

|      |              |
|------|--------------|
| 申請日期 | 84 年 9 月 2 日 |
| 案 號  | 34109243     |
| 類 別  |              |

A4  
C4

492875

(以上各欄由本局填註)

| 發明專利說明書     |               |                                                                                           |
|-------------|---------------|-------------------------------------------------------------------------------------------|
| 一、發明<br>名稱  | 中 文           | 色非洛 ( C E F A C L O R ) 的藥學組成物                                                            |
|             | 英 文           | Pharmaceutical formulations of cefaclor                                                   |
| 二、發明<br>創作人 | 姓 名           | (1) 佛拉維亞·亞斯曼迪巴爾 Arce Mendizabal, Flavia                                                   |
|             | 國 籍           | (1) 西班牙                                                                                   |
|             | 住、居所          | (1) 西班牙馬德里·亞爾柯邦德斯·工業街三十號<br>Avenida de La Industria, 30, 28199 Alcobendas (Madrid), Spain |
|             |               |                                                                                           |
| 三、申請人       | 姓 名<br>(名稱)   | (1) 理利公司<br>Lilly, S.A.                                                                   |
|             | 國 籍           | (1) 西班牙                                                                                   |
|             | 住、居所<br>(事務所) | (1) 西班牙馬德里亞爾科班德斯·工業道三十號<br>Avenida De La Industria, 30, 28199 Alcobendas, Madrid, Spain   |
|             | 代 表 人<br>姓 名  | (1) 費納多·馬丁尼茲 Martinez, Fernando Leniz                                                     |

(由本局填寫)

|          |
|----------|
| 承辦人代碼：   |
| 大類：      |
| I P C分類： |

A6  
B6

本案已向：

國（地區） 申請專利，申請日期： 案號： ， ☐有 ☐無主張優先權  
西班牙 1994 年 12 月 13 日 9402530 ☒無主張優先權

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

## 五、發明說明 ( 1 )

發明範疇

本發明係關於含有色非洛之藥學組成物，其適於製造用於口服之固體劑型。特言之，本發明係關於含有色非洛之藥學組成物及可分散型錠劑，及其製備方法。

發明背景

舉例而言，美國專利案第 3, 9 2 5, 3 7 2 號與德國專利案第 D E 2, 4 0 8, 6 9 8 ( Eli Lilly & Co ) 中描述，色非洛或 3 - 氯 - 7 - D - ( 苯基甘氨酸 ) - 3 - 色芬 ( cephem ) - 4 - 羧酸是一種半合成的頭芽孢菌素抗生素。其殺菌作用乃根據其抑制細胞壁合成的能力。色非洛顯示可用於治療多種微生物 ( 特別是鏈球菌及葡萄球菌 ) 之敏感菌株所致的感染症。

目前用於投服色非洛之劑型包括膠囊，緩釋型錠劑，兩者呈小瓶及小袋裝型式。

使用膠囊有許多限制及缺點，影響如下事項：

— 對病人用藥受其限制，因為有些病人可能有吞嚥膠囊的困難，特別是不會吞嚥的兒童及長者；及

— 此膠囊只容許單一劑量。

另一方面，色非洛於懸浮液中施用 ( 小袋裝 ) 之缺點為，因為其中醣含量，其可能的用途對必須有適當預警的糖尿病病人有所限制。

再者，增列由醣含量所致的缺點之外，於懸浮液中施用色非洛 ( 小瓶裝 ) 之其它缺點摘錄如下：

## 五、發明說明( 2 )

— 由於不受控制的攝取而產生意外劑量過量的危機，特別是對兒童；及

— 因為所涉及的體積，在處理及運輸上有困難，導致不能完全治療且大量喪失效力之一些危機。

緩釋型錠劑有不允許二次施用此產物的缺點；再者，此類錠劑對於吞食固體劑型有困難的病人不適合。

色非洛之現有施藥劑量一般不能完全滿足治療細菌感染症所需要及考慮的某些要件，例如其是否可應用至有病況之任何病人以確保治療完整，藉此增加其效力。

因此有需要尋求解決這些問題之施用色非洛的新穎醫藥型式，其可使病人更容易施用藥劑，故其可用於糖尿病病人，但不引起額外麻煩，因此增加治療功效。本發明提供針對這些問題的解決之道，即提供含有色非洛之新穎藥學組成物，其適用於製造可分散型錠劑。

可分散型錠劑是用於口服之固體藥型，其在  $19^{\circ}\text{C}$  —  $21^{\circ}\text{C}$  中必須能在 3 分鐘內崩解並平均地在水中分散。分散均勻試驗係關於將兩個錠劑置入 100 毫升水中，搖晃至其完全崩解為正；其必須分散才能夠通過平均篩孔大小為 710 微米的篩子 ( British Pharmacopea V o l II , 1988 ) 。

習知可分散型錠劑係含有屬於合成型盤尼西林類之抗生素 ( amoxycillin ) 及抗炎症劑 ( pyroxygam ) ，但無任一已知可分散型錠劑含有屬於合成型頭芽孢菌素類之抗生素，例如色非洛。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

### 五、發明說明 ( 3 )

本發明之標的是含有色非洛之新穎藥學組成物，其適用於製造可分散型錠劑。本發明之另一標的是含有色非洛之這種可分散型錠劑及其製造方法。

#### 本發明之詳細說明

製備用於製造可分散型錠劑之組成物，需要研究活性組成物之物化不協合性，以及尋找令其可能符合多種藥典規定之正確佐劑。亦須顧及用於製造這種可分散型錠劑之操作步驟，因為佔有大部份之該藥學組成物的賦形劑及共佐劑是由選用於製造這種可分散型錠劑之方法決定。由於下述理由，直接壓縮法是選擇用於製造此錠劑的方法。

