(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7634160号
(P7634160)

(45)発行日　令和7年2月21日(2025.2.21)

(24)登録日　令和7年2月13日(2025.2.13)

(51)国際特許分類

Ａ６１Ｋ　33/08　(2006.01)		Ａ６１Ｋ	33/08
Ａ６１Ｋ　33/06　(2006.01)		Ａ６１Ｋ	33/06
Ａ６１Ｋ　36/68　(2006.01)		Ａ６１Ｋ	36/68
Ａ６１Ｋ　9/14　(2006.01)		Ａ６１Ｋ	9/14
Ａ６１Ｋ　9/16　(2006.01)		Ａ６１Ｋ	9/16

ＦＩ

請求項の数　8　（全10頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2020-172258(P2020-172258)
(22)出願日　令和2年10月13日(2020.10.13)
(65)公開番号　特開2021-70685(P2021-70685A)
(43)公開日　令和3年5月6日(2021.5.6)
審査請求日　令和5年10月3日(2023.10.3)
(31)優先権主張番号　特願2019-195376(P2019-195376)
(32)優先日　令和1年10月28日(2019.10.28)
(33)優先権主張国・地域又は機関
日本国(JP)

(73)特許権者　000002819
大正製薬株式会社
東京都豊島区高田３丁目２４番１号
(74)代理人　100118902
弁理士　山本 修
(74)代理人　100106208
弁理士　宮前 徹
(74)代理人　100196508
弁理士　松尾 淳一
(74)代理人　100106080
弁理士　山口 晶子
(72)発明者　桑田 亜矢
東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内
(72)発明者　泉川 雅裕

最終頁に続く

(54)【発明の名称】　固形製剤

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

（Ａ）酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、硫酸マグネシウム及び炭酸マグネシウムから選択される塩類下剤の少なくとも１種、及び（Ｂ）プランタゴ・オバタを含有し、

成分（Ａ）が酸化マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）酸化マグネシウム１質量部に対して１０～２０質量部であり、

成分（Ａ）が水酸化マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）水酸化マグネシウム１質量部に対して２～２０質量部であり、

成分（Ａ）が硫酸マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）硫酸マグネシウム１質量部に対して０．１～５質量部であり、

成分（Ａ）が炭酸マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）炭酸マグネシウム１質量部に対して０．１～１０質量部

