

公告本

第 88106556 號專利申請案
中文說明書修正頁

民國 90 年 3 月 修正
90.3.07
本 年 月 日
補充
A4
C4

申請日期	88 年 4 月 23 日
案 號	88106556
類 別	C01B 25/32

(以上各欄由本局填註)

499394

發 明 專 利 說 明 書

一、發明 名稱	中 文	含有糖類之組成物
	英 文	A saccharide-containing composition
二、發明 創作人	姓 名	(1) 横井慎一郎 (2) 西村嘉博 (3) 田中伸和
	國 籍	(1) 日本 (2) 日本 (3) 日本 (1) 日本國富山縣中新川郡上市町横法音寺五五番地 富士化学工業株式会社内
	住、居所	(2) 日本國富山縣中新川郡上市町横法音寺五五番地 富士化学工業株式会社内 (3) 日本國富山縣中新川郡上市町横法音寺五五番地 富士化学工業株式会社内
三、申請人	姓 名 (名稱)	(1) 富士化學工業股份有限公司 富士化学工業株式会社
	國 籍	(1) 日本
	住、居所 (事務所)	(1) 日本國富山縣中新川郡上市町横法音寺五五番地
	代 表 人 姓 名	(1) 西田光德

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

裝 訂 線

修正 07 年 日 月
補充

申請日期	88 年 4 月 23 日
案 號	88106556
類 別	

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書

一、發明 名稱	中 文	
	英 文	
二、發明人 創作	姓 名	(4) 幾島平二
	國 籍	(4) 日本
	住、居所	(4) 日本國富山縣中新川郡上市町橫法音寺五五番地富士化学工業株式会社内
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	國 籍	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

裝 訂 線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明(1)

本發明係有關粉體流動性良好、壓縮成型性高、以顆粒或錠劑等形態置入口腔內或水中時，具快連崩散性、溶解性、做為賦形劑，壓縮成型性提昇劑、崩解補助劑、改善服用性劑、口腔內連溶劑等有效，可用於醫藥品、食品等之含有磷酸氫鈣、糖類之噴霧乾燥粉末者。

先行技術中，磷酸氫鈣係做為鈣成份、磷酸成份之補強劑、制酸劑、製劑如：錠劑之賦形劑、錠劑或膠囊之稀釋劑或周結防止劑，被用於醫藥品、食品等。磷酸氫鈣其吸濕性小，為不活性者，與藥劑之反應性亦可，因此無著色，做為醫藥品、化粧品、食品等之賦形劑被使用之。

惟，磷酸氫鈣通常藉由被加熱 80℃ 以上之石灰與磷酸之生料沈澱後取得者，此沈澱之無水磷酸氫鈣為細，且密度高之粉末，其本身之結合性極小，若未配合澱粉等結合劑則無法用於直接壓縮式之錠劑化（特開昭 62-36010 號公報）。

亦即，先行技術之磷酸氫鈣，板狀 10 μm 以上之結晶粒子形態者其結合性差，做為賦形劑有其缺失點為公知者。為避免上述問題產生，被提出各種附與成形性於磷酸氫酸之各種方案。如：改變磷酸氫鈣之形狀或結晶形之方法。此具體例如特開昭 62-36010 號所公開之粉碎磷酸氫鈣後，微粒化之後，附與成形性之方法者，又，如本申請人公開於特開平 6-298505 號公報，特開平 7-118005 號公報（專利第 2700141 號），美國專利第 5,486,365 號明細書（1996 年）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂
線

五、發明說明(2)

、歐洲專利第 0 6 4 4 1 5 6 B 1 (1 9 9 8 年)
 、特願平 8 - 2 9 3 2 5 1 號 (特開平 1 0 -
 1 2 0 4 0 8 號公報) 中，結晶形使柱狀或鱗片狀之磷酸
 氫鈣或鱗片狀磷酸氫鈣噴霧乾燥係變為球狀物，附與成形
 性之方法等等。更具體者係將啓始原料之磷酸與鹼性鈣化
 合物或鹼金屬磷酸鹽與鈣化合物於具有配位能之多價有機
 酸之存在下反應後，一次粒子做成 $0.1 \sim 1 \mu m$ 之柱狀
 結晶之磷酸氫鈣之後附與成形性之方法，上記製法所取得
 之具柱狀之磷酸氫鈣或單針晶形結晶結構之磷酸氫鈣更進
 行水熱處理後，比表面積為 $20 \sim 60 m^2 / g$ ，靜態密度
 比容積為 $5 ml / g$ 以上，一次粒子做成 $0.1 \sim 5 \mu m$ ，
 其凝聚之二次粒子之平均粒徑做成 $2 \sim 10 \mu m$ 之鱗片狀
 之磷酸氫鈣，或將此鱗片狀磷酸氫鈣噴霧乾燥後，變為球
 狀物後附與成形性之方法，或於噴霧乾燥時之懸浮液中含
 此鱗片狀磷酸氫鈣與粘合劑之羥甲基纖維鈉、甲基纖維、
 羥乙基纖維等纖維衍生物等，可做成更具功能性之球狀物
 之方法等者。

又，於磷酸氫鈣中添加做為結合劑之澱粉、聚丙烯酸
 等之結合劑後可附與成形性者亦被提出。

惟，此等先行技術之磷酸氫鈣目前為止仍無法有效做
 為滿足賦形劑之特性者，更被期待改善其成形性、粉體之
 物性等之方便使用性。

本發明係以提供一種粉體流動性良好、壓縮成型性高
 、以顆粒或錠劑等形態置入口腔內或水中時，具有快速崩

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(3)

散性、溶解性、做為賦形劑、提昇壓縮成型性劑、崩散補助劑、服用性改善劑、口腔內速溶劑等有效，可用於醫藥品、食品等之含磷酸氫鈣、糖類之粉末組成物者為目的。

本發明者為解決上述課題，進行精密研討結果發現，藉由將水媒體、磷酸氫鈣及糖類之懸浮液噴霧乾燥後，取得之粉狀組成物與單獨噴霧乾燥磷酸氫鈣者相比較後，大大提昇成形性、服用性以及導水性（組成物中之磷酸氫鈣本身具有導水性之細孔結構，且噴霧乾燥後所取得之組成物具有無數微細之空孔，此形成導水結構），本發明因此發現進而完成本發明。

亦即，本申請範圍第1項相關之發明係將水媒體、磷酸氫鈣及糖類所組成之懸浮液噴霧乾燥後含粉狀之糖類、磷酸氫鈣之組成物者，申請範圍第2項相關之發明係附與噴霧乾燥之懸浮液中之磷酸氫鈣為含鱗片狀磷酸氫鈣之糖類、磷酸氫鈣之組成物者，申請範圍第3項之發明係其糖類為含赤蘚醇之糖類、磷酸氫鈣之組成物者，申請範圍第4項之發明係以噴霧乾燥磷酸氫鈣與糖類之水懸浮液者為特徵做成球狀粉末之含糖類、磷酸氫鈣組成物之製造方法者、申請範圍第5項之發明係以如申請範圍第1項、第2項或第3項之含糖類、磷酸氫鈣組成物做為主成份之賦形劑者、申請範圍第6項之發明係以如申請範圍第1項、2或3項之含糖類、磷酸氫鈣組成物做為主成份之提昇製劑用壓縮成型性劑者、申請範圍第7項之發明係以如申請範圍第1、2或3項之含糖類、磷酸氫鈣組成物做為主成

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(4)

