

(19)



República Argentina
Ministerio de Economía y Producción
Secretaría de Industria, Comercio y de la
Pequeña y Mediana Empresa
Instituto Nacional de la Propiedad Industrial

(11) No de Publicación:

AR 062846 A1

(43) Fecha de Publicación:

10.12.2008

(51) Int. Cl.⁷

G01N 33/12; G01N 33/546;

A61K 9/32; A61P 3/10;

(12)

Solicitud de Patente Independiente

(21) No de Solicitud: **P070104071**

(22) Fecha de Solicitud: **13.09.2007**

(71) Solicitantes:

**LOMBARDO FABIO MARTIN
J.A.PACHECO DE MELO 2638 PISO 5
DEPTO D CAPITAL FEDERAL AR
LOMBARDO JORGE HECTOR VIA G.
MARCONI 45 ENTRANCQUE CN ITALIA
IT
LOMBARDO EDUARDO ANTONIO
PASCO 354 RAMOS MEJIA BS. AS. AR
SMOLKO, EDUARDO ESTEBAN RIOJA
2897 OLIVOS PCIA DE BS. AS. AR**

(72) Inventor/es:

(54) **METODO PARA LA INCORPORACION DE MOLECULAS BIOACTIVAS EN UN SUSTRATO POLIMERICO RESISTENTE A LOS ACIDOS ESTOMACALES, PARA SU UTILIZACION COMO MEDICAMENTO ORAL DE LIBERACION RETARDADA, PARTICULARMENTE MOLECULAS DE INSULINA, Y EL MEDICAMENTO ASI OBTENIDO**

por medio del cual sea necesario menos insulina por dosis para producir el mismo efecto.

(57) Resumen:

Se describe una tecnología que permite superar la barrera gástrica, para compuestos proteicos, en la administración de moléculas bioactivas, particularmente insulina. Se propone un método que reemplaza las aplicaciones inyectables diarias y repetidas de drogas por un producto administrable por vía oral. Está caracterizado por comprender las siguientes etapas: a) Mezclar al menos un monómero polimerizable por medio de radiaciones ionizantes con al menos una solución acuosa de moléculas bioactivas; b) Colocar la mezcla obtenida en la etapa a) en un contenedor permeable y resistente a dichas radiaciones ionizantes; c) Someter a dicho contenedor a radiaciones ionizantes a una dosis capaz de polimerizar todo el monómero, en dosis desde 0.1 kgy hasta los 50 kgy y especialmente entre los 5 y los 30 kgy, obteniéndose en el interior del contenedor un polímero resistente a los ácidos estomacales que en sus nanotúbulos contiene las moléculas bioactivas; d) retirar el polímero obtenido en la etapa c) y dividirlo en fracciones entre 1mm x 1 mm hasta 8 mm x 8mm x 8 mm, aptas para formar parte del medicamento oral de liberación retardada. Son objetivos de la presente invención: un método para la incorporación de moléculas bioactivas en un sustrato polimérico resistente a los ácidos estomacales, para su utilización como medicamento oral de liberación retardada; un método para la incorporación de moléculas bioactivas en un sustrato polimérico resistente a los ácidos estomacales, para su utilización como medicamento oral de liberación retardada, siendo dichas moléculas de insulina; un medicamento oral de liberación prolongada por medio del cual las moléculas bioactivas sean de insulina, la cual sea liberada directamente al hígado y sea el primer sitio de acción, vía circulación portal; un medicamento oral de liberación prolongada por medio del cual la insulina, al ser liberada en el hígado, modere la producción de glucosa hepática; un medicamento oral de liberación prolongada por medio del cual la insulina no produzca picos en la circulación sistémica como la insulina inyectable, reduciendo los riesgos del descenso abrupto de la glucemia; un medicamento oral de liberación prolongada