であることを特徴とする経口用固形製剤。

【請求項２】

（Ｂ）プランタゴ・オバタの含有量が、固形製剤全体に対して１０～９５質量％である、請求項１に記載の固形製剤。

【請求項３】

（Ａ）酸化マグネシウムの含有量が、固形製剤全体に対して１～９質量％である、請求項１又は２に記載の固形製剤。

【請求項４】

（Ａ）水酸化マグネシウムの含有量が、固形製剤全体に対して５～４０質量％である、請求項１又は２に記載の固形製剤。
【請求項５】
さらに有機酸を含む請求項１～４のいずれかに記載の固形製剤。
【請求項６】
剤形が口腔内崩壊錠、チュアブル錠、素錠、顆粒剤、又は散剤である請求項１～５のいずれかに記載の固形製剤。
【請求項７】
（Ｂ）プランタゴ・オバタが、プランタゴ・オバタ種子、又はプランタゴ・オバタ種皮である、請求項１～６のいずれかに記載の固形製剤。
【請求項８】
（Ａ）酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、硫酸マグネシウム及び炭酸マグネシウムから選択される塩類下剤の少なくとも１種、及び（Ｂ）プランタゴ・オバタを含有し、
成分（Ａ）が酸化マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）酸化マグネシウム１質量部に対して１０～２０質量部であり、
成分（Ａ）が水酸化マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）水酸化マグネシウム１質量部に対して２～２０質量部であり、
成分（Ａ）が硫酸マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）硫酸マグネシウム１質量部に対して０．１～５質量部であり、
成分（Ａ）が炭酸マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）炭酸マグネシウム１質量部に対して０．１～１０質量部
である経口用固形製剤の製造方法であって、
前記（Ａ）成分、及び（Ｂ）プランタゴ・オバタを混合する工程を有する、前記固形製剤の製造方法。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、固形製剤に関し、不快味を有する有効成分を配合した優れた服用性を有する製剤に関する。
【背景技術】
【０００２】
酸化マグネシウムや水酸化マグネシウム、硫酸マグネシウム、炭酸マグネシウム等の塩類下剤は、大腸において水分の吸収を抑制し、腸内で便に水分を含ませ膨大・軟化させることで排便を促す作用があり、副作用の少ない緩下剤として広く用いられている。また、医薬品分野において制酸作用等を有するため、制酸剤や胃粘膜保護成分として、胃腸薬、瀉下薬、かぜ薬などの経口内服薬に広く利用されている。
【０００３】
ビサコジルは大腸粘膜に直接作用し、腸のぜん動運動を促進して排便を促す瀉下剤として、主に経口投与で広く使われている（特許文献１）。経口投与では、胃内で分解されて効果が低下したり、胃粘膜に無用な刺激をもたらすのを避けるため、腸内で溶けるように錠剤がコーティング等された腸溶製剤が多い。また腸溶製剤の場合、胃内でビサコジルが溶け出すおそれがあるため、服用前後１時間以内は制酸成分を含む胃腸薬の服用や牛乳の摂取を避けることとされている。
【０００４】
これらの有効成分は広く使用されている一方で、特有の不快味（苦味、塩味等）を有することが報告されている（特許文献２、特許文献３）。
【０００５】
経口投与製剤の不快味は、その服用感を損なわせ、服薬コンプライアンスを低下させる原因となる（特許文献４）。特に、散剤、顆粒剤や口腔内崩壊錠、チュアブル錠、素錠等の剤形の経口剤の場合、経口剤の成分と舌との接触が多くなるため、不快味による服用感

の悪化は顕著となる。
【０００６】
今までに、酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、ビサコジルの不快味を抑制する方法はいくつか報告されている。例えば、酸化マグネシウム、水酸化マグネシウムの不快味抑制方法としては、ステビアを組み合わせることにより、服用感、風味及び後味の改善された経口用組成物が得られたことが報告されている（特許文献５）。また、特許文献２では酸化マグネシウムや水酸化マグネシウム、炭酸マグネシウムのような塩基性無機塩類の不快味抑制方法として、乳酸塩及びスクラロースを組み合わせることにより、服用感、風味及び後味の改善された経口用組成物が得られたことが報告されている。またビサコジルにおいては、不快味のマスキング法として特定の賦形剤を含有したコーティング方法が報告されている（特許文献６）。しかし、これらの方法は、特定の甘味剤や特定の賦形剤の使用が必須になること及びコーティング工程を必要とすることから、原料コストの増大や工程時間の延長になり、未だ検討の余地がある。
【先行技術文献】
【特許文献】
【０００７】
【文献】特開２００７－５５９６９号公報
【文献】特開２０１６-２０４３５３号公報
【文献】特開２０１５－４２６３４号公報
【文献】特開２０１１-６４８１号公報
【文献】特開平９－５２８２７号公報
【文献】特開２０１０-１２０９５６号公報
【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【０００８】
本発明の目的は、塩類下剤のマグネシウム塩又はビサコジルの不快味を改善した固形製剤を提供することである。
【課題を解決するための手段】
【０００９】
本発明者らは、上記課題を解決すべく種々の検討を行った結果、驚くべきことに、膨潤性下剤であるプランタゴ・オバタを配合すると、不快味を改善することができ、さらには口腔内でのざらつきも改善することを見出し、服用性をさらに向上させることができ本発明を完成するに至った。
【００１０】
すなわち、本発明は、
（１）（Ａ）塩類下剤のマグネシウム塩、及びビサコジルからなる群から選ばれる少なくとも１種、及び（Ｂ）プランタゴ・オバタを含有し、
成分（Ａ）が酸化マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）酸化マグネシウム１質量部に対して１０～２０質量部であり、
成分（Ａ）が水酸化マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）水酸化マグネシウム１質量部に対して２～２０質量部であり、
成分（Ａ）が硫酸マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）硫酸マグネシウム１質量部に対して０．１～５質量部
であることを特徴とする固形製剤、
（２）（Ａ）塩類下剤のマグネシウム塩が酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、硫酸マグネシウム、及び炭酸マグネシウムからなる群より選ばれる少なくとも１種である（１）に記載の固形製剤。
（３）成分（Ａ）が炭酸マグネシウムの場合、（Ｂ）成分の含有量は（Ａ）炭酸マグネシウム１質量部に対して０．１～１０質量部であることを特徴とする（１）又は（２）に記載の固形製剤、