份之崩解補助劑者、申請範圍第8項之發明係以如申請專利範圍第1、2或3項之含糖類、磷酸氫鈣組成物做成主成份之服用性改善劑、申請範圍第9項之發明係以如申請範圍第1、2或3項之含糖類、磷酸氫鈣組成物做為主成份之口腔內即(速)溶劑、申請範圍第10項之發明係如申請範圍第1、2或3項之含糖類、磷酸氫鈣組成物更以含有糖類為特徵之口腔即(速)溶劑者。

以下針對本發明之水媒體、磷酸氫鈣及糖類所組成之懸浮液經噴霧乾燥後取得含粉狀磷酸氫鈣、糖類組成物(以下，簡稱「組成物」)進行詳細說明。

此組成物比分別單獨噴霧乾燥磷酸氫鈣之水懸浮液、糖類水溶液更具優異之成形性，如：於錠劑壓縮成形時，可取得更高硬度者，同時：與其他賦形劑混合時亦極少降低硬度。又，磷酸氫鈣單獨之噴霧乾燥品於服用時出現特有之粗糙感，而本發明組成物無粗糙感，且有清爽之甜味，明顯改善服用性。通常，具有糖醇類者，含於口中後有清爽感。其中又以赤蘚醇、木糖醇為特別優良者。

另外糖類水溶液或於此將藥物分散或溶解後，進行噴霧乾燥後，噴霧乾燥後生成一次粒子之糖類藉由噴霧乾燥後部份融解，其結果所融解之糖類附著於噴霧乾燥機之內壁或介著融解狀態之糖類出現凝聚現象。因此，不僅降低噴霧乾燥物之收率(回收率)，粒徑不均，流動性亦不佳。

惟，於磷酸氫鈣之存在下調製糖類或糖類，藥物及／

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(5)

或別種制酸劑類之水懸浮液後，藉由噴霧乾燥後不僅糖類不融解，且，高收率可取得，具所期待之粒徑之流動性良好之糖類配合組成物之優點。做為防止此糖類之噴霧乾燥時之融解之方法者，噴霧乾燥之條件有入口溫度，出口溫度下降之虞，而此時時間變長，瞬時乾燥後，可大量連續性乾燥之噴霧乾燥法之特徵成缺失而無效率可言。

本發明之組成物係磷酸氫鈣懸浮於糖類，例如赤蘚醇之水溶液，再依常法以圓盤式或噴嘴式噴霧乾燥器於入口溫度約 250°C ，出口溫度 $60\sim 120^{\circ}\text{C}$ ，較佳者為 $70\sim 90^{\circ}\text{C}$ 之條件下進行噴霧乾燥後取得非晶質白色粉末。

本發明組成物之粒徑並無特別限制，所使用磷酸氫鈣之粒徑、使用量、懸浮液濃度、或所使用之糖類之種類，使用量、溶液濃度等之製造條件經變化後，可取得所期待之粒徑。本發明所使用之磷酸氫鈣，可為乾燥品，又藉由反應生成之磷酸氫鈣經過濾後取得之濕性粉末（以下稱「未乾燥品」）亦可。乾燥可藉由專利公報第

2700141號或特願平8-293251號（特開平10-120408號公報）所載之一次粒子之未乾燥品 $0.1\sim 1\mu$ 經噴霧乾燥後，又，「未乾燥品」直接以懸浮液之糖類水溶液或懸浮液與之混合後噴霧乾燥後取得球形粒子。

此組成物成形性之優點可依常法如：玉米澱粉負荷試驗等顯示出來。例如：先行技術之噴霧乾燥磷酸氫鈣配合

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

表

訂

線

五、發明說明(6)

20%之玉米澱粉後以3000kg之打錠壓之硬度比未添加玉米澱粉者約降低50%，相對的，本發明組成物配合30%玉米澱粉後仍具有意義之優異成形性。又，使用本發明組成物時，殘留壁面壓力，最大放出力亦比磷酸氫鈣單獨噴霧乾燥品低，且，白杵之作用變小，打錠適合性之改善亦被確認(參考後記實施例)。

本發明組成物其磷酸氫鈣之成形性愈增、藥物負荷性亦愈增，可降低壁面摩擦者。

本發明中組成物中之磷酸氫鈣與赤蘚醇等之糖類配合比並無特別限制，而針對0.5~99.5重量%之磷酸氫鈣其糖類如：赤蘚醇為0.5~99.5重量%，更佳者當磷酸氫鈣為40~99.5重量%時，赤蘚醇以0.5~60重量%者。

即使增加打錠壓，藉此配合比之變化亦不致影響殘留壁面，粘著等等之打錠障礙之影響可避免之。

本發明組成物單獨直接打錠時打錠壓500kgf可取得錠劑硬度為5~7kg之錠劑。另外，高壓打錠中確定錠劑硬度提高，而卻未顯示延長崩散時間。

本發明組成物之容積密度/Tap密度、水份含量、粒度分佈、安定性等結果為一般進行直打用賦形劑普通之範圍內者，可顯示良好之壓縮成形性、流動性、服用性及白色度。

又，摩擦低抗更少，因此，可避免一般錠劑製造時，原於打錠機之杵臼等磨損之困擾。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(7)

有關本發明組成物之製造方法由以下進行說明。

本發明組成物將磷酸氫鈣懸浮於糖類之水溶液後，再依常法，以圓盤式或噴嘴式噴霧乾燥機，入口溫度200℃、出口溫度100℃之條件下藉由噴霧乾燥後可取得非晶質白色粉末。粒徑如上述藉由適度選擇懸浮液濃度、噴霧方式及乾燥等條件後可調整所期待之粒徑。

本發明所使用之磷酸氫鈣如：磷酸氫鈣「TAB」(商品名、Lonupran公司製)、「Di TAB」(商品名、日研化學(公司)製)、「GS kalica」(商品名、協和化學(公司)製)球狀磷酸氫鈣「Fusicarín SG」(商品名、富士化學工業(公司)製)、鱗片狀磷酸氫鈣、無水磷酸氫鈣均可使用。無水磷酸氫鈣可為磷酸二氫鈣或第二磷酸鈣均可。磷酸氫鈣與無水磷酸氫鈣亦可併用之。較理想者為球狀之磷酸氫鈣「Fusicalin SG」、鱗片狀磷酸氫鈣「Fusicalin」。

又，該鱗片狀磷酸氫鈣經噴霧後取得球狀磷酸氫鈣為不易溶水，中性者，不與主導反應因此不致造成主藥製劑之不良影響，且，流動性、混合性良好，因此極易掌握。更且對水之親和性佳而容易懸浮，生料調整極為簡便。

做為糖類者有單糖類、中糖類、多糖類者，如：赤蘚醇、甘露醇、山梨糖類、二甲苯醇等糖醇、多醇、多糖、乳醯醇、噴霧乾燥乳糖、無水乳糖、乳糖、白糖、還原麥芽糖、水飴、蔗糖(sucrose)、果糖(fructose)、阿拉伯醇、赤蘚糖、葡萄糖、木糖、阿拉伯糖等例。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明(8)

本發明組成物於噴霧乾燥時醫藥品之製造中可併用慣用之無機或有機之固體製劑用載體如：澱粉、或結晶纖維、羥丙基甲基纖維、羥基丙基纖維、羧基甲基纖維、羥基丙基澱粉、羧基甲基澱粉鈉、Cross karmellose Na、羧基甲基纖維鈣等纖維類。