界定可分散型錠劑之參數如下：

- i ) 水中之高崩解速率，及
- i i ) 其崩解後顆粒之均勻分散性。

崩解速率及分散均勻性亦由共佐劑及活性組成份兩者決定。崩解作用係測定經壓縮之藥學製劑中活性組成份的釋出情形，此係發展可分散式劑型的決定性參數。因此製造可分散型錠劑時，共佐劑的篩選是 Galenic 廠研究中最重要的一環。所製成之錠劑的性質與品質主要取決於所併用的共佐劑，因此正確選擇共佐劑最為重要，其係製造方法，因為篩選共佐劑之種類係由所用技術決定的。

適合製造本發明所提供之可分散型錠劑的新穎色非洛藥學組成物，將上述原因列入考慮，且除了活性組成份之外，另含有適量之崩解劑，稀釋劑，潤滑劑，抗黏著劑，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

### 五、發明說明 ( 4 )

甜味劑，香味劑，及隨意含有調味劑，平味劑及調色劑。再者，本發明之特別應用中所提供之新穎色非洛藥學組成物併入泡騰劑。

色非洛是本發明組成物的活性組成份。本文所用「色非洛」乙詞不僅包括游離酸型式，另亦包括其水合物及藥學上可接受之鹽類。色非洛在組成物中存在的量介於組成物總重之 35 % 至 50 % 之間。舉例而言，色非洛之製備如美國專利案第 3,925,372 號及德國專利案第 DE 2,408,698 號 ( Eli Lilly & Co. ) 所載。

由於可分散型錠劑之決定性參數是其於水中的崩解速率，選擇正確的崩解劑是最重要的階段之一。本文所用之「崩解劑」乙詞表示產生表面積增加以致此錠劑之活性組成份可非常快速地釋出的試劑。乙醇酸鈉澱粉單獨使用或與羧甲基纖維素併用，丙烯酸之聚合衍生物，及較佳為可斯波維冬 ( crospovidone )，是本發明組成物之適合崩解劑。

乙醇酸鈉澱粉可呈比例地使用 5 % 及 5 % 以上 ( 佔組成物總重 )，較好濃度介於 10 % 及 21 % 之間。再者，乙醇酸鈉澱粉與羧甲基纖維素鈉鹽之混合物可使用約 14 % ( 重量百分比 ) 之乙醇酸鈉澱粉及約 10 % 之羧甲基纖維素鈉鹽，兩者皆根據組成物之總重。

丙烯酸之聚合衍生物可為中黏度或高黏度，較好是高黏度，其可呈比例地使用約佔該組成物總重之 10 % ( 重

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 5 )

量百分比)。

較佳崩解劑是可斯波維冬 ( crospovidone , 一種由  
乙 烯 基 吡 咯 烷 酮 聚 合 而 得 之 不 溶 性 聚 乙 烯 基 吡 咯 烷 酮 [  
P V P ] ) 。 此 聚 合 物 在 組 成 物 中 可 呈 比 例 地 含 有 佔 該 組  
成 物 總 重 約 1 0 % ( 重 量 百 分 比 ) 。 咸 信 網 化 且 不 溶 性  
P V P 的 高 度 崩 解 作 用 是 其 水 合 效 力 ( 水 吸 附 作 用 ) 造 成  
的 , 這 表 示 極 快 速 崩 解 速 率 可 藉 由 產 生 色 非 洛 在 水 中 之 改  
良 溶 解 作 用 而 達 成 。

另 一 方 面 , 選 擇 製 造 可 分 散 式 錠 劑 之 直 接 壓 縮 技 術 涉  
及 選 擇 賦 形 劑 之 進 一 步 優 點 。 精 粒 劑 型 中 使 用 崩 解 劑 之 可  
能 性 增 進 其 膨 脹 功 效 , 因 為 崩 解 作 用 不 受 濕 化 或 乾 化 改 變  
。

本 文 中 使 用 之 “ 稀 釋 劑 ” 乙 詞 包 括 有 助 於 粉 狀 物 質 壓  
縮 及 提 供 錠 劑 強 度 之 賦 形 劑 。 纖 維 素 微 晶 及 無 水 之 流 動 澱  
粉 及 其 混 合 物 是 適 合 的 稀 釋 劑 。

下 列 物 質 是 本 發 明 中 用 於 組 成 物 之 適 合 稀 釋 劑 的 範 例  
:

1 ) 纖 維 素 微 晶 , 其 提 供 粉 狀 混 合 物 高 度 合 適 之 流 動 性 及  
可 壓 縮 特 性 。 此 稀 釋 劑 使 得 利 用 直 接 壓 縮 技 術 製 造 高 純 度  
之 錠 劑 成 為 可 能 , 其 亦 可 作 為 結 合 劑 , 生 成 具 有 適 當 硬 度  
之 硬 錠 劑 , 而 其 吸 收 效 力 促 成 短 崩 解 時 間 。 市 場 上 可 購 得  
之 不 同 種 類 纖 維 素 微 晶 中 , A V I C E L P H 1 0 2 (   
平 均 顆 粒 大 小 為 9 0 微 米 ) 是 較 好 的 ; 其 它 纖 維 素 微 晶 在  
有 利 直 接 壓 縮 之 效 力 上 具 有 類 似 特 性 , 但 A V I C E L

