



(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 109414051 A

(43)申请公布日 2019.03.01

(21)申请号 201780040620.X

(74)专利代理机构 北京市柳沈律师事务所

(22)申请日 2017.06.27

11105

代理人 张涛

(30)优先权数据

2016-128150 2016.06.28 JP

(51)Int.Cl.

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2018.12.28

A23L 29/00(2006.01)

A23L 5/00(2006.01)

A61K 9/20(2006.01)

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/JP2017/023475 2017.06.27

A61K 47/22(2006.01)

A61K 47/26(2006.01)

(87)PCT国际申请的公布数据

W02018/003762 JA 2018.01.04

A61K 47/36(2006.01)

A61K 47/38(2006.01)

(71)申请人 株式会社日本抗菌总和研究所

地址 日本奈良县

C11D 3/22(2006.01)

C11D 3/37(2006.01)

(72)发明人 富士野彰宏

权利要求书1页 说明书7页

(54)发明名称

赋形剂和片剂

(57)摘要

本发明提供一种赋形剂,其能够用于可使粉末状洗涤剂、粉末状药物等功能性粉末在水或体内快速崩解的片剂。本发明的赋形剂是用于将粉末片剂化的赋形剂,上述赋形剂含有选自麦芽糖醇、异麦芽酮糖醇、麦芽糖和乳糖中的一种以上的固化剂,并含有淀粉、结晶纤维素,因此可以容易地以常规方式将粉末片剂化,并且所获得的片剂在水中具有优异的溶解性,在投入水中后快速溶解,并且该片剂具有优异的硬度,几乎不会因为是在储存或运输期间施加的外力而导致缺损等损坏,从而可以基本上保持预定的形状。

1. 一种赋形剂,其含有:选自麦芽糖醇、异麦芽酮糖醇、麦芽糖和乳糖中的一种以上的固化剂,并含有淀粉和结晶纤维素。
2. 根据权利要求1所述的赋形剂,其含有:
淀粉100质量份、结晶纤维素5~20质量份和固化剂0.2~10质量份。
3. 根据权利要求1或2所述的赋形剂,其中,
淀粉是木薯淀粉。
4. 根据权利要求1或2所述的赋形剂,其用于粉末的片剂化。
5. 一种片剂,其含有:
权利要求1所述的赋形剂和作为原料的粉末。
6. 根据权利要求5所述的片剂,其中,
粉末的含量与赋形剂的含量之比(粉末的含量/赋形剂的含量)为6.4以下。

赋形剂和片剂

技术领域

[0001] 本发明涉及一种赋形剂和片剂，

背景技术

[0002] 以往，将洗涤剂制成片剂的形态，提供在使用时将其溶于水来使用的洗涤片剂。

[0003] 作为这样的洗涤片剂，例如专利文献1公开了一种多相洗涤片剂，该片剂包含：a) 其中具有至少一个形态的成形体形态的第一相；和b) 接合并包含在上述形态中的压缩体形态的第二相，该片剂组合物主要包含浓缩在第二相中的一种或一种以上的洗涤剂活性成分，并且第二相还包含粘合剂，该片剂适用于洗衣机。

[0004] 此外，在医学领域，就粉末状的药物而言，当患者服用药物时可能出现撒落，并且为了确保患者服用处方中预定量的药物，从而对药物进行片剂化。

[0005] 现有技术文献

[0006] 专利文献

[0007] 专利文献1：W000/04115

发明内容

[0008] 发明所解决的技术问题

[0009] 然而，专利文献1的多相洗涤片剂具有下述问题：在水中的溶解不充分，并且需要花费时间来溶于水。

[0010] 本发明提供一种赋形剂，其能够将粉末状洗涤剂、粉末状药物等粉末制成在水或体内快速崩解并且具有优异硬度的片剂；以及使用上述赋形剂进行片剂化而得到的片剂。

[0011] 解决问题的技术手段

[0012] 本发明的赋形剂含有：选自麦芽糖醇、异麦芽酮糖醇、麦芽糖和乳糖中的一种以上的固化剂；并含有淀粉和结晶纤维素。

[0013] 发明效果

[0014] 根据本发明的赋形剂，可以容易地以常规方式对粉末进行片剂化。此外，所得的片剂在水中具有优异的溶解性，在投入水中后快速溶解。此外，所得的片剂具有优异的硬度，几乎不会因为在储存或运输期间施加的外力而导致缺损等损坏，从而可以基本上保持预定的形状。