添加之糖類種類及濃度之選定其主成份及製劑之目的可藉由如適於成型性之改善、崩散性之改善、高齡者之治療領域口腔內崩散性製劑等適切進行之。又，可調成所期待之粒子徑尺寸。赤蘚醇、蔗糖、果糖(fructose)、木糖醇、甘露糖醇、阿拉伯醇等糖醇類易溶於水、熱酒精中，可做為溶液或懸浮液使用之，使用量並無特別限定。

只要如赤蘚醇、木糖醇之無熱量糖類者，特別適用於糖尿病患者。

另外，赤蘚醇、木糖醇等其清涼感伴有味覺，因此，極適用於口腔內即(速)溶製劑者。

本發明之糖類、磷酸氫鈣組成物藉由公知方法可做成錠劑。錠劑藉由將此者進行直打後，或於1或更多之後述藥效成份中，可更與結合劑、崩散劑、著色劑、香料、稀釋劑、潤滑劑等混合後使用之。

錠劑可形成各種所期待之形狀，不管圓形、橢圓形、赤銅礦形等大小、形狀均可。

本發明組成物可做為散劑、細粒劑、顆粒劑、膠囊劑等增量劑或做為類似芳香物質之油性物質吸著劑使用之。

本發明組成物可於適於醫藥品製造中所慣用之無機或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(9)

有機固體製劑用載體如：澱粉、結晶纖維、羥丙基甲基纖維等、羧基甲基纖維鈣、硬化油、滑石等賦形劑、金合歡、羥丙基纖維、褐藻酸、明膠、聚乙烯吡咯烷酮、部分 α 化澱粉等結合劑、硬脂酸、硬脂酸鎂、硬脂酸鈣、滑石、加氫植物油等潤滑劑、化工澱粉、鈣羧基甲基纖維、羥丙基甲基纖維、羥丙基纖維、羧基甲基澱粉等崩散劑、非離子性界面活性劑等共同進行適於口服或非口服之投與劑形之製劑化。

適於口服投與之劑形有錠劑、膠囊劑、散劑、細粒劑、顆粒劑、或其糖衣、薄膜塗佈劑等。適於局部投與者如軟膏、栓劑、貼佈劑、乳霜之吸著劑及粘稠化劑、凝膠等例。

本發明口腔內即(速)溶劑係以含本發明組成物做為功能性賦形劑，可以一般直接打錠法製造之口腔內速溶製劑者。

作成錠劑時，亦可併用本發明組成物常用之糖類。

此製劑可以打錠機直接將本發明組成物或於此中更加入適當之糖類及其他添加劑後進行打錠後取得。

以本發明組成物製成錠劑時，其配合比並無特別限定，而針對成形性其錠劑之重量為5~99重量%，較理想者為10~70重量%配合者宜，清爽感覺以40重量%~99重量%、口腔內即(速)溶劑作成時以50~95重量%者宜。

所取得之錠劑為即(速)溶性者，以口腔內咬不碎之

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (10)

條件下，進行崩散性試驗之測定後，可調製為 1 分以內崩散者。本發明組成物更藉由與適當之糖類組合後，可簡單取得其崩散時間均於 1 分以內之錠劑。依打錠壓、錠劑硬度所使用之組成物種類、配合量等而不同，並無特別限定，如：1 0 0 ~ 1 0 0 0 kg 之壓力下，可取得硬度為 1 . 1 ~ 1 4 . 5 kg 之錠劑者。通常於本發明組成物中添加崩散劑時，更可有效縮短崩散時間（參考後記實施例）。

以本發明所取得之組成物做為賦形劑等進行製劑化時，做為其藥效成份者，如：末梢神經用劑、解熱鎮痛消炎劑、催眠鎮靜劑、精神神經用劑等之中樞神經用藥、骨格鬆弛劑、自律神經劑等之末梢神經用藥、強心劑、不整脈用劑、利尿劑、血管擴張劑等之循環器官用藥、支氣管擴張劑、鎮咳劑等呼吸器官用藥、消化劑、整腸劑、制酸劑等消化管用藥、荷爾蒙劑、抗組織胺劑、維他命劑等之代謝性醫藥、抗潰瘍劑、抗生物質、化學療法劑、生藥浸劑等例。

本發明組成物適於（1）高齡者用醫藥品，如：降壓劑等循環器系用藥、抗脂血症藥等，（2）成形性不良之醫藥品，（3）或具有苦味等之味道不佳之醫藥品使用之。

本發明中其藥效成份種類並無特別限定。做為藥效成份之具體例如：感冒藥用活性成份、鼻炎用活性成份等例。感冒藥用活性成份之例如：解熱鎮痛消炎劑、支氣管擴

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

表
訂
線

五、發明說明 (11)

張劑、抗組織胺劑、鎮咳劑、去痰劑、鎮咳去痰劑、維生素、漢方藥浸劑等例。做爲鼻炎用活性成份之例者如：交感神經興奮劑、副交感神經阻斷劑、抗過敏劑、抗炎藥等例。解熱鎮痛消炎劑之例如：Acetoaminophen、phenacetin、鹽酸 phentamine 等之 Aniline 衍生物、ethenzamide、sasapyrine、水楊酸甲酯、水楊酸苯酯、水楊酸鈉、水楊酸膽鹼、aspyrine、aspyrine 鋁等之水楊酸衍生物等、Isopropylantipyrine、sulpyrine、phenylbutazone、ketophenylbutazone、Antypyrine、Aminopyridine 等之 Pynazolo 衍生物、Ibuprofen、ketoprofen、Oxacyprodin、Naproxene、Phenoprofen Ca、thiaprofenicacid 等之丙酸衍生物、fenbufen、diclofenac Na、Anfenac Na 等之苯基醋酸衍生物、Indometacin、Indometacin pharnecil、maleicacid proglumetacin、tolmetin Na 等之吲哚醋酸衍生物、mefenamicacid、flufenamic acid、tolfenamic acid 等之 Antranil 醋酸衍生物、Piroxycam、Anpiroxycam、tenoxycam 等之 oxykam 衍生物、鹽酸 benzydamine、epyrizole (mepirizole)、鹽酸 thinolidin、鹽酸 thiaramide 等、消炎酵素劑、serrapeptidase (商品名)、氯化 lysozyme 等例。此等解熱鎮痛消炎劑可單獨使用亦可以 2 種以上併用之。

做爲支氣管擴張劑者如：鹽酸 ephedrine、dl 鹽酸 methyl ephedrine、dl-鹽酸 methylephedrine saccharinate、鹽酸 Iso prenaline、硫酸 Iso protelenol、鹽酸

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (12)

methoxyphenamin、硫酸 olcyprenaline、鹽酸 chlorprenaline、鹽酸 trimethoquinol、硫酸 salbutamol、硫酸 terbutaline、硫酸 hexoprenaline、fumalic acid formoterol、溴化氫酸 phenoterol、鹽酸 procaterol、鹽酸 pruterol、鹽酸 clenpterol、鹽酸 mabuterol、aminophylline、theophylline diburophylline、proxiphylline、等之 xanthin 衍生物、溴化 frutropium、溴化 oxytropium 等之抗膽鹼等例。做為抗組織胺劑之例者如：diphenhydramine 等之 ethanolamine 系抗組織胺劑、dl-maleic acid chlorpheniramine、d-maleic acid chlorpheniramine 等之 propylamine 系抗組織胺劑、酒石酸 Alimemazine、鹽酸 Isothipendyl、鹽酸 promethazine、mequitazine、等之 phenothiazine 系抗組織胺劑、diphenylpyraline、maleic acid calbinoxamine、fumalic acid clemastine、鹽酸 Iproheptine、鹽酸 homochlorsiclydine、鹽酸 cyproheptadine、maleic acid dimethinden、鹽酸 triprolidine 等例。

