całkowicie nietoksyczna, wytrzymuje działanie soku żołądkowego przez okres ponad 3 godziny, a w środowisku alkalicznym bardzo łatwo ulega rozprowadzeniu niezależnie od grubości nałożonej warstwy. Ponadto odznacza się ona estetycznym wyglądem.

Sposób przygotowania powłoki na tabletki według wynalazku polega na rozprowadzeniu osobno ftalanu acetylocelulozy w acetonie oraz emulgatora w alkoholu etylowym i następnym zmieszaniu obu roztworów, po czym do tak

otrzymanej mieszaniny dodaje się olej rycynowy i starannie miesza w temperaturze pokojowej. Tak przygotowanym roztworem natryskuje się następnie tabletki umieszczone w bębnie, przy czym całkowity proces powlekania trwa 3 — 5 godzin.

Przykład. Skład lakieru do powlekania tabletek farmaceutycznych jest następujący:

Ftalan acetylocelulozy	10,0 części wagowych
Monostearynian gliceryny	5,0 części wagowych
Olej rycynowy czysty	2,0 części wagowe
Aceton	63,0 części wagowych
Alkohol etylowy (spirytus)	20,0 części wagowych

Zastrzeżenie patentowe

Sposób powlekania tabletek farmaceutycznych powłoką nierozpuszczalną w soku żołądkowym opartą na plastyfikowanym ftalanie acetylocelulozy, znamieny tym, że jako plastifikator ftalanu acetylocelulozy stosuje się olej rycynowy łącznie z niepełnymi estrami gliceryny i kwasów tłuszczowych, zwłaszcza z monostearynianem gliceryny, które równocześnie spełniają rolę emulgatora, przy czym olej rycynowy stosuje się w ilości 0,5 — 3%, zaś emulgator w ilości 3 — 10% wagowych w stosunku do roztworu ftalanu acetylocelulozy

Farmaceutyczna Spółdzielnia
Pracy „Isopharm”

Zastępca: inż. Zbigniew Kamiński
rzecznik patentowy