具体实施方式

[0015] 本发明的赋形剂含有淀粉、结晶纤维素以及选自麦芽糖醇、异麦芽酮糖醇、麦芽糖和乳糖中的一种以上的固化剂。

[0016] 本发明的赋形剂用于粉末的片剂化，其含有淀粉、结晶纤维素以及选自麦芽糖醇、异麦芽酮糖醇、麦芽糖和乳糖中的一种以上的固化剂。

[0017] 赋形剂中包含淀粉。作为淀粉没有特别限制，例如可举出：马铃薯淀粉、甘薯淀粉、

玉米淀粉、木薯淀粉、小麦粉淀粉、大米淀粉、豆淀粉、葛淀粉、蕨淀粉、猪芽花淀粉(片栗粉でんぷん)等,优选木薯淀粉。需要说明的是,淀粉可以单独使用,也可以组合使用两种以上。

[0018] 赋形剂含有结晶纤维素作为粘合剂。“结晶纤维素”是指,用酸对天然纤维素类物质进行部分解聚并纯化得到的产物,例如METOLOSE(羟丙甲纤维素)、甲基纤维素、羧甲基纤维素、羟乙基纤维素、羟丙基甲基纤维素、羟丙甲纤维素(hypromellose,ヒプロメロース)、羧甲基纤维素钠等。作为天然纤维素物质,例如可举出:木材、竹子、麦秆、稻草、棉花、苧麻、甘蔗渣、洋麻、甜菜等从植物获得的纤维素、从海鞘获得的纤维素、从乙酸菌等细菌获得的纤维素等。天然纤维素类物质作为原料可以单独使用,也可以组合使用两种以上。结晶纤维素可以单独使用,也可以组合使用两种以上。

[0019] 结晶纤维素的平均聚合度优选为500以下。结晶纤维素的平均聚合度,可以通过“第14修订版日本药典”(广川书店出版)的结晶纤维素确认试验(3)中规定的利用铜乙二胺溶液的还原比粘度法来测定。结晶纤维素的平均聚合度优选为10~500,更优选为10~300。当结晶纤维素的平均聚合度落入上述范围内时,使用赋形剂而得的片剂在水中或体内具有优异的崩解性。

[0020] 作为控制结晶纤维素的平均聚合度的方法,例如可举出天然纤维素类物质的水解处理。通过水解处理,天然纤维素类物质内部的无定形纤维素发生解聚,平均聚合度降低。同时,通过水解处理,除了上述无定形纤维素之外,还除去半纤维素和木质素等杂质,从而获得天然纤维素类物质内部发生了多孔质化而得到的结晶纤维素。

[0021] 水解方法没有特别限制,可举出:酸水解、热水解、蒸汽爆破、微波分解等。

[0022] 结晶纤维素的粒子形状(L/D)优选为20以下,更优选为15以下,进一步优选为10以下,更进一步优选为5以下,特别优选小于5,最优选为4以下。根据其定义,结晶纤维素的粒子形状(L/D)的下限为1。

[0023] 结晶纤维素的粒子形状(L/D)是指以下述方式测得的值。首先,将结晶纤维素制成1质量%浓度的纯水悬浊液,使用高剪切均化器(例如日本精机社制造的商品名“EXCEL AUTO HOMOGENIZER ED-7”),在15000rpm下搅拌5分钟,制备水分散体。用纯水将水分散体稀释为0.1~0.5质量%的分散液。将该分散液流延到云母上,通过高分辨率扫描型显微镜(SEM)、或原子力显微镜(AFM)观察风干了的分散液中的结晶纤维素。从观察的结晶纤维素中任选100个,测定各结晶纤维素在观察方向上的长径(L)和短径(D),来计算长径(L)/短径(D),将100个结晶纤维素的长径(L)/短径(D)的算术平均值作为结晶纤维素的粒子形状(L/D)。需要说明的是,结晶纤维素的长径(L)和短径(D)以下述方式测定。绘制一个能够包围结晶纤维素的具有最小直径的正圆。绘制一个以该正圆的直径作为长径,并且能够包围结晶纤维素的具有最小面积的椭圆,将该椭圆的长径和短径分别作为结晶纤维素的长径(L)和短径(D)。

[0024] 赋形剂中结晶纤维素相对于淀粉100质量份的含量,优选为5~20质量份,更优选为6~18质量份,进一步优选为7~16质量份,特别优选为8~15质量份,最优选为8~12质量份。当结晶纤维素的含量为5质量份以上时,使用赋形剂而得的片剂的硬度得到改善。当结晶纤维素的含量为20质量份以下时,使用赋形剂而得的片剂的崩解性得到改善。

