(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2019-0022709
(43) 공개일자 2019년03월06일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C08L 3/02 (2006.01) *A61K 9/00* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) *C08K 5/1539* (2006.01)
C08L 1/02 (2006.01) *C11D 17/04* (2006.01)
C11D 3/37 (2006.01)
(52) CPC특허분류
C08L 3/02 (2013.01)
A61K 9/0095 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2019-7002187
(22) 출원일자(국제) 2017년06월27일
심사청구일자 없음
(85) 번역문제출일자 2019년01월23일
(86) 국제출원번호 PCT/JP2017/023475
(87) 국제공개번호 WO 2018/003762
국제공개일자 2018년01월04일
(30) 우선권주장
JP-P-2016-128150 2016년06월28일 일본(JP)

(71) 출원인
가부시키가이샤 니폰 고킨 소고 겐큐쇼
일본국 나라켄 나라시 니조쵸 3쵸메 3반 8고
(72) 발명자
후지노, 아키히로
일본 6308002 나라켄 나라시 니조쵸 3쵸메 3반 8고 가부시키가이샤 니폰 고킨 소고 겐큐쇼 내
(74) 대리인
장수길, 홍미란

전체 청구항 수 : 총 6 항

(54) 발명의 명칭 **부형제 및 정제**

(57) 요 약

본 발명은, 분말상의 세제, 분말상의 약제 등의 기능성 분말을 물 또는 체내에 있어서 빠르게 붕괴 가능한 정제로 할 수 있는 부형제를 제공한다. 본 발명의 부형제는 분말을 정제화하기 위한 부형제이며, 전분과, 결정 셀룰로오스와, 말티톨, 이소말토, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 경화제를 함유하는 것을 특징으로 하기 때문에, 분말을 범용의 요령으로 용이하게 정제화할 수 있으며, 얻어진 정제는 물에 대한 용해성이 우수하고, 정제를 수중에 투입한 후, 빠르게 용해함과 함께, 우수한 경도를 갖고 있으며, 보관 또는 수송시에 가해지는 외력에 의해 결함 등의 손상을 발생하는 경우는 거의 없어, 소정의 형상을 대략 유지할 수 있다.

(52) CPC특허분류
A61K 9/2018 (2013.01)
A61K 9/2054 (2013.01)
A61K 9/2059 (2013.01)
C08K 5/1539 (2013.01)
C08L 1/02 (2013.01)
C11D 17/044 (2013.01)
C11D 3/37 (2013.01)

명 세 서

청구범위

청구항 1

말티톨, 이소말토, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 경화제와, 전분과, 결정 셀룰로오스를 함유하는 것을 특징으로 하는 부형제.

청구항 2

제1항에 있어서, 전분 100질량부, 결정 셀룰로오스 5 내지 20질량부 및 경화제 0.2 내지 10질량부를 함유하고 있는 것을 특징으로 하는 부형제.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 전분이 타피오카 전분인 것을 특징으로 하는 부형제.

청구항 4

제1항 또는 제2항에 있어서, 분말의 정제화에 사용되는 것을 특징으로 하는 부형제.

청구항 5

제1항에 기재된 부형제와, 원료가 되는 분말을 함유하고 있는 것을 특징으로 하는 정제.

청구항 6

제5항에 있어서, 분말의 함유량과 부형제의 함유량의 비(분말의 함유량/부형제의 함유량)가 6.4 이하인 것을 특징으로 하는 정제.

발명의 설명

기 술 분 야

[0001] 본 발명은, 부형제 및 정제에 관한 것이다.

배 경 기 술

[0002] 종래부터, 세정제를 정제의 형태로 하고, 사용시에 물에 용해시켜 사용하는 세정 정제가 제공되고 있다.

[0003] 이러한 세정 정제로서는, 예를 들어 특허문헌 1에, 정제가: a) 그의 안에 적어도 하나의 형(型)을 갖는 성형체 형태의 제1 상; 및 b) 상기 형 안에 접착하여 포함되는 압축체 형태의 제2 상을 포함하고, 정제 조성물은 주로 제2 상에 농축되어 있는 하나 또는 그 이상의 세정 활성 성분을 포함하고, 그리고 제2 상은 부가적으로 바인더를 포함하는 것인, 세탁기에서의 사용에 적합한 다상 세정 정제가 제안되어 있다.