做為鎮咳劑之例者如：phosphoric acid codein、磷酸 dihydro codein 等 codein 類、溴化氫酸 dextromethorphan、cloperastine、noscipindimemorphan、oxeladine、檸檬酸 pentoxyverine、鹽酸 eprazinone、鹽酸 chlobutynol、檸檬酸 Isoaminyl、鹽酸 Fominoben、鹽酸 chlophedanol、磷酸 benpropeline、Hydrocotarnine、dibunat Na 等例。

去痰劑之例如：guacolsulfonic acid 鉀、carbostein、鹽酸 L-ethylcystein、鹽酸 L-methylcystein、acetylcystein

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (13)

等之 cystein 系衍生物、 bromhexine、鹽酸 anbroxol 等例。做爲鎮咳化劑之例如：guaifenesin、thiopydine、oxymetebanol、鹽酸 Alloclamide、檸檬酸 carbetapentane、鹽酸 trimetho quinol、鹽酸 methoxy fenamine 等例。另外，做爲上述鎮咳劑、去痰劑、鎮咳去痰劑示例之藥效成份者有綜合鎮咳作用及／或去痰作用者。維生素例如：Fursultiamine、鹽酸 Fursultiamine、prosultiamine、octotiamine、thiamine disulfide、bisbentiamine、bisbutytiamine、bisIbutiamine、benfotiamine、鹽酸 cetotiamine 等之 Vitamine B₁ 或其衍生物或其鹽、Vitamine B₂、磷酸 Riboflavin Na、flavinadenine dinucleotide(FAD)、酪酸 Riboflavin 等 Vitamine B₂ 或其衍生物或其鹽、Vitamine C 等例。

做爲本發明藥物者亦含上述藥物藥理學上可容許之無機或有機酸等鹽類。酸之例如：鹽酸、磷酸、硫酸等、單寧酸、檸檬酸、hibenzicacid，等例。

滿方藥浸劑之例如：甘草、桂皮、葛根、杏仁、柴胡、生姜、人參、陳皮、半夏等例。做爲形成鼻炎藥之交感神經興奮劑（ α 受容體刺激劑）之例如：瘀血去除劑，如：鹽酸 phenylpropanolamine、鹽酸 ephedrine、鹽酸 phenylephrine 等、副交感神經阻斷劑之例如：Belladonna 總 Alkaloid 等，做爲抗過敏、抗炎藥之例如：tranexamic acid 等例。此等活性成份可單獨使用或 2 種以上組合使用均可。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

線

五、發明說明 (14)

該活性成份必要時亦可併用無水 caffeine、苯甲酸鈉咖啡啞、caffine 柴苓湯、caffeine (1 水和物) 等之 caffeine 類、氫氧化鎂、氧化鎂、碳酸鎂、矽酸鎂、硫酸鋁、合成 hydrotalcite(INN) [Alkamake (商品名)]、合成矽酸鋁、dihydroaluminium、胺基醋酸鹽、氫氧化鋁凝膠、Simaldrate、magnesium alumino silicatehydrate、氫氧化鋁、碳酸氫鈉共沈物、sucralfate 等、礦物質、胺基酸類等亦可。

以下顯示本發明所取得組成物之特點。(1) 改善錠劑成形性，(2) 改善流動性 (具體而言，直打用錠劑中具良好均一含量)，(3) 改善服用性 (清涼感及 / 或清涼感)，(4) 改善崩散性，(5) 口腔內即 (速) 溶錠有效者。

[圖面之簡單說明]

圖 1 係實施例 3 所取得之磷酸氫鈣 / 赤蘚醇 (7 5 / 2 5 重量 %) 噴霧乾燥品之掃描型電子顯微鏡 (S E M) 相片者。

圖 2 係實施例 6 所取得之磷酸氫鈣 / 赤蘚醇 (7 5 / 2 5 重量 %) 噴霧乾燥品之 S E M 相片者。

圖 3 係實施例 7 所取得之磷酸氫鈣 / 赤蘚醇 (7 5 / 2 5 重量 %) 噴霧乾燥品之 S E M 相片者。

圖 4 係實施例 8 所取得之磷酸氫鈣 / 赤蘚醇 (7 5 / 2 5 重量 %) 噴霧乾燥品之 S E M 相片者。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表
訂
線

五、發明說明 (15)

圖 5 係實施例 9 所取得之磷酸氫鈣 / 乳糖 (7 5 / 2 5 重量 %) 噴霧乾燥品之 S E M 相片者。

圖 6 係實施例 1 0 所取得之磷酸氫鈣 / 乳糖 (7 5 / 5 0 重量 %) 噴霧乾燥品之 S E M 相片者。

[發明之最佳實施形態]

以下針對本發明所取得組成物之用途進行詳細說明。

實施例 1

磷酸氫鈣與赤蘚醇配合比為 9 5 : 5 之組成物製造方法：

1 0 g 之赤蘚醇溶於 1 ℓ 之水中，攪拌下加入 1 9 0 g 之球狀磷酸氫鈣「fuzycarin SG」，以噴霧乾燥器「遠心方式噴霧器」於入口溫度 2 5 0 °C、出口溫度 1 0 0 ~ 1 1 0 °C 將取得懸浮液進行噴霧乾燥後，取得 1 8 0 g 之白色球狀顆粒狀物。

實施例 2 ~ 5

與實施例 1 同法製造球狀磷酸氫鈣「Fuzycarin SG」與赤蘚醇配合比為 8 5 : 5 ~ 5 0 : 5 0 之組成物。

其結果如第 1 表所示。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

線

五、發明說明(16)

第 1 表

實施例番號	磷酸氫鈣配合量 (重量%)	赤蘚醇配合量 (重量%)
2	8 5	1 5
3	7 5	2 5
4	6 5	3 5
5	5 0	5 0

物理化學性試驗：

將實施例 1 ~ 5 所取得之組成物成形性作成「玉米澱粉負荷試驗」之錠劑，進行比較錠劑硬度等之物性試驗。此「玉米澱粉負荷試驗」於其本身無成形性之玉米澱粉中添加本發明之組成物或磷酸氫鈣後，測定哪一階段可打錠之試驗方法。

實施例 6

利用磷酸氫鈣「A T A B」(商品名、Lonupran 公司製)與赤蘚醇與實施例 1 同法進行試料之調製，以下，與上述同法作成玉米澱粉負荷試驗之錠劑。

實施例 7

利用磷酸氫鈣「D i T A B」(商品名、日研化學(公司)製)與赤蘚醇與實施例 1 同法進行調製試料後，以

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

線

五、發明說明 (17)

下，與上述同法作成玉米澱粉負荷試驗之錠劑。

實施例 8

利用磷酸氫鈣「G S calica」(商品名、協和化學(公司)製)與赤蘚醇與實施例 1 同法調製試料後，以下，作成與上述相同之玉米澱粉負荷試驗之錠劑。

以下記第 2 表所示之配合比(重量%)稱取實施例 3 所取得之組成物，玉米澱粉「日本玉米澱粉(公司)製」、硬脂酸鎂〔日本油脂(公司)製〕使總量為 8 g。

又，使用試驗例號碼 1 ~ 6 中實施例 3 所取得之組成物，試驗例號碼 7 ~ 12 中做為先行技術品特開平 7 - 118005 號公報之製法取得之鱗片狀磷酸氫鈣「fuzycarin」、試驗例號碼 13 ~ 15 中實施例 6 ~ 8 分別取得之組成物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (18)