[0025] 赋形剂含有选自麦芽糖醇、异麦芽酮糖醇、麦芽糖和乳糖中的至少一种作为固化

剂。固化剂优选包含异麦芽酮糖醇。需要说明的是,固化剂可以单独使用,也可以组合使用两种以上。

[0026] 在组合使用两种以上固化剂的情况下,优选包含选自麦芽糖醇、麦芽糖和乳糖中的一种以上的化合物、和异麦芽酮糖醇。

[0027] 赋形剂中固化剂相对于淀粉100质量份的含量,优选为0.2~10质量份,更优选为0.3~8质量份,进一步优选为0.5~5质量份,特别优选为0.6~3质量份,最优选为0.7~2质量份。当固化剂的含量为0.2质量份以上时,使用赋形剂而得的片剂的硬度得到改善。当固化剂的含量为10质量份以下时,使用赋形剂而得的片剂的崩解性得到改善。

[0028] 需要说明的是,在不损害其物理性质的范围内,赋形剂中可以含有润滑剂、酶等添加剂。作为润滑剂,可举出硬脂酸钙、硬脂酸钠、硬脂酸钾、硬脂酸镁等。

[0029] 赋形剂的制造方法没有特别限制,只要将构成成分均匀混合即可,例如使用常用的混合装置将淀粉、结晶纤维素以及固化剂均匀混合来制造。

[0030] 赋形剂用于对粉末进行片剂化。作为粉末没有特别限制,例如可举出粉末状洗涤剂、粉末状药物、粉末状调味料、粉末状食品、粉末状保健食品和粉末状保健品(补充剂)等。

[0031] 作为使用赋形剂对粉末进行片剂化的方法,例如,可以在将作为原料的粉末和赋形剂混合后,对其进行片剂化(压片)。作为使用赋形剂将粉末片剂化的方法,可以使用公知的方法,例如可举出直接压片法、干式颗粒压片法等。具体而言,可举出:(1)将作为原料的粉末、赋形剂以及必要的添加剂混合,然后压片的方法(直接压片法);(2)将作为原料的粉末、赋形剂以及必要的添加剂混合制成颗粒,将该颗粒压片(干式颗粒压片法)等。由此,利用上述赋形剂,可以通过公知的方法容易地将各种粉末片剂化。在使用赋形剂将粉末片剂化而得的片剂中,作为原料的粉末的含量与赋形剂的含量之比(粉末的含量/赋形剂的含量)优选为6.4以下。在使用赋形剂将粉末片剂化而得的片剂中,作为原料的粉末的含量与赋形剂的含量之比(粉末的含量/赋形剂的含量)优选为0.1以上。

[0032] 由于使用上述赋形剂而得的片剂对水具有优异的崩解性,例如在粉末是洗涤剂的情况下,仅通过将片剂例如投入洗衣机中就可以快速崩解,将洗涤剂溶解在水中,从而可以良好地发挥洗涤剂的洗涤效果。

[0033] 此外,在粉末是药物的情况下,当患者服用片剂时,片剂由于体内的体液而快速崩解,可以使药物在体内被平稳地吸收,从而表现优异的药效。

[0034] 实施例

[0035] 在下文中,将通过实施例来更详细地描述本发明,但本发明不受这些实施例的限制。

[0036] (实施例1~27、比较例1~9)

[0037] 将下述成分分别以表1和表2中所示的预定量供给至搅拌器,均匀混合以制备赋形剂:将木薯淀粉、玉米淀粉、马铃薯淀粉和大米淀粉作为淀粉;将结晶纤维素1(旭化成 Chemicals社制造,商品名“Ceolus”)、结晶纤维素2(荣研商事社制造,商品名“HEVATEN 101”)、结晶纤维素3(荣研商事社制造,商品名“HEVATEN 102”)作为结晶纤维素;将异麦芽酮糖醇、麦芽糖醇、麦芽糖和乳糖作为固化剂。

[0038] 将洗涤剂(花王社制造,商品名“Attack”)或调味料(味之素社制造,商品名“Knorr Cup Soup”)60质量份作为粉末,与赋形剂40质量份均匀混合,以制备片剂组合物。将该片剂

组合物供给至压片机,并通过直接压片法在14kN的压片压力下制成片剂(厚度:9mm、重量:3500mg)。

[0039] 以下述方式测定所得片剂的崩解性和硬度,其结果示于表1和表2中。

[0040] [崩解性]

[0041] 将获得的片剂投入24.9℃的1升水中。将片剂投入静止状态的水中,从片剂崩解了其体积的2/3时开始,以60rpm的转速搅拌水,并搅拌至片剂完全崩解。测定从将片剂投入静止状态的水中到片剂完全崩解的时间。将从将片剂投入静止状态的水中300秒后仍未崩解的情况设为“Bad”。