[0004] 또한, 의약의 분야에 있어서, 분말상의 약제는, 환자가 약제를 복용할 때에 흘릴 우려가 있거나, 처방전에서 처방한 양의 약제를 확실하게 환자가 복용하도록, 약제를 정제화하고 있다.

선행기술문헌

특허문헌

[0005] (특허문헌 0001) WO00/04115

발명의 내용

해결하려는 과제

[0006] 그러나, 특허문헌 1의 다상 세정 정제는 물에 대한 용해가 불충분하며, 물에 대한 용해에 시간을 요한다는 문제를 갖고 있다.

[0007] 본 발명은, 분말상의 세제, 분말상의 약제 등의 분말을 물 또는 체내에 있어서 빠르게 붕괴 가능하면서도 우수한 경도를 갖는 정제로 할 수 있는 부형제 및 이 부형제를 사용하여 정제화된 정제를 제공한다.

과제의 해결 수단

[0008] 본 발명의 부형제는,

[0009] 말티톨, 이소말토, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 경화제와,

[0010] 전분과,

[0011] 결정 셀룰로오스를 함유하는 것을 특징으로 한다.

발명의 효과

[0012] 본 발명의 부형제에 의하면, 분말을 범용의 요령으로 용이하게 정제화할 수 있다. 그리고, 얻어진 정제는 물에 대한 용해성이 우수하고, 정제를 수중에 투입한 후, 빠르게 용해한다. 또한, 얻어진 정제는 우수한 경도를 갖고 있으며, 보관 또는 수송시에 가해지는 외력에 의해 결함 등의 손상을 발생하는 경우는 거의 없어, 소정의 형상을 대략 유지할 수 있다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0013] 본 발명의 부형제는, 전분과, 결정 셀룰로오스와, 말티톨, 이소말토, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 경화제를 함유한다.

[0014] 본 발명의 부형제는, 분말을 정제화하기 위한 부형제이며, 전분과, 결정 셀룰로오스와, 말티톨, 이소말토, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 경화제를 함유한다.

[0015] 부형제에는 전분이 포함되어 있다. 전분으로서는 특별히 한정되지 않으며, 예를 들어 감자 전분, 고구마 전분, 옥수수 전분, 타피오카 전분, 소맥분 전분, 쌀 전분, 콩 전분, 칡 전분, 고사리 전분, 녹말 전분 등을 들 수 있으며, 타피오카 전분이 바람직하다. 또한, 전분은, 단독으로 사용되어도 2종 이상이 병용되어도 된다.

[0016] 부형제에는, 결합제로서 결정 셀룰로오스가 함유되어 있다. 「결정 셀룰로오스」란, 천연 셀룰로오스계 물질을 산으로 부분적으로 해중합하여 정제한 것을 말하며, 예를 들어 메톨로오스, 메틸셀룰로오스, 카르복시메틸셀룰로오스, 히드록시에틸셀룰로오스, 히드록시프로필메틸셀룰로오스, 히프로멜로오스, 카르멜로오스나트륨 등을 들 수 있다. 천연 셀룰로오스계 물질로서는, 예를 들어 목재, 대나무, 밀짚, 볏짚, 코튼, 모시풀, 바가스, 케나프, 비트 등의 식물로부터 얻어지는 셀룰로오스, 멍게로부터 얻어지는 셀룰로오스, 아세트산균 등의 박테리아로부터 얻어지는 셀룰로오스 등을 들 수 있다. 천연 셀룰로오스계 물질은, 원료로서 단독으로 사용되어도 2종 이상이 병용되어도 된다. 결정 셀룰로오스는, 단독으로 사용되어도 2종 이상이 병용되어도 된다.