（４）（Ｂ）プランタゴ・オバタの含有量が、固形製剤全体に対して１０～９５質量％である、（１）～（３）のいずれかに記載の固形製剤、
（５）（Ａ）酸化マグネシウムの含有量が、固形製剤全体に対して１～９質量％である、（１）、（２）又は（４）のいずれかに記載の固形製剤、
（６）（Ａ）水酸化マグネシウムの含有量が、固形製剤全体に対して５～４０質量％である、（１）、（２）又は（４）のいずれかに記載の固形製剤、
（７）さらに有機酸を含む（１）～（６）のいずれかに記載の固形製剤、
（８）剤形が口腔内崩壊錠、チュアブル錠、素錠、顆粒剤、又は散剤である（１）～（７）のいずれかに記載の固形製剤、
（９）（Ｂ）プランタゴ・オバタが、プランタゴ・オバタ種子、又はプランタゴ・オバタ種皮である、（１）～（８）のいずれかに記載の固形製剤、
である。

【発明の効果】

【００１１】

本発明により、塩類下剤のマグネシウム塩又はビサコジルの不快味が抑制され、服用感が良好な固形製剤の提供が可能となった。

【発明を実施するための形態】

【００１２】

本発明における塩類下剤のマグネシウム塩としては、酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、炭酸マグネシウム、硫酸マグネシウム等が挙げられる。

【００１３】

本発明に用いられる酸化マグネシウムは、日本薬局方又は食品添加物に準拠した酸化マグネシウムであり、公知の方法により製造できるほか、市販のものを用いることができる。本発明の酸化マグネシウムの含有量は、服用性の観点から、本発明の固形製剤全体に対して、１～９質量％が好ましく、５～９質量％がより好ましい。

【００１４】

本発明における水酸化マグネシウムは日本薬局方外医薬品規格又は食品添加物に準拠した水酸化マグネシウムであり、公知の方法により製造できるほか、市販のものを用いることができる。本発明の水酸化マグネシウムの含有量は、服用性の観点から本発明の固形製剤全体に対して、１～５０質量％が好ましく、５～４０質量％がより好ましく、５～３３質量％がさらに好ましい。

【００１５】

本発明に用いられる炭酸マグネシウムは、日本薬局方又は食品添加物に準拠した炭酸マグネシウムであり、公知の方法により製造できるほか、市販のものを用いることができる。本発明の炭酸マグネシウムの含有量は、服用性の観点から、本発明の固形製剤全体に対して、１０～９０質量％が好ましく、１２～８６質量％がより好ましい。

【００１６】

本発明に用いられる硫酸マグネシウムは、日本薬局方又は食品添加物に準拠した硫酸マグネシウムであり、公知の方法により製造できるほか、市販のものを用いることができる。本発明の硫酸マグネシウムの含有量は、服用性の観点から、本発明の固形製剤全体に対して、１０～９０質量％が好ましく、２０～８６質量％がより好ましい。