[0042] [硬度]

[0043] 使用硬度计(藤原制作所社制造,商品名“木屋式硬度计”)测定所得的片剂的硬度。

[0044]

[表1]

	赋形剂(质量份)													粉末	崩解性 (秒)	硬度 (kgf)
	木薯 淀粉	玉米 淀粉	马铃薯 淀粉	大米 淀粉	结晶纤维素			硬化剂								
					1	2	3	异麦芽糖醇	麦芽糖醇	麦芽糖醇	麦芽糖	乳糖				
实施例1	100	0	0	0	10	0	0	0	1.3	0	0	0	0	洗涤剂	66	6.0
实施例2	100	0	0	0	6	0	0	0	1.3	0	0	0	0	洗涤剂	120	5.8
实施例3	100	0	0	0	18	0	0	0	1.3	0	0	0	0	洗涤剂	48	4.4
实施例4	100	0	0	0	10	0	0	0	0.3	0	0	0	0	洗涤剂	75	4.4
实施例5	100	0	0	0	10	0	0	0	8	0	0	0	0	洗涤剂	121	4.8
实施例6	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0.3	0	0	0	洗涤剂	100	4.0
实施例7	100	0	0	0	10	0	0	0	0	1.3	0	0	0	洗涤剂	112	4.1
实施例8	100	0	0	0	10	0	0	0	0	8	0	0	0	洗涤剂	140	4.4
实施例9	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0.3	0	0	洗涤剂	80	4.1
实施例10	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	1.3	0	0	洗涤剂	95	4.3
实施例11	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	8	0	0	洗涤剂	130	4.5
实施例12	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0	0.3	0	洗涤剂	80	4.0
实施例13	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0	1.3	0	洗涤剂	95	4.2
实施例14	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0	8	0	洗涤剂	125	4.5
实施例15	100	0	0	0	10	0	0	0	0.65	0.65	0	0	0	洗涤剂	67	4.9
实施例16	100	0	0	0	10	0	0	0	0.65	0	0.65	0	0	洗涤剂	63	4.8
实施例17	100	0	0	0	10	0	0	0	0.65	0	0	0.65	0	洗涤剂	59	4.7
实施例18	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0.65	0.65	0.65	0	洗涤剂	73	4.5

[0045]

[表2]

	赋形剂(质量份)												粉末	崩解性 (秒)	硬度 (kgf)
	木薯 淀粉	玉米 淀粉	马铃薯 淀粉	大米 淀粉	结晶纤维素			硬化剂							
					1	2	3	异麦芽糖醇	麦芽糖醇	麦芽糖	乳糖				
实施例19	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0.65	0	0.65	洗涤剂	78	4.6
实施例20	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0.65	0.65	洗涤剂	86	3.9
实施例21	0	100	0	0	10	0	0	0	1.3	0	0	0	洗涤剂	140	4.8
实施例22	0	0	100	0	10	0	0	0	1.3	0	0	0	洗涤剂	130	4.5
实施例23	0	0	0	100	10	0	0	0	1.3	0	0	0	洗涤剂	135	4.5
实施例25	100	0	0	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	洗涤剂	60	3.8
实施例26	100	0	0	0	0	0	10	1.3	0	0	0	0	洗涤剂	58	4.0
实施例27	100	0	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	0	调味料	66	4.2
比较例1	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0	0	洗涤剂	102	2.1
比较例2	100	0	0	0	0	0	0	1.3	0	0	0	0	洗涤剂	73	1.8
比较例3	100	0	0	0	0	0	0	0	0	1.3	0	0	洗涤剂	79	2.2
比较例4	100	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1.3	0	洗涤剂	72	2.8
比较例5	100	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1.3	洗涤剂	100	2.5
比较例6	0	0	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	0	洗涤剂	Bad	14.2
比较例7	0	0	0	0	10	0	0	0	0	1.3	0	0	洗涤剂	Bad	14.7
比较例8	0	0	0	0	10	0	0	0	0	0	1.3	0	洗涤剂	Bad	13.9
比较例9	0	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0	1.3	洗涤剂	Bad	16.8

[0046] 工业实用性

[0047] 根据本发明的赋形剂,可以容易地将用于各种用途的粉末[例如洗涤剂、药物、调

味料、食品、保健食品、保健品(补充剂)等)制成片剂。所得的片剂在水中或体内快速崩解,并且该片剂具有优异的硬度。

[0048] (相关申请的相互参考)

[0049] 本申请基于2016年6月28日提交的日本国专利申请第2016-128150号而主张优先权,将该申请的整体公开内容通过引用并入本说明书中。