第 2 表

試驗例 番號	組成物	含量 (重量%)	玉米澱粉之含量 (重量%)	硬脂酸鎂 (重量%)
1	實施例 3	9 9	0	1
2	實施例 3	8 9	1 0	1
3	實施例 3	7 9	2 0	1
4	實施例 3	6 9	3 0	1
5	實施例 3	5 9	4 0	1
6	實施例 3	4 9	5 0	1
7	先行品	9 9	0	1
8	先行品	8 9	1 0	1
9	先行品	7 9	2 0	1
1 0	先行品	6 9	3 0	1
1 1	先行品	5 9	4 0	1
1 2	先行品	4 9	5 0	1
1 3	實施例 6	9 9	-	1
1 4	實施例 7	9 9	-	1
1 5	實施例 8	9 9	-	1

注) 試驗例號碼 7 ~ 1 2 之先行品係單獨使用鱗片狀磷酸
氫鈣「Fuzycarin」者。

將第 2 表之配合比各成份置入無吸濕之乾燥聚乙烯袋
中，密封後充份混合之後，以「打錠測定器・SK-02

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (19)

」〔商品名、三協 paiotac (公司) 製〕打錠後，求取打錠壓與硬度之關係。

打錠係 1 錠約 6 0 0 mg、打錠速度 1 0 m m / m i n、錠徑 1 1 . 3 m m、打錠壓於 5 0 0 k g f、1 0 0 0 k g f、2 0 0 0 k g f、3 0 0 0 k g f 下進行之。

其結果示於第 3 表。

第 3 表

試驗例番號	打 錠 壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
1	12.3	28.3	46.6	71.9
2	7.9	20.1	41.0	54.6
3	6.9	19.7	39.9	57.3
4	4.8	14.7	35.7	49.4
5	2.9	11.6	24.9	34.3
6	1.3	5.7	13.2	19.6
7	11.8	22.8	35.7	43.9
8	8.4	15.9	30.4	35.8
9	4.9	9.3	21.5	23.8
1 0	2.5	5.2	11.8	15.3
1 1	2.0	5.5	10.1	12.2
1 2	1.0	3.4	8.1	7.5

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明(20)

由上述第3表之結果證明本發明組成物所取得之錠劑與此相同含玉米澱粉量之對照生行品單獨配合系所取得之錠劑相比較後其任一打錠壓、硬度均高，特別是1000kg以上之打錠壓範圍者更為明顯。

以「打錠測定器SK-20」針對上述試料進行測定
①殘留壁面應力(Pwr)、②釋放力及③最大釋放力。

第4表

殘留壁面應力(Pwr：單位(kg/cm²))

試驗例番號	打錠壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
1	107	188	318	449
2	94	150	229	292
3	92	121	153	162
4	76	99	101	100
5	63	79	73	60
6	68	69	60	56
7	144	231	405	557
8	122	197	321	427
9	106	164	250	302
10	93	144	193	225
11	89	128	174	182
12	94	110	134	143
13	63	121	247	375
14	59	101	194	284

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明 (21)

由上述第 4 表之結果顯示，本發明組成物與同含量之玉米澱粉之對照磷酸氫鈣單味相比較後，所有處方及打錠壓中，由於壁面磨擦減少，而壓縮成形性良好。

第 5 表

最大放出力 (P e j)

試驗例番號	打 錠 壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
1	10.9	19.8	37.5	54.9
2	9.8	15.6	24.7	32.9
3	7.6	11.0	15.7	18.3
4	6.4	10.1	10.6	11.0
5	5.9	7.6	7.7	7.5
6	7.3	6.9	6.2	5.6
7	30.3	43.7	74.5	92.6
8	17.3	27.2	44.9	61.0
9	13.9	20.6	31.2	37.0
1 0	11.2	17.4	22.4	25.7
1 1	10.0	14.2	17.1	17.4
1 2	8.9	11.7	12.6	11.4
1 3	5.6	13.0	29.5	48.1
1 4	7.0	14.3	28.9	41.8
1 5	5.6	11.5	24.3	39.5

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (22)

本發明組成物比單獨處方磷酸氫鈣之釋放力低。

試驗例 1 6 ~ 1 9

使球狀磷酸氫鈣「Fuzycarin SG」與赤蘚醇之配合比為 9 5 : 5 (實施例 1)、8 5 : 1 5 (實施例 2)、7 5 : 2 5 (實施例 3)、6 5 : 3 5 (實施例 4) 之噴霧乾燥為 9 7 重量%、crosskarmellose Na 為 2 重量%、硬脂酸鎂〔日本油脂(公司)製〕為 1 重量%，且各處方量為 1 0 g 之試料秤取後，於乾燥之聚乙烯袋中混合之，調製打錠測定器用之試料後，作成試驗例 1 6 ~ 1 9 之錠劑。

第 6 表

試驗例 番號	各實施例組成物之 配合量 (重量%)	crosskarmellose Na (重量%)	硬脂酸鎂 (重量%)
1 6	(實施例 1) 9 7	2	1
1 7	(實施例 2) 9 7	2	1
1 8	(實施例 3) 9 7	2	1
1 9	(實施例 4) 9 7	2	1

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(23)

與上述同法測定打錠壓與硬度(單位:kg)之關係。

第7表

試驗例番號	打錠壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
16	6.4	13.6	27.1	38.9
17	7.4	16.3	33.4	49.1
18	8.7	20.6	40.0	57.2
19	6.1	16.5	40.3	56.0

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

由第7表之結果顯示，針對磷酸氫鈣之赤蘚醇配合比其任一配合比以打錠壓500kgf可取得做為裸錠之必要充份之硬度、打錠壓之比例其硬度上昇。

測定與上述相同之試驗例號碼16~19組成物之壁面殘留應力。

其結果，對於壁面殘留應力其崩散劑之影響力僅稍微出現，而赤蘚醇配合比之影響卻未顯現。

測定與上述相同之試驗例號碼16~19組成物之最大釋放力。其結果顯示，針對釋放力其崩散劑未有影響，而赤蘚醇配合比之影響變小。

崩散試驗：

依日本藥局方之方法將供試錠各3錠浸漬於日局方第

五、發明說明(24)

1 液中，測定錠劑形態完全崩散之時間。

第 8 表

試驗例番號	打 錠 壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
1 6	1.7	1.3	1.1	1.0
	1.7	1.3	1.2	1.1
	2.1	1.3	1.1	1.2
1 7	3.7	3.2	2.2	3.1
	3.8	3.1	2.1	3.0
	3.8	3.2	3.0	3.1
1 8	6.0	5.4	3.8	6.0
	6.1	5.5	4.4	5.6
	6.4	5.6	4.1	5.8
1 9	6.9	4.9	6.2	5.7
	7.4	4.7	6.0	5.7
	7.5	5.2	7.4	5.7

另外，表中之崩散時間為單位。

崩散時間減少磷酸氫鈣配合量，增加赤蘚醇配合量則出現延長傾向，而成形壓力並無影響。

綜合此等成形性、崩散劑評定之結果證明藉由糖之配合比可改善成形性與調整崩散性。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (25)