【００１７】

本発明におけるビサコジルは日本薬局方に準拠したビサコジルであり、公知の方法により製造できるほか、市販のものを用いることができる。本発明のビサコジルの含有量は、服用性及びの観点から本発明の固形製剤全体に対して、０．０００１～１質量％が好ましく、０．０００１～０．８５質量％がより好ましい。

【００１８】

本発明におけるプランタゴ・オバタは、種子、茎、葉、根等、使用部位は限定しないが、膨潤性瀉下成分（サイリウムガム）を多く含む種子が好ましい。また種子を使用する場合は、種子全体、種皮のみのいずれを用いてもよいが、種皮又は種皮末がより好ましい。

プランタゴ・オバタは、水分を吸収して膨潤することにより腸壁を物理的に刺激すると共に、便量を増やすことで瀉下作用をもたらすものである。本発明のプランタゴ・オバタの１日あたりの服用量は、１０５０～１０５００ｍｇが好ましく、２１００～１０５００ｍｇがより好ましい。本発明のプランタゴ・オバタの含有量は、瀉下作用を発揮する観点から、本発明の固形製剤全体に対して１０～９５質量％が好ましい。

本発明において酸化マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、６０～９５質量％が好ましく、８４～９２質量％がより好ましい。水酸化マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、４０～９５質量％が好ましく、５０～９４質量％がより好ましく、５５～９２質量％がさらに好ましい。炭酸マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、５～８５質量％が好ましく、１０～８５質量％がより好ましい。硫酸マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、５～８５質量％が好ましく、１０～７７質量％が好ましい。ビサコジルを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、７５～９０質量％が好ましい。

【００１９】

また、本発明において、酸化マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、酸化マグネシウムの不快味抑制又は口腔内でのざらつき改善の点から、酸化マグネシウム１質量部に対して１０～２０質量部であり、更に好ましくは１２～２０質量部であり、より好ましくは１２～１７．５質量部である。

本発明の固形製剤において、水酸化マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、水酸化マグネシウムの不快味抑制又は及び口腔内でのざらつき改善の点から、水酸化マグネシウム１質量部に対して２～２０質量部であり、好ましくは２～１６．７質量部、より好ましくは３．３～１６．７質量部である。

本発明の固形製剤において、硫酸マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、硫酸マグネシウムの不快味抑制又は及び口腔内でのざらつき改善の点から、硫酸マグネシウム１質量部に対して０．１～５質量部であり、好ましくは０．１４～３．５質量部である。

本発明の固形製剤において、炭酸マグネシウムとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、炭酸マグネシウムの不快味抑制又は及び口腔内でのざらつき改善の点から、炭酸マグネシウム１質量部に対して０．１～１０質量部であり、好ましくは０．１～７質量部である。

【００２０】

また、本発明において、ビサコジルとプランタゴ・オバタを配合する場合、プランタゴ・オバタの配合量は、ビサコジル１質量部に対して１０５～５２５質量部が好ましい。

【００２１】

本発明の固形製剤には、可食性の酸として有機酸を使用することができる。例えば、クエン酸、コハク酸、アスコルビン酸、酢酸、グルコン酸、リンゴ酸、酒石酸、フマル酸、アジピン酸等の有機酸が挙げられ、これらは単独で又は２種以上を組み合わせて用いることができる。なかでもクエン酸、リンゴ酸、酒石酸が好ましい。これら有機酸の含有量は、本発明の固形製剤全体に対して、１～７０質量％が好ましく、１～５０質量％がより好ましく、１～３０質量％が更に好ましく、２．４～２７質量％が最も好ましい。