### 五、發明說明 ( 6 )

P H 1 0 2 使得直接壓縮更直接受惠於其賦與此混合物之流動性，且其顆粒大小有助於細粉末混合物的直接壓縮。

( 本發明之組成物中的一種 ) 組成物中存在之纖維素微晶可佔該組成物總重 2 4 % 至 4 6 % 之間，及

2 ) 無水之流動澱粉，因為在直接壓縮過程中其具有稀釋與結合之效力。在組成物中其量可佔該組成物總重約 3 9 % 。然而，此稀釋劑製得之錠劑不是十分硬，如此對其脆性不佳：緣是之故，含有纖維素微晶作為稀釋劑之錠劑較好。

因為纖維素微晶所佔百分比十分高 ( 組成物總重之 2 4 % 至 4 6 % 之間 ) ，可製得之錠劑重量介於 1 1 4 0 及 1 1 5 0 毫克之間，其具有 3 8 % 至 4 6 % 之高纖維素百分比，但是當纖維素稍低時 ( 3 5 % - 3 6 % ) ，可製得終重為 1 1 2 5 毫克之錠劑。最後，當纖維素微晶之百分比約 2 8 % 時，可製得終重為 1 1 3 0 - 1 1 4 0 毫克之錠劑。

本文所用之“潤滑劑”乙詞包括減少錠劑內部之顆粒內摩擦之賦形劑，其降低基質表面呈現之反應力。可使用十八醯基反丁烯二酸鈉鹽 ( 一種親水性潤滑劑 ) 作為本發明組成物之適合潤滑劑。可添加共佐劑至本發明之組成物中，其比例低於 2 % ( 重量百分比 ) 根據該組成物之總重 ) ，較好佔該組成物總重 0 . 4 % 至 1 . 5 % 之間。

納入此種賦形劑可增加欲壓縮之組成物的滑動性。其並可確使基質內的空間充分填滿，如此錠劑重量之差異性

( 請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁 )

訂



## 五、發明說明( 7 )

十分低。

標準之硬脂酸鹽不適合，因為，例如硬脂酸鎂不吸附水分，生成最難看外觀的溶液，其形成表面上有“空洞”。

本文所用之“抗黏著劑”乙詞包括防止顆粒黏著之賦形劑，如此避免或減少顆粒之間的緊密且減低磨擦。膠態二氧化矽可用來作為適合之抗黏著劑以製造本發明之組成物：因為其具有大的表面係數，故此原料是粉末流動之極佳調節劑，其亦可作為吸附劑，捕獲色非洛吸收之濕度，如此減緩水解作用對活性組成份之降解反應。

此共佐劑可被併入之百分比低於5%（重量百分比，根據該組成物之總重），較好0.2%至1.5%之間。

本發明之組成物亦可含有甜味劑，芳香劑及調味劑。糖精鈉鹽可用來作為人工甜味劑，其佔組成物總重1%以下，較好0.1%至0.4%（重量百分比）之間；或者是佔組成物總重1%以下之阿斯巴甜（aspartame），較好佔組成物總重0.2%至0.75%之間。

草莓芳香劑可用來作為芳香劑，例如鑑知為52，312AP05.15 Firmenish 者，其佔該組成物總重3%至6%之間。

無水檸檬酸可用來作為調味劑，其佔該組成物總重2%至4%之間。

本發明之組成物可額外地及隨意地含有平味劑及呈色劑或呈色劑之組合，以增進所欲製得之溶液的物理外觀，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

## 五、發明說明( 8 )

並生成一致的顏色。二氧化鈦( E - 1 7 1 ) 可用來作為遮光劑，其佔組成物總重 2 % 以下，較好佔組成物總重約 1 . 5 % 。然而使用此遮光劑並非必須的。

可單獨使用或合併使用呈色劑，較好獲得紅色－粉紅色溶液，其可與錠劑所欲使用之芳香劑( 草莓 ) 有關，且其亦可提供最終溶液一種令人喜悅的外觀。這些目的可藉由添加 1 % ( 重量百分比 ) 以下之紅色 F , D 及 C N o . 3 - 赤蘚紅( E - 1 2 7 ) 呈色劑 [ Merck Index, 第 1 1 版, 1 9 8 9 , Rayway, N. J. USA ] 達成。

另一方面，本發明之特殊且可選擇之應用中提供色非洛組成之新穎藥學組成物，其亦併入產生泡騰作用之化合物。藉添加此泡騰成對化合物，此錠劑之崩解速率可增加。通常泡騰成對化合物由泡騰碱及酸組成，該泡騰碱例如有碱金屬或碱土金屬碳酸鹽或重碳酸鹽，該酸與該泡騰碱反應下，產生二氧化碳。本發明之新穎色非洛組成物中，可使用任何一種一般製造泡騰式錠劑所用之泡騰成對化合物，較好是由檸檬酸與碳酸鈣組成。

本發明所製得之色非洛組成物可輕易地製得，藉篩選適量之不同賦形劑與共佐劑，並將其置入適合之攪拌器。然後添加活性組成份，並混合至均質化，生成自由流動的粉末。

這些新穎組成物可用來製造含有色非洛作為活性組成份之可分散型錠劑。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 9 )

如前所述，此錠劑之製造方法在設計此藥學組成物上佔有極重要地位。錠劑之形成可根據顆粒（粉狀顆粒及其上添加之結合劑所製成之團塊物質），或根據先前未處理之粉末混合物（直接壓縮）。共佐劑之篩選係根據使選用的技術。因為可分散型錠劑對潮濕非常敏感，且其安定性受成粒操作之影響，直接壓縮是較佳技術，其提供最大的優點：一方面，製造快速，不受成粒操作或脫水作用決定，另一方面，其避免成粒操作過程中活性組成份（由於水解反應所致）之可能的降解反應。污染危機亦可降低。然而，或許最重要的優點是，經直接壓縮的錠劑一般比濕式成粒操作所製得的錠劑更能快速崩解，濕式成粒操作需要添加結合劑，但結合劑使崩解速率減慢。