(服用性之評定)

味覺試驗：

藉由社內義工 6 人 (男女各 3 名) 進行味覺試驗。使用以試驗例號碼 19 之打錠壓 500 kg 所作成之錠劑，做為試料，評定味道、後味、清涼感、服用感、口腔內溶解性之優、普通、不良等級。以磷酸氫鈣「ATB」單味之錠劑作為對照。

第 9 表

試料	味・後味 (人數)	清涼感 (人數)	服用感 (人數)	口腔內溶 (崩) 解性	總合評價
試驗錠	稍甜、後 味爽口 (6 人)	有清涼感 、好感 (5 人)	漸漸於口 中溶、不 粘膩 (6 人)	1 ~ 2 分 溶解 (崩散)	優異
比較錠	無味 (6 人)	無 (6 人)	齒・舌中 粘膩 (5 人)	1 分以內 溶解 (崩散)	稍差

更選定崩散劑之種類，量於本發明組成物與之組合，藉由成形必要充份之硬度範圍做成一般可工業化之錠劑後

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (26)

，可取得具有因應其目的之即（速）溶性之錠劑，一般崩散度之錠劑。

實施例 9 ~ 1 0

使球狀磷酸氫鈣「Fuzycarin SG」與乳糖以下述配合後，與實施例 1 同法藉由噴霧乾燥後取得磷酸氫鈣 - 乳糖組成物，此做為實施例 9 ~ 1 0 之試料。

第 1 0 表

實施例番號	磷酸氫鈣配合量 (重量%)	乳糖配合量 (重量%)
9	7 5	2 5
1 0	5 0	5 0

比較例 1

使磷酸氫鈣以 9 9 重量%、硬脂酸鎂 1 重量%配合後，以下，與上述同法作成錠劑。

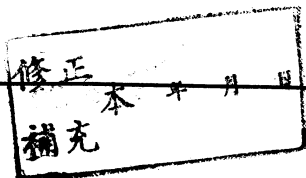
比較例 2

使乳糖為 9 9 重量%、硬脂酸鎂 1 重量%配合後，以下，與上述同法作成錠劑。

以上述實施例 9 ~ 1 0 與比較例 1 ~ 2 之試料，進行測試打錠壓與硬度、壁面殘留應力、最大釋放力間之關係

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線



五、發明說明 (27)

第 1 1 表

試驗例番號	打 錠 壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
實施例 9	1 9	3 7	6 1	7 7
實施例 1 0	6	1 5	2 8	4 3
比較例 1	1 2	2 5	3 4	3 3
比較例 2	1	3	7	9

與上述相同測試打錠壓與硬度之關係。

由上表結果證明，乳糖與磷酸氫鈣經噴霧乾燥後之組成物錠劑硬度比單獨乳糖較為高。藉由以上，即使乳糖亦可增加本發明組成物之成形性。

又，與上述相同進行壁面殘留應力之試驗。

第 1 2 表

試驗例番號	打 錠 壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
實施例 9	1 2 2	1 9 4	3 2 8	3 9 4
實施例 1 0	1 0 3	1 8 2	2 9 7	3 9 3
比較例 1	1 3 1	2 1 5	3 6 1	4 9 6
比較例 2	9 5	1 4 1	2 8 5	3 4 3

五、發明說明 (28)

壁面殘留應力其磷酸氫鈣與乳糖組成物之壁面殘留應力變低。

第 1 3 表
最大釋放力試驗

試驗例番號	打 錠 壓			
	500kgf	1000kgf	2000kgf	3000kgf
實施例 9	1 5	2 6	4 5	7 0
實施例 1 0	1 3	3 3	6 0	8 3
比較例 1	4 1	6 7	8 8	9 3
比較例 2	1 1	2 1	4 3	6 1

與上述同法測定最大釋放力。

釋放力其磷酸氫鈣與乳糖之組成物壁面殘留應力變低。

口腔內即 (速) 溶 (崩散) 劑之製造方法：

本發明組成物與糖類藉由打錠測定器進行打錠後製造之。

使用下述實施例 1 1 ~ 1 3 中以實施例 4 所製造之磷酸氫鈣 6 5 % 及赤蘚醇 3 5 % 之懸浮液經噴霧乾燥後取得之組成物。

實施例 1 1

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (29)

於實施例 4 所取得之 6 0 重量 % 噴霧乾燥粉末中與 3 9 重量 % 之乳糖及 1 重量 % 之硬脂酸鎂配合後，混合之後，取得一錠重量為 5 0 0 mg (錠劑直徑：1 1 . 3 m m) 之錠劑。成形壓力與硬度之關係以及口腔內之崩散性 (未咬碎) 如下表所示。

第 1 4 表

成型壓力 (kg)	硬度 (kg)	口腔內崩散時間 (分)
1 0 0	1 . 1	1 分以內
2 0 0	1 . 2	1 分以內
5 0 0	2 . 6	1 分以內
8 0 0	4 . 5	1 分以內

實施例 1 2

實施例 4 所取得之 6 0 重量 % 噴霧乾燥粉末中與 3 9 重量 % 之赤蘚醇、1 重量 % 之硬脂酸鎂配合後，混合之後，取得一錠重量為 5 0 0 mg (錠劑直徑：1 1 . 3 m m) 之錠劑。成形壓力與硬度之關係以及口腔內之崩散性 (咬不碎) 如下表所示。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (30)

第 1 5 表

成型壓力 (kg)	硬度 (kg)	口腔內崩散時間 (分)
2 0 0	1 . 5	1 分以內
5 0 0	2 . 5	1 分以內
8 0 0	3 . 1	1 分以內

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

實施例 1 3

實施例 4 所取得之 6 0 重量 % 噴霧乾燥粉末中配合 3 4 重量 % 之赤蘚醇、5 重量 % 之 Acsozyl 及 1 重量 % 之硬脂酸鎂後混合之後，取得一錠重量為 5 0 0 mg (錠劑直徑：1 1 . 3 mm) 之錠劑。成形壓力與硬度關係以及口腔內之崩散性 (咬不碎) 如下表所示。

第 1 6 表

成型壓力 (kg)	硬度 (kg)	口腔內崩散時間 (分)
5 0 0	1 . 5	1 分以內
7 5 0	2 . 5	1 分以內
1 0 0 0	3 . 1	1 分以內

由上述結果顯示口腔內之崩散時間為 1 分鐘以內者，為附與一般賦形劑所需之硬度以必要之成形壓力進行打錠

五、發明說明 (31)

仍充份顯示崩散性〔即(速)溶性〕。

實施例 1 4

於 5 0 0 ml 水中攪拌中加入 1 2 0 g 赤蘚醇，再加入 3 0 g 之 Argioxa、6 0 g 之矽酸鋁酸鎂「noicirin A」(商品名、富士化學工業(公司)製)及 3 6 g 之鱗片狀磷酸氫鈣(Fuzycarin)後攪拌之。再以微膠體質分散處理後之懸浮液以入口溫度 2 5 0 °C、出口溫度 8 1 °C 噴霧乾燥後，取得 1 8 3 g 之粉體(回收率 7 7 . 4 %)。

實施例 1 5

5 0 0 ml 水中攪拌中加入 1 2 0 g 木糖醇，再加入 3 0 g 之 Argioxa、6 0 g 之矽酸鋁酸鎂「noicirin A」及 3 6 g 之鱗片狀磷酸氫鈣「Fuzycarin」後攪拌之。再將微膠質分散處理之懸浮液經入口溫度 2 5 0 °C、出口溫度 9 1 °C 噴霧乾燥後，取得 1 2 9 g 粉體(回收率 5 4 . 2 %)。