本発明の固形製剤は特に制限されるものではないが、例えば医薬品、医薬部外品、食品等が挙げられる。好ましくは医薬品、医薬部外品である。

【００２２】

本発明の製剤には、本発明の効果に支障のない限り、一般に用いられる種々の添加剤を含んでいてもよい。このような添加剤として、例えば、賦形剤、崩壊剤、結合剤、流動化剤、滑沢剤、酸味剤、発泡剤、甘味剤、嬌味剤、香料、着色剤、界面活性剤、可塑剤等が挙げられるが、不快味の観点からは甘味剤、矯味剤を含有することがより好ましい。

【００２３】

本製剤の剤形は、例えば、錠剤、顆粒剤、散剤が挙げられる。これらは、水に溶かして

服用するタイプの固形製剤であってもよい。本発明の錠剤には、日本薬局方の製剤通則に規定されている口腔内崩壊錠、チュアブル錠、素錠、発泡錠、分散錠及び溶解錠が含まれる。

【００２４】

また、本発明の固形製剤が水に溶かして服用するタイプの固形製剤であっても、塩類下剤のマグネシウム塩の不快味は改善される。また、本発明の固形製剤が、口腔内崩壊錠やチュアブル錠のように水なしでそのまま服用する製剤、あるいは口に含めてから水と一緒に飲み込む製剤の場合、口腔内でのざらつきも改善できる。

【００２５】

本発明の錠剤に割線や識別性向上のためのマーク、刻印を設けることができる。さらに、本製剤の錠剤は、丸錠であってもよいし、異型錠であってもよい。また、本発明においては、味を感じる観点から、口腔内崩壊錠、チュアブル錠、素錠、顆粒剤、散剤で実施する意義がより大きい。

本発明の錠剤には、従来行われている錠剤の製造方法により、製造することができる。すなわち、本製剤は、医薬有効成分と上述のような添加剤を混合機などの適当な混合機で混合して錠剤用混合末を製造した後、当該混合末を直接圧縮打錠する方法、または、顆粒を圧縮打錠する方法等により製造することができる。顆粒の製造方法は、乾式造粒法（スラッグ法、ローラーコンパクター法）、湿式造粒法により製造することができ、造粒装置としては、ローラーコンパクター、撹拌造粒法、流動層造粒法、押し出し造粒法、転動造粒法、噴霧造粒法等で製造すればよい。錠剤用混合末または当該混合末の顆粒を圧縮打錠する機械としては、単発打錠機、ロータリー式打錠機等を用いることができる。

【実施例】

【００２６】

以下に実施例及び比較例を挙げ、本発明をより詳しく説明するが、本発明はこれら実施例等に限定されるものではない。

【００２７】

（製剤の調製）

（実施例１～１２、比較例１～８）

表１～２に記載の配合組成で各原料成分を秤量した後、均一に混合した。混合物と適量の水及びエタノールの混液を加え乳鉢で練合、造粒した後、十分に乾燥させた。その後全量を篩（目開き５００μｍ）に通過させ造粒物を得た後、これを３包分とした。

【００２８】

＜服用性試験＞

実施例１～１２、及び比較例１～８の各製剤について、専門パネル２名による官能評価を行った。

服用方法は、製剤１包を口に含んでから水と一緒に服用する方法（服用方法１）と、水に溶かしてから服用する方法（服用方法２）の２パターンを行い、服用にはコップ１杯の水を用いた。

服用方法１については不快味とざらつきの評価を行い、服用方法２については不快味の評価を行った。不快味及びざらつきについて、下記に示す判断基準に従って評価を行い、専門パネルの平均値を算出した。