雖然直接壓縮可能產生一些缺點，例如混合物及劑量之規格化，流動性及可壓縮性之問題，但令人驚喜地，本發明之組成物完全沒有這些問題。事實上，此錠劑在重量及活性組成份之含量上變化極微。可壓縮性令人滿意且錠劑硬度介於所需範圍內。

含有色非洛之可分散型錠劑可由標準製法製造，例如置入習知轉動式或離心式壓縮機，其壓縮饋入此機器之製備且經篩選之藥學組成物。

本發明提供含有色非洛之可分散型錠劑是固體，欲用於口服，具統一外觀，充分之機械強度，足以抵抗儲存與運輸所致的傷害。活性組成份均勻分佈在藥學劑型中，且水中之崩解速率高（在 19 °C - 21 °C 水中，3 分鐘內崩

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

## 五、發明說明 ( 10 )

解)。同樣地，崩解程度(或產物崩解所得顆粒之纖細度)是恰當的，符合多種藥典之要件。

含有色非洛之可分散型錠劑的用途提供一系列利益，超出此活性組成份之習知及慣用的施用劑型，包括下列利益：

- 其適用於治療吞嚥固體劑型有困難的病人；
- 其可用於糖尿病病人，因為其不含糖類；
- 劑量可予改變，且溶於：病人所需之定量水的劑量相當正確；
- 所生成的溶液具有適合的感官特徵，可被病人接受；
- 其形狀，大小及縮減的體積使其可以發泡劑型存在，此劑型對病人有利，增加處理及攜帶的簡易性，可確保病人完成治療，藉此提高治療效率；及
- 由於過量服用所致意外中毒的危機較低，令其較為無害，特別是對兒童而言。

下列實例說明本發明之特殊應用且不應用來限定本發明。這些實例使用無水之流動澱粉〔GORMASO〕，可斯波維冬(KOLLIDON CL®)〔BASF〕及纖維素微晶(AVICEL PH102®)〔FMC FORT〕。高及中黏度之丙烯酸衍生物皆由甲丙烯酸及甲丙烯酸甲酯之共聚物組成，其比例約7：3，係由ROHM PHARMA廠製造。此兩種丙烯酸衍生物之間的差異是由於其所形成之凝膠黏度不同所致。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 11)

實例 1

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備：

| <u>組成份</u>                      | <u>重量</u>     | <u>重量</u>      |
|---------------------------------|---------------|----------------|
|                                 | <u>( 毫克 )</u> | <u>百分比 (%)</u> |
| 色非洛                             | 523.01        | 37.35          |
| 乙醇酸鈉澱粉                          | 70.00         | 5.00           |
| CMC <sup>+</sup> , AVICEL PH102 | 612.99        | 43.78          |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                     | 14.00         | 1.00           |
| 膠態二氧化矽                          | 70.00         | 5.00           |
| 阿斯巴甜                            | 10.00         | 0.71           |
| 草莓芳香劑                           | 50.00         | 3.58           |
| 無水檸檬酸                           | 50.00         | 3.58           |

<sup>+</sup>CMC：纖維素微晶

此製法是由分別稱重所有原料開始，然後篩選以作為安全檢查。篩選後，將賦形劑置入適當攪拌器中，然後加入色非洛，再次混合至均質狀。

令混合後的粉末通過 0.7 毫米之篩孔之篩板數次。然後壓縮並在製造過程中提供間隔性控制，在相關控制卡上沒有得到任何結果。此粉末令人滿意地流動著且壓縮毫無困難。製法結束時，使用統計式之取樣法分析代表性樣品（對最早，中間及最後一批樣品取樣）。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

五、發明說明 ( 12)

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 4 0 0 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 4 克 ± 3 %

硬度：7 k g f

高度：約 5 . 6 毫米

直徑：1 7 . 1 5 毫米

在 1 9 °C – 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

外觀：白色，帶有一些透明的表面斑點

味道：令人喜悅的（相當中性）

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，維持懸浮狀約 2 分鐘。

實例 2

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u>                      | <u>重量</u>     | <u>重量</u>      |
|---------------------------------|---------------|----------------|
|                                 | <u>( 毫克 )</u> | <u>百分比 (%)</u> |
| 色非洛                             | 523.01        | 41.84          |
| 乙醇酸鈉澱粉                          | 62.50         | 5.00           |
| CMC <sup>+</sup> , AVICEL PH102 | 544.49        | 43.56          |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                     | 12.50         | 1.00           |
| 膠態二氧化矽                          | 62.50         | 5.00           |
| 阿斯巴甜                            | 5.00          | 0.40           |
| 草莓芳香劑                           | 40.00         | 3.20           |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 13)

CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 2 5 0 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 2 . 5 克 ± 3 %

硬度：7 . 8 k g f

高度：約 5 . 5 毫米

直徑：1 7 . 1 5 毫米

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

味道：令人喜悅的（相當中性）

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，維持懸浮狀約 2 分鐘。

實例 3

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| 組成份                            | 重量<br>( 毫克 ) | 重量<br>百分比 (%) |
|--------------------------------|--------------|---------------|
| 色非洛                            | 523.01       | 41.84         |
| 乙醇酸鈉澱粉                         | 62.50        | 5.00          |
| CMC <sup>+</sup> ，AVICEL PH102 | 574.49       | 45.96         |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                    | 12.50        | 1.00          |
| 膠態二氧化矽                         | 12.50        | 1.00          |
| 糖精鈉鹽                           | 5.00         | 0.40          |
| 草莓芳香劑                          | 60.00        | 4.80          |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 14)

CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 2 5 0 毫克± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 2 1 5 克± 3 %

硬度：8 k g f

高度：約 5 . 2 毫米

直徑：1 7 . 1 5 毫米

在 1 9 °C – 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

外觀：近白色

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，維持懸浮狀約 2 分鐘。

實例 4

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| 組成份                            | 重量     | 重量      |
|--------------------------------|--------|---------|
|                                | ( 毫克 ) | 百分比 (%) |
| 色非洛                            | 523.00 | 41.84   |
| 乙醇酸鈉澱粉                         | 62.50  | 5.00    |
| CMC <sup>-</sup> ，AVICEL PH102 | 562.00 | 44.96   |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                    | 12.50  | 1.00    |
| 膠態二氧化矽                         | 12.50  | 1.00    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂



五、發明說明 ( 15)

|           |       |      |
|-----------|-------|------|
| 糖 精 鈉 鹽   | 5.00  | 0.40 |
| 草 莓 芳 香 劑 | 60.00 | 4.80 |
| 二 氧 化 鈦   | 12.50 | 1.00 |

\* CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 2 5 0 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 2 . 5 克 ± 3 %

硬度：1 0 k g f

高度：約 5 . 1 毫米

直徑：1 7 . 1 5 毫米

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀（約 3 0 分鐘）。

實例 5

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u> | <u>重量</u><br>( 毫克 ) | <u>重量</u><br>百分比 (%) |
|------------|---------------------|----------------------|
| 色 非 洛      | 523.01              | 45.49                |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 16)

|                       |        |       |
|-----------------------|--------|-------|
| 乙 醇 酸 鈉 澱 粉           | 115.00 | 10.00 |
| 無 水 之 可 流 動 澱 粉       | 445.00 | 38.70 |
| 十 八 醯 基 反 丁 烯 二 酸 鈉 鹽 | 6.25   | 0.54  |
| 膠 態 二 氧 化 矽           | 6.25   | 0.54  |
| 糖 精 鈉 鹽               | 3.00   | 0.27  |
| 草 莓 芳 香 劑             | 45.00  | 3.92  |
| 二 氧 化 鈦               | 6.25   | 0.54  |

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 4 9 . 7 6 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 5 克 ± 3 %

硬度：8 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性（1 0 顆錠）：0 . 9 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀（約 3 0 分鐘）。

實 例 6

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

重 量

重 量

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

五、發明說明 ( 17)

| <u>組成份</u>                      | <u>( 毫克 )</u> | <u>百分比 (%)</u> |
|---------------------------------|---------------|----------------|
| 色 非 洛                           | 523.01        | 48.29          |
| 乙 醇 酸 鈉 澱 粉                     | 163.00        | 15.05          |
| CMC <sup>*</sup> , AVICEL PH102 | 345.00        | 31.85          |
| 十 八 醯 基 反 丁 烯 二 酸 鈉 鹽           | 5.60          | 0.52           |
| 膠 態 二 氧 化 矽                     | 2.20          | 0.20           |
| 糖 精 鈉 鹽                         | 3.00          | 0.28           |
| 草 莓 芳 香 劑                       | 38.00         | 3.51           |
| 二 氧 化 鈦                         | 3.30          | 0.30           |

\* CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 0 8 3 . 1 1 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 0 . 8 克 ± 3 %

硬度：8 - 9 k g p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：0 . 8 %

外觀：近白色

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

實 例 7

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

裝

五、發明說明 ( 18)

之製程：

| 組成份                             | 重量<br>( 毫克 ) | 重量<br>百分比 (%) |
|---------------------------------|--------------|---------------|
| 色非洛                             | 523.01       | 45.88         |
| 乙醇酸鈉澱粉                          | 163.00       | 14.30         |
| 羧甲基纖維素鈉鹽                        | 120.00       | 10.53         |
| CMC <sup>*</sup> , AVICEL PH102 | 275.00       | 24.13         |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                     | 5.60         | 0.49          |
| 膠態二氧化矽                          | 6.00         | 0.53          |
| 糖精鈉鹽                            | 2.00         | 0.17          |
| 草莓芳香劑                           | 42.00        | 3.68          |
| 二氧化鈦                            | 3.30         | 0.29          |

<sup>\*</sup>CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 9 . 9 1 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 4 克 ± 3 %

硬度：8 - 9 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：0 . 8 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 19)

浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

實例 8

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| 組成份                             | 重量     | 重量      |
|---------------------------------|--------|---------|
|                                 | ( 毫克 ) | 百分比 (%) |
| 色非洛                             | 523.01 | 45.88   |
| 乙醇酸鈉澱粉                          | 110.01 | 9.65    |
| 碳酸鈣                             | 14.02  | 1.23    |
| 無水檸檬酸                           | 40.01  | 3.51    |
| CMC <sup>*</sup> ， AVICEL PH102 | 390.02 | 34.21   |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                     | 5.59   | 0.50    |
| 膠態二氧化矽                          | 11.97  | 1.05    |
| 糖精鈉鹽                            | 2.05   | 0.18    |
| 草莓芳香劑                           | 40.01  | 3.50    |
| 二氧化鈦                            | 3.31   | 0.29    |

<sup>\*</sup>CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 4 0 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 4 克 ± 3 %

硬度：9 - 1 0 k p

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 20)