實施例 1 6

5 0 0 ml 水中攪拌中加入 1 2 0 g 山梨糖醇後，再加入 3 0 g 之 Argioxa、6 0 g 之矽酸鋁酸鎂「noicirin A」及 3 6 g 之鱗片狀磷酸氫鈣「Fuzycarin」後攪拌之。再將微膠質分散處理之懸浮液經入口溫度 2 5 0 °C、出口溫度 9 0 °C 噴霧乾燥後，取得 9 6 . 5 g 之粉體(回收率

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (32)

40 . 5 %) 。

比較例 3

420 ml 水中攪拌中加入 120 g 之赤蘚醇後，再加入 30 g 之 Argioxa、60 g 之矽酸鋁酸鎂「noicirin A」後攪拌之。再將微膠質分散處理之懸浮液經入口溫度 250℃、出口溫度 90℃ 噴霧乾燥後，取得 136 g 粉體（回收率 66%）。

比較例 4

420 ml 水中攪拌中加入 120 g 木糖醇後，再加入 30 g 之 Argioxa、60 g 矽酸鋁酸鎂「noicirin A」後攪拌之。再將微膠體質分散處理之懸浮液經入口溫度 250℃、出口溫度 72℃ ~ 82℃ 噴霧乾燥後，取得 16.1 g 之粉末（回收率 7.9%）。

比較例 5

420 ml 水中攪拌中加入 120 g 木糖醇後，再加入 30 g 之 Argioxa、60 g 矽酸鋁酸鎂「noicirin A」後攪拌之。再將微膠體質分散處理之懸浮液經入口溫度 250℃、出口溫度 75℃ ~ 80℃ 噴霧乾燥後，取得 21.2 g 之粉末（回收率 11.5%）。

上述實施例 14 ~ 16 取得之糖類配合組成物之收率如第 17 表所示。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂
線

五、發明說明 (33)

爲了比較，以未添加磷酸氫鈣所製造之結果如比較例 3 ~ 5 所示。

第 1 7 表

	糖類	磷酸氫鈣	收率 (%)
實施例 1 4	赤蘚醇	「 Fuzycarin 」	7 7 . 4
實施例 1 5	木糖醇	「 Fuzycarin 」	5 4 . 2
實施例 1 6	山梨糖醇	「 Fuzycarin 」	4 0 . 5
比較例 3	赤蘚醇	-	6 6 . 0
比較例 4	木糖醇	-	7 . 9
比較例 5	山梨糖醇	-	1 1 . 5

於磷酸氫鈣之存在下藉由噴霧乾燥後，明顯改善收率

[產業上可利用性]

本發明可提供 (1) 改善錠劑成形性、(2) 改善流動性 (具體而言直打用錠劑中其含量均勻性佳)、(3) 改善服用性 [清涼感 (冰涼感)]、(4) 改善崩散性、(5) 做爲口腔內即 (速) 溶錠之崩散性等特點之含粉末狀磷酸氫鈣・糖類組成物者。

本發明組成物係噴霧乾燥磷酸氫鈣及糖類所組成之懸浮液之簡便方法下取得者。又，藉由適當變更噴霧乾燥條

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (34)

件可調製所期待之大小尺寸之粒子，因此可於不造成粉末屑下流入高速錠劑機之模中。更可於短時間內，大量取得均勻粒子。本發明組成物於無吸濕性、一般條件下具有安定、摩擦係數小、柔軟、粒子安定性佳之特點。

本發明組成物可有效做為賦形劑等者。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

A5
B5

四、中文發明摘要(發明之名稱：含有糖類之組成物)
粉體流動性良好，壓縮成型性高，以顆粒或錠劑等之形態置入口腔內或水中時，具有快速崩解性、溶解性，做為賦形劑，壓縮成型性提昇劑、崩解補助劑、服用性改善劑、口腔內速溶劑等有效，可用於醫藥品、食品等之含有磷酸氫鈣、糖類之噴霧乾燥粉末。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

英文發明摘要(發明之名稱：A saccharide-containing composition)

Spray-dried powders containing calcium hydrogen phosphate and a saccharide which have good powder-fluidity and high compression moldability, which are quickly disintegrated and dissolved when put into the oral cavity or water in the form of granule, tablet, etc., which are useful as excipient, compression moldability-increasing agent, disintegration aid, taking feeling-improving agent, intraoral quick dissoluble agent, etc., and which can be used in medicines, foods, etc.

訂

線

修正 90.3.07

本 年 月 日
補充

六、申請專利範圍

第 88106556 號專利申請案

中文申請專利範圍修正本

民國 90 年 3 月修正

1 . 一種含磷酸氫鈣・糖類之粉末狀組成物，其特徵係將水媒體、球狀或鱗狀磷酸氫鈣及赤蘚醇、二甲苯醇、山梨糖醇之糖類組成之懸浮液予以噴霧乾燥所得，

其中對於磷酸氫鈣 0 . 5 ~ 9 9 . 5 重量時，糖類為 0 . 5 ~ 9 9 . 5 重量%。

2 . 一種如申請專利範圍第 1 項之組成物之製造方法，其特徵係以噴霧乾燥水媒體、球狀或鱗片狀磷酸氫鈣及赤蘚醇、二甲苯醇、山梨糖醇之糖類所組成之懸浮液者。

3 . 一種賦形劑，其特徵係以錠劑重量之 5 重量% ~ 9 9 重量%之如申請專利範圍第 1 項之組成物做為主成份者。

4 . 一種提昇製劑之壓縮成形性劑、其特徵係以錠劑重量之 5 重量% ~ 9 9 重量%之如申請專利範圍第 1 項之組成物為主成份者。

5 . 一種崩散補助劑，其特徵係以錠劑重量之 5 重量% ~ 9 9 重量%之如申請專利範圍第 1 項之組成物為主成份者。

6 . 一種服用性改善劑，其特徵係以錠劑重量之 5 重量% ~ 9 9 重量%之如申請專利範圍第 1 項之組成物為主成份者。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

7. 一種口腔內即(速)溶劑,其特徵係以錠劑重量之50重量%~95重量%之如申請專利範圍第1項之組成物為主成份者。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