【００２９】

＜不快味＞

０：不快味を感じない

１：不快味をわずかに感じる

２：不快味をやや感じる

３：不快味を感じる

４：不快味を強く感じる

＜ざらつき＞

０：ざらつきを感じない

１：ざらつきをわずかに感じる
２：ざらつきをやや感じる
３：ざらつきを感じる
４：ざらつきを強く感じる
【００３０】
結果を表１に示す。
【００３１】
【表１】

評価結果	実施例1	実施例2	実施例3	実施例4	実施例5	実施例6	実施例7	実施例8	実施例9
成分名	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)
(A)水酸化マグネシウム	630	630	630	630	0	0	0	0	0
(A)ビサコジル	0	0	0	0	20	20	0	0	0
(A)酸化マグネシウム	0	0	0	0	0	0	600	600	600
(B)プランタゴ・オバタ種皮	10500	2100	1260	1260	2100	2100	10500	6000	7200
マンニトール	0	0	0	0	0	0	0	0	0
クエン酸	300	300	300	0	0	300	300	300	300
軽質無水ケイ酸	30	30	30	30	120	120	30	30	30
ヒドロキシプロピルセルロース	30	30	30	30	120	120	60	60	60
(B)/(A)	16.7	3.3	2	2	105	105	17.5	10	12
評価結果平均値									
不快味（服用方法1）	1.5	1.5	1.5	2	0	0.5	0	2	0.5
不快味（服用方法2）	－	0	0	0	－	－	－	－	0.5
ざらつき（服用方法1）	1.5	1	1	1	0	0	0	1.5	0

【００３２】
【表２】

	比較例1	比較例2	比較例3	比較例4	比較例5	比較例6	比較例7
成分名	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)
(A)水酸化マグネシウム	630	630	630	630	0	0	0
(A)ビサコジル	0	0	0	0	20	0	0
(A)酸化マグネシウム	0	0	0	0	0	600	600
(B)プランタゴ・オバタ種皮	0	630	630	16000	0	2100	5400
マンニトール	630	0	0	0	2100	0	0
クエン酸	0	0	300	300	0	300	300
軽質無水ケイ酸	30	30	30	30	30	30	30
ヒドロキシプロピルセルロース	30	30	30	30	120	60	60
(B)/(A)	-	1	1	25.4	-	3.5	9
評価結果平均値							
不快味（服用方法1）	3.5	4	3	1.5	2.5	3	2.5
不快味（服用方法2）	－	2.5	－	－	－	－	－
ざらつき（服用方法1）	2.5	3	2.5	2.5	0	2	1.5

【００３３】
表１～２に示すように、水酸化マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタを配合しない製剤及びプランタゴ・オバタを１質量部配合した製剤では不快味及びざらつきが感じられた（比較例１～３）。これに対し、水酸化マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタの配合比が２質量部である本発明品は不快味が軽減し、ざらつきも軽減した（実施例３、４）。また、製剤を水に溶かして飲むと不快味は全く感じられなかった（実施例３、４）。水酸化マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタの配合量を２５．４質量部まで増量すると、不快味は改善されたもののざらつきが生じた。さらに、服用時に口の中で製剤が一塊になってしまい、飲み込むことができなくなった（比較例４）。
【００３４】
また、表１に示すように、ビサコジルにおいてもプランタゴ・オバタを配合することにより不快味を改善できた（実施例５、６）。
【００３５】
酸化マグネシウムについて、ざらつきはいずれの処方においても２以下であったが、不快味はプランタゴ・オバタの配合量の増大に伴い軽減する傾向が示された。酸化マグネシウム１質量部に対しプランタゴ・オバタを３．５質量部配合した製剤及び９質量部配合し

た製剤は、両者とも不快味は感じた。一方、酸化マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタを１０質量部以上配合すると不快味は改善された（実施例７～９、比較例６～７）。

【００３６】

【表３】

	比較例8	実施例10	実施例11	実施例12	実施例13
成分名	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)
(A)硫酸マグネシウム	15000	15000	3000	0	0
(A)炭酸マグネシウム	0	0	0	8000	1600
(B)プランタゴ・オバタ種皮	1050	2100	10500	1050	10500
クエン酸	300	300	300	300	300
軽質無水ケイ酸	30	30	30	30	30
ヒドロキシプロピルセルロース	30	30	30	30	30
(B)/(A)	0.07	0.14	3.5	0.1	6.6
評価結果平均値					
不快味（服用方法1）	4.0	2.0	1.0	1.5	0
ざらつき（服用方法1）	2.0	0.5	1.0	0.5	1.0