在 19 °C – 21 °C 水中之崩解作用： < 3 分鐘

脆性 ( 10 顆錠 )： 0.6 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

實例 9

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| 組成份                             | 重量     | 重量      |
|---------------------------------|--------|---------|
|                                 | (毫克)   | 百分比 (%) |
| 色非洛                             | 523.01 | 46.10   |
| 乙醇酸鈉澱粉                          | 171.00 | 15.07   |
| CMC <sup>*</sup> ， AVICEL PH102 | 345.00 | 31.35   |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                     | 17.10  | 1.50    |
| 膠態二氧化矽                          | 17.10  | 1.50    |
| 糖精鈉鹽                            | 2.28   | 0.21    |
| 草莓芳香劑                           | 39.90  | 3.52    |
| 二氧化鈦                            | 8.55   | 0.75    |

\*CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量： 1134.62 毫克 ± 5 %

10 顆錠劑之重量： 11.3 克 ± 3 %

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 21)

硬度：12.8 k p

在 19℃ - 21℃ 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 10 顆錠 )：< 0.5 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 30 分鐘 )。

實例 10

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u>                     | <u>重量</u>     | <u>重量</u>      |
|--------------------------------|---------------|----------------|
|                                | <u>( 毫克 )</u> | <u>百分比 (%)</u> |
| 色非洛                            | 523.01        | 46.10          |
| 乙醇酸鈉澱粉                         | 171.00        | 15.07          |
| CMC <sup>-</sup> ，AVICEL PH102 | 355.68        | 31.35          |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                    | 17.10         | 1.50           |
| 膠態二氧化矽                         | 17.10         | 1.50           |
| 阿斯巴甜                           | 2.28          | 0.21           |
| 草莓芳香劑                          | 39.90         | 3.52           |
| 二氧化鈦                           | 8.55          | 0.75           |
| - CMC：纖維素微晶                    |               |                |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 ( 22)

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 4 . 6 2 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 3 克 ± 3 %

硬度：1 2 . 8 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：< 0 . 5 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

實例 1 1

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u>                     | <u>重量</u>     | <u>重量</u>      |
|--------------------------------|---------------|----------------|
|                                | <u>( 毫克 )</u> | <u>百分比 (%)</u> |
| 色非洛                            | 523.01        | 45.96          |
| 乙醇酸鈉澱粉                         | 205.20        | 18.03          |
| CMC <sup>-</sup> ，AVICEL PH102 | 324.90        | 28.55          |
| 十八鹽基反丁烯二酸鈉鹽                    | 17.10         | 1.50           |
| 膠態二氧化矽                         | 17.10         | 1.50           |
| 糖精鈉鹽                           | 2.28          | 0.20           |
| 草莓芳香劑                          | 39.90         | 3.51           |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂



五、發明說明 ( 23)

二 氧 化 鈦 8.55 0.75

CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 8 . 0 4 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 4 克 ± 3 %

硬度：1 3 . 0 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：< 0 . 5 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

實 例 1 2

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| 組 成 份                           | 重 量     | 重 量         |
|---------------------------------|---------|-------------|
|                                 | ( 毫 克 ) | 百 分 比 ( % ) |
| 色 非 洛                           | 523.01  | 45.96       |
| 乙 醇 酸 鈉 澱 粉                     | 228.00  | 20.03       |
| CMC <sup>+</sup> ， AVICEL PH102 | 302.10  | 26.55       |
| 十 八 醯 基 反 丁 烯 二 酸 鈉 鹽           | 17.10   | 1.50        |
| 膠 態 二 氧 化 矽                     | 17.10   | 1.50        |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 ( 24)

|           |       |      |
|-----------|-------|------|
| 糖 精 鈉 鹽   | 2.28  | 0.20 |
| 草 莓 芳 香 劑 | 39.90 | 3.51 |
| 二 氧 化 鈦   | 8.55  | 0.75 |
| CMC：纖維素微晶 |       |      |

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 8 . 0 4 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 4 克 ± 3 %

硬度：1 0 . 7 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：< 0 . 5 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

實例 1 3

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u>    | <u>重量</u><br>( 毫克 ) | <u>重量</u><br>百分比 (%) |
|---------------|---------------------|----------------------|
| 色非洛           | 523.01              | 46.66                |
| 丙烯衍生物 ( 中黏度 ) | 114.00              | 10.17                |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 25)

|                                 |        |       |
|---------------------------------|--------|-------|
| CMC <sup>™</sup> , AVICEL PH102 | 399.00 | 35.60 |
| 十八 醯 基 反 丁 烯 二 酸 鈉 鹽            | 17.10  | 1.50  |
| 膠 態 二 氧 化 矽                     | 17.10  | 1.50  |
| 糖 精 鈉 鹽                         | 2.28   | 0.21  |
| 草 莓 芳 香 劑                       | 39.90  | 3.56  |
| 二 氧 化 鈦                         | 8.55   | 0.76  |

CMC<sup>™</sup>：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 2 0 . 9 4 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 2 克 ± 3 %

硬度：1 2 . 2 7 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性（1 0 顆錠）：< 0 . 5 %

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀（約 3 0 分鐘）。

實例 1 4

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

重量                      重量

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 ( 26)

| <u>組成份</u>                      | <u>( 毫 克 )</u> | <u>百 分 比 ( % )</u> |
|---------------------------------|----------------|--------------------|
| 色 非 洛                           | 523.01         | 46.26              |
| 丙 烯 衍 生 物 ( 高 黏 度 )             | 114.00         | 10.08              |
| CMC <sup>*</sup> , AVICEL PH102 | 399.00         | 35.30              |
| 十 八 醯 基 反 丁 烯 二 酸 鈉 鹽           | 17.10          | 1.51               |
| 膠 態 二 氧 化 矽                     | 17.10          | 1.51               |
| 糖 精 鈉 鹽                         | 3.42           | 0.30               |
| 草 莓 芳 香 劑                       | 39.90          | 3.53               |
| 二 氧 化 鈦                         | 17.10          | 1.51               |

\* CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 0 . 6 3 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 3 克 ± 3 %

硬度：1 3 . 6 5 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

外觀：近白色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀（約 3 0 分鐘）。

實 例 1 5

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 27)

| 組成份                             | 重量     | 重量      |
|---------------------------------|--------|---------|
|                                 | ( 毫克 ) | 百分比 (%) |
| 色 非 洛                           | 523.01 | 46.11   |
| 丙 烯 衍 生 物 ( 高 黏 度 )             | 114.00 | 10.05   |
| CMC <sup>*</sup> , AVICEL PH102 | 399.00 | 35.17   |
| 十 八 醯 基 反 丁 烯 二 酸 鈉 鹽           | 17.10  | 1.51    |
| 膠 態 二 氧 化 矽                     | 17.10  | 1.51    |
| 糖 精 鈉 鹽                         | 4.10   | 0.36    |
| 草 莓 芳 香 劑                       | 39.90  | 3.52    |
| 二 氧 化 鈦                         | 17.10  | 1.51    |
| 赤 蘇 紅 ( Erythosine )            | 3.00   | 0.26    |

\* CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 4 . 3 1 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 3 克 ± 3 %

硬度：1 3 k p

在 1 9 °C - 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：< 0 . 5 %

外觀：淡玫瑰色，

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸

浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 28)

實例 1 6

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| 組成份                            | 重量<br>( 毫克 ) | 重量<br>百分比 (%) |
|--------------------------------|--------------|---------------|
| 色非洛                            | 523.01       | 46.24         |
| 丙烯衍生物 ( 高黏度 )                  | 114.00       | 10.08         |
| CMC <sup>+</sup> ，AVICEL PH102 | 400.00       | 35.07         |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                    | 17.10        | 1.51          |
| 膠態二氧化矽                         | 17.10        | 1.51          |
| 糖精鈉鹽                           | 4.10         | 0.36          |
| 草莓芳香劑                          | 40.00        | 3.53          |
| 黃色 F, D, 及 C No. 6             | 4.00         | 0.35          |
| 赤蘚紅                            | 4.00         | 0.35          |

<sup>+</sup>CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 3 1 . 3 1 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 3 克 ± 3 %

硬度：1 5 . 7 4 k p

在 1 9 °C – 2 1 °C 水中之崩解作用：< 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )：< 0 . 5 %

外觀：淡玫瑰色，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 29)

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀（約 3 0 分鐘）。

實例 1 7

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u>                     | <u>重量</u><br>( 毫克 ) | <u>重量</u><br>百分比 (%) |
|--------------------------------|---------------------|----------------------|
| 色非洛                            | 523.01              | 46.48                |
| 丙烯衍生物（高黏度）                     | 114.00              | 10.13                |
| CMC <sup>-</sup> ，AVICEL PH102 | 400.00              | 35.34                |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                    | 17.10               | 1.52                 |
| 膠態二氧化矽                         | 17.10               | 1.52                 |
| 糖精鈉鹽                           | 4.10                | 0.36                 |
| 草莓芳香劑                          | 40.00               | 3.56                 |
| 赤蘚紅                            | 10.00               | 0.89                 |

<sup>-</sup>CMC：纖維素微晶

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

單獨錠劑之重量：1 1 2 5 . 3 1 毫克 ± 5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 2 克 ± 3 %

硬度：1 5 k p

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 ( 30)

在 1 9 °C – 2 1 °C 水中之崩解作用： < 3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )： < 0 . 5 %

外觀：淡玫瑰色

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

實例 1 8

可分散型錠劑係由如下藥學組成物製備，使用實例 1 所述之製程：

| <u>組成份</u>                      | <u>重量</u>     | <u>重量</u>      |
|---------------------------------|---------------|----------------|
|                                 | <u>( 毫克 )</u> | <u>百分比 (%)</u> |
| 色非洛                             | 523.01        | 46.48          |
| 可斯波維冬 ( Crospovidone )          | 114.00        | 10.13          |
| CMC <sup>*</sup> , AVICEL PH102 | 400.00        | 35.34          |
| 十八醯基反丁烯二酸鈉鹽                     | 17.10         | 1.52           |
| 膠態二氧化矽                          | 17.10         | 1.52           |
| 糖精鈉鹽                            | 4.10          | 0.36           |
| 草莓芳香劑                           | 40.00         | 3.56           |
| 赤薜紅                             | 10.00         | 0.89           |
| <sup>*</sup> CMC：纖維素微晶          |               |                |

製得具有下列特徵之可分散型錠劑：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

裝



## 五、發明說明 ( 31)

單獨錠劑之重量：1 1 2 5 . 3 1 毫克  $\pm$  5 %

1 0 顆錠劑之重量：1 1 . 2 克  $\pm$  3 %

硬度：1 4 . 7 8 k p

在 1 9  $^{\circ}\text{C}$  - 2 1  $^{\circ}\text{C}$  水中之崩解作用： $<$  3 分鐘

脆性 ( 1 0 顆錠 )： $<$  0 . 5 %

外觀：淡玫瑰色

味道：令人喜悅的

懸浮性：一旦崩解且經搖晃，似乎可維持長時間之懸浮狀 ( 約 3 0 分鐘 ) 。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