本音公
6月

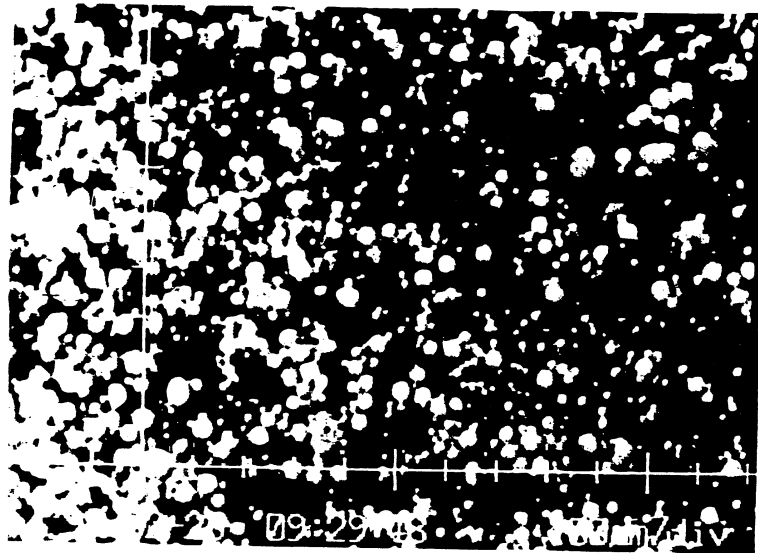


圖 1

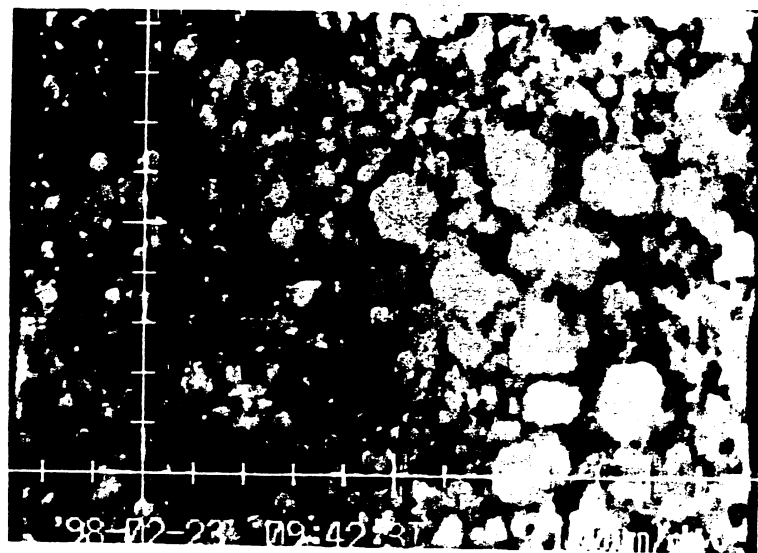


圖 2

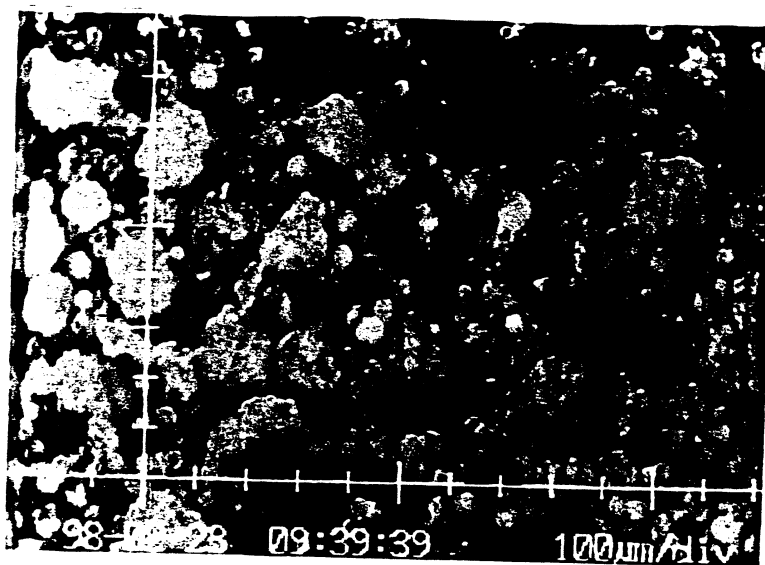


圖 3

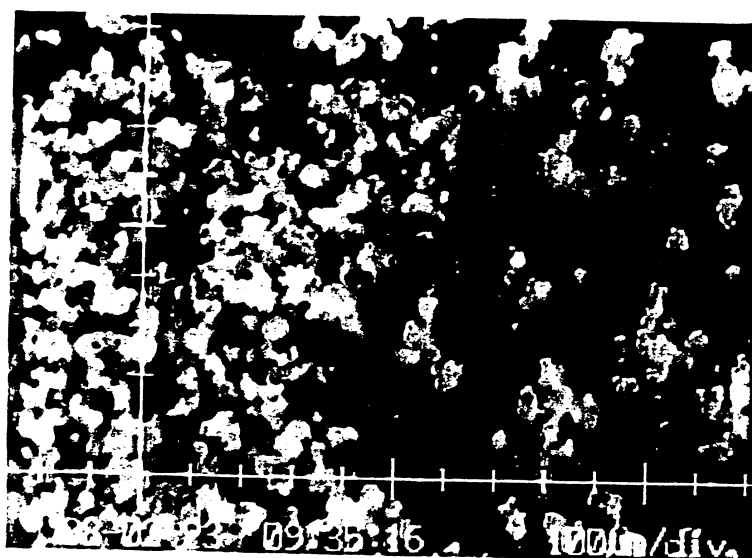


圖 4

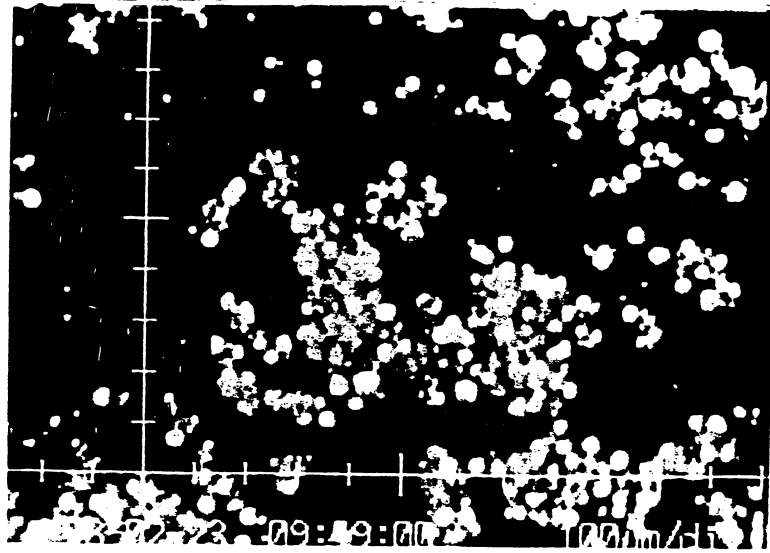


圖 5

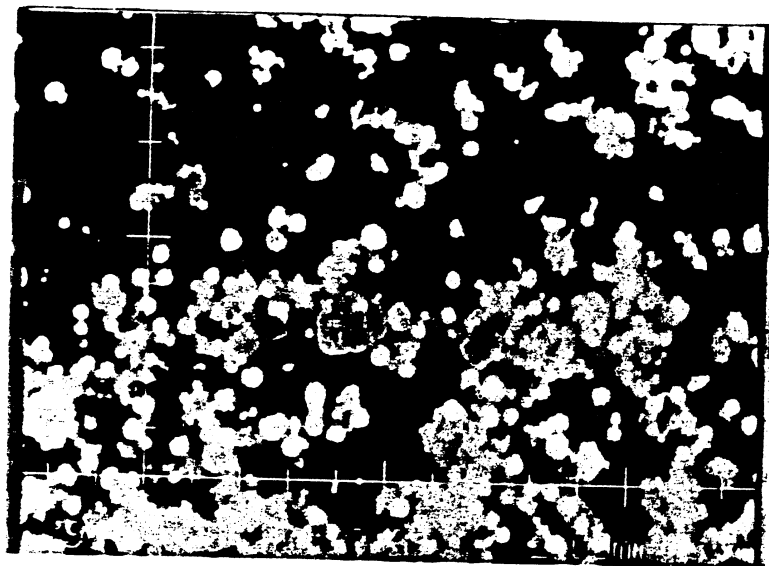


圖 6