表３に示すように、硫酸マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタを０．０７質量部配合した製剤では、不快味を抑制することができなかった（比較例８）。これに対し、硫酸マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタの配合比が０．１４質量部以上、炭酸マグネシウム１質量部に対してプランタゴ・オバタの配合比が０．１質量部以上、である本発明品は不快味が軽減し、ざらつきもなかった（実施例１０～１３）。

【００３７】

（製剤例）

（製剤例１、２、４、５）

１２錠中に下記成分および分量をとり、日局製剤総則に準じ製造した。

（製剤例３、６）

６包中に下記成分および分量をとり、日局製剤総則に準じ製造した。

（製剤例７、８）

２４錠中に下記成分および分量をとり、日局製剤総則に準じ製造した。

【００３８】

本発明の製剤例を以下表４に示す。

【００３９】

【表４】

	製剤例1	製剤例2	製剤例3	製剤例4	製剤例5	製剤例6	製剤例7	製剤例8
剤形	チュアブル錠	錠剤	顆粒剤	チュアブル錠	錠剤	顆粒剤	チュアブル錠	錠剤
一般名	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)	処方量(mg)
プランタゴ・オバタ種皮	2100	2100	2100	2100	2100	6000	6000	6000
ビサコジル	20	20	-	-	-	-	-	-
水酸化マグネシウム	-	-	630	630	630	-	-	-
酸化マグネシウム	-	-	-	-	-	600	600	600
結晶セルロース	210	420	-	210	420	-	150	210
低置換度ヒドロキシプロピルセルロース	210	180	360	210	180	360	60	180
マンニトール	210	-	-	210	-	-	150	-
砂糖	30	-	300	30	-	300	30	-
クエン酸	150	-	1500	150	-	900	150	-
アスコルビン酸	-	-	480	-	-	450	-	-
アスパルテーム	60	-	60	60	-	60	120	-
アセスルファムカリウム	-	30	30	-	-	30	-	-
軽質無水ケイ酸	105	105	105	105	105	105	60	105
ステアリン酸マグネシウム	30	30	-	30	30	-	60	60

【産業上の利用可能性】

【００４０】

本発明によれば、塩類下剤のマグネシウム塩又はビサコジルの不快味を改善した固形製剤を提供することができる。

フロントページの続き

(51)国際特許分類　　FI
Ａ６１Ｋ　9/20 (2006.01)　　Ａ６１Ｋ　9/20
Ａ６１Ｐ　1/10 (2006.01)　　Ａ６１Ｐ　1/10

東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内

審査官　石井 裕美子

(56)参考文献　国際公開第２００８／１４１３６８（WO，Ａ１）
特開２００１－１９９８９４（ＪＰ，Ａ）
特表平０７－５０８８８０（ＪＰ，Ａ）
特表平０８－５１０１２６（ＪＰ，Ａ）
特開２００１－２２０３５２（ＪＰ，Ａ）
Veterinary journal，2014年，Vol.202, No.3，pp.608-611

(58)調査した分野　(Int.Cl.，ＤＢ名)
Ａ６１Ｋ　３１／００－３３／４４
Ａ６１Ｋ　３６／００－３６／９０６８
Ａ６１Ｋ　９／００－ ９／７２
Ａ６１Ｋ　４７／００－４７／６９
Ａ６１Ｐ　１／００－４３／００
ＪＳＴＰｌｕｓ／ＪＭＥＤＰｌｕｓ／ＪＳＴ７５８０（ＪＤｒｅａｍＩＩＩ）
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ／ＭＥＤＬＩＮＥ／ＥＭＢＡＳＥ／ＢＩＯＳＩＳ（ＳＴＮ）