色非洛 ( C E F A C L O R ) 的藥學組成物

色非洛 ( cefaclor ) 組成之藥學組成物，其適用於直接壓縮製造可分散型錠劑，該錠劑含有佔此組成物總重為 35 % 至 50 % (按重量計) 之間的抗生素－色非洛，以及選自下列之賦形劑及共佐劑：崩散劑，稀釋劑，潤滑劑，抗黏著劑，甜味劑，芳香劑，及隨意含有調味劑，不透明劑及呈色劑。此組成物適合製備可分散型錠劑，該錠劑在 19 - 21 °C 水中，於三分鐘內分散，且此組成物適用於治療細菌所致的感染症，該細菌對色非洛敏感。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

英文發明摘要 (發明之名稱： Pharmaceutical formulations of cefaclor)

Pharmaceutical formulations of cefaclor, suitable for the direct-compression manufacture of dispersible tablets, containing the antibiotic cefaclor in an amount between 35% and 50% by weight of the total weight of the formulation, along with suitable excipients and coadjuvants selected from disintegrators, diluents, lubricants, antiadherents, sweeteners, fragrances and, optionally, flavorings, opacifiers and colorants. Said formulations are suitable for the manufacture of dispersible tablets which disintegrate in less than three minutes in water at 19° - 21°C, and are suitable for the treatment of infections caused by bacteria strains sensitive to cefaclor.

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

## 六、申請專利範圍

附件一：第 8 4 1 0 9 2 4 3 號專利申請案

中文申請專利範圍修正本

民國 9 0 年 4 月修正

1. 一種適用於直接壓縮製造可分散型錠劑之藥學組成物，其含有佔該組成物總重 3 5 % 至 5 0 % 之間，作為活性組成份之色非洛（ cefaclor ），崩解劑及適合之賦形劑及共佐劑，其中該崩解劑是乙醇酸鈉澱粉，丙烯酸衍生物，乙醇酸鈉澱粉與羧甲基纖維素之混合物。

2. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其中該適合之賦形劑及共佐劑包括稀釋劑，潤滑劑，抗黏著劑，甜味劑，芳香劑，且隨意含有調味劑，不透明劑及呈色劑。

3. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其中該崩解劑是可斯波維冬（ Crospovidone ）。

4. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其含有佔該組成物總重為 5 % 至 2 1 % 之間的乙醇酸鈉澱粉。

5. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其含有佔該組成物總重 8 至 1 2 % 之丙烯酸衍生物。

6. 如申請專利範圍第 3 項之組成物，其含有佔該組成物總重 8 至 1 2 % 之可斯波維冬（ crospovidone ）。

7. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其含有（ i ）佔該組成物總重 1 2 至 1 6 % 之乙醇酸鈉澱粉，及（ i i ）佔該組成物總重 8 至 1 2 % 之羧甲基纖維素，其係作為崩解劑。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

## 六、申請專利範圍

8. 如申請專利範圍第2項之組成物，其含有作為稀釋劑之纖維素微晶，無水之流動澱粉及其混合物。

9. 如申請專利範圍第8項之組成物，其含有佔該組成物總重為24%至46%之間的纖維素微晶。

10. 如申請專利範圍第9項之組成物，其中該纖維素微晶具有約90微米之平均顆粒大小。

11. 如申請專利範圍第8項之組成物，其含有佔該組成物總重約39%之無水的流動澱粉。

12. 如申請專利範圍第2項之組成物，其含有作為潤滑劑之硬脂酸鈉，佔該組成物總重2%以下。

13. 如申請專利範圍第2項之組成物，其含有作為抗黏著劑之膠態二氧化矽，佔該組成物總重5%以下。

14. 如申請專利範圍第2項之組成物，其包括作為甜味劑之阿斯巴甜（aspartame），糖精鈉鹽，或其混合物，佔該組成物總重1%以下。

15. 如申請專利範圍第14項之組成物，其含有佔該組成物總重0.1%至0.4%之間的糖精鈉鹽。

16. 如申請專利範圍第14項之組成物，其含有佔該組成物總重0.2%至0.7%之間的阿斯巴甜。

17. 如申請專利範圍第2項之組成物，其含有佔該組成物總重3%至5%之間的草莓芳香劑。

18. 如申請專利範圍第2項之組成物，其含有作為調味劑之無水檸檬酸，佔該組成物總重2%至4%之間。

19. 如申請專利範圍第2項之組成物，其含有作為

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

## 六、申請專利範圍

不透明劑之二氧化鈦，佔該組成物總重 2 % 以下。

2 0 . 如申請專利範圍第 2 項之組成物，其含有作為呈色劑之紅色 F，D 及 C No. 3 赤蘇紅 (erythrosine)，佔該組成物總重 1 0 % 以下。

2 1 . 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其包括產生泡騰作用之一對化合物。

2 2 . 如申請專利範圍第 2 1 項之組成物，其中該泡騰成對化合物由檸檬酸及碳酸鈉組成。

2 3 . 一種可分散型色非洛 ( cefaclor ) 錠劑，其由下述藥學組成物直接壓縮而製得，前述藥學組成物含有佔該組成物總重 3 5 % 至 5 0 % 之間，作為活性組成份之色非洛 ( cefaclor )，崩解劑及適合之賦形劑及共佐劑，其中該崩解劑是乙醇酸鈉澱粉，丙烯酸衍生物，乙醇酸鈉澱粉與羧甲基纖維素之混合物。

2 4 . 一種製造可分散型色非洛 ( cefaclor ) 錠劑之方法，其係直接壓縮下述藥學組成物，前述藥學組成物含有佔該組成物總重 3 5 % 至 5 0 % 之間，作為活性組成份之色非洛 ( cefaclor )，崩解劑及適合之賦形劑及共佐劑，其中該崩解劑是乙醇酸鈉澱粉，丙烯酸衍生物，乙醇酸鈉澱粉與羧甲基纖維素之混合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線