[0017] 결정 셀룰로오스의 평균 중합도는, 평균 중합도가 500 이하인 것이 바람직하다. 결정 셀룰로오스의 평균 중합도는, 「제14 개정 일본 약전」(히로카와 쇼텐 발행)의 결정 셀룰로오스 확인 시험 (3)에 규정되는 구리 에틸렌디아민 용액에 의한 환원비 점도법에 의해 측정할 수 있다. 결정 셀룰로오스의 평균 중합도는 10 내지 500이 바람직하고, 10 내지 300이 보다 바람직하다. 결정 셀룰로오스의 평균 중합도가 상기 범위 내이면, 부형제를 사용하여 얻어진 정제는 수중 또는 체내에 있어서 우수한 붕괴성을 갖는다.

[0018] 결정 셀룰로오스의 평균 중합도의 제어 방법으로서는, 예를 들어 천연 셀룰로오스계 물질의 가수분해 처리를 들 수 있다. 가수분해 처리에 의해, 천연 셀룰로오스계 물질 내부의 비정질 셀룰로오스의 해중합이 진행되고, 평균 중합도가 작아진다. 또한 동시에, 가수분해 처리에 의해 상술한 비정질 셀룰로오스에 더하여, 헤미셀룰로오스 및 리그닌 등의 불순물도 제거되기 때문에, 천연 셀룰로오스계 물질 내부가 다공질화된 결정 셀룰로오스가 얻어진다.

[0019] 가수분해의 방법은 특별히 제한되지 않지만, 산 가수분해, 열수 분해, 스팀 익스플로전, 마이크로파 분해 등을 들 수 있다.

[0020] 결정 셀룰로오스의 입자 형상(L/D)은 20 이하가 바람직하고, 15 이하가 보다 바람직하고, 10 이하가 더욱 바람

직하고, 5 이하가 더욱 더 바람직하고, 5 미만이 특히 바람직하고, 4 이하가 가장 바람직하다. 결정 셀룰로오스의 입자 형상(L/D)의 하한은 그의 정의로부터 1이다.

[0021] 결정 셀룰로오스의 입자 형상(L/D)은 하기의 요령으로 측정된 값을 말한다. 우선, 결정 셀룰로오스를 1질량% 농도의 순수 현탁액으로 하고, 고전단 호모지나이저(예를 들어, 닛본 세이끼사제의 상품명 「엑셀 오토 호모지나이저 ED-7」)를 사용하여 회전수 15,000rpm으로 5분간에 걸쳐서 교반하여 수분산체를 제작한다. 수분산체를 순수로 희석하여 0.1 내지 0.5질량%의 분산액으로 한다. 이 분산액을 마이카 상에 캐스트하고, 풍건된 것을 고분해능 주사형 현미경(SEM), 또는 원자간력 현미경(AFM)으로 결정 셀룰로오스를 관찰한다. 관찰된 결정 셀룰로오스로부터 임의로 100개 추출하여, 각 결정 셀룰로오스의 관찰된 방향에 있어서의 긴 직경(L) 및 짧은 직경(D)을 측정하여 긴 직경(L)/짧은 직경(D)을 산출하고, 100개의 결정 셀룰로오스의 긴 직경(L)/짧은 직경(D)의 상가 평균값을 결정 셀룰로오스의 입자 형상(L/D)으로 한다. 또한, 결정 셀룰로오스의 긴 직경(L) 및 짧은 직경(D)은 하기의 요령으로 측정된다. 결정 셀룰로오스를 포위할 수 있는 최소 직경의 진원을 그린다. 이 진원의 직경을 긴 직경으로 하면서도 결정 셀룰로오스를 포위할 수 있는 최소 면적의 타원을 그리고, 이 타원의 긴 직경 및 짧은 직경을 각각, 결정 셀룰로오스의 긴 직경(L) 및 짧은 직경(D)으로 한다.

[0022] 부형제 중에 있어서의 결정 셀룰로오스의 함유량은, 전분 100질량부에 대하여 5 내지 20질량부가 바람직하고, 6 내지 18질량부가 더욱 바람직하고, 7 내지 16질량부가 더욱 더 바람직하고, 8 내지 15질량부가 특히 바람직하고, 8 내지 12질량부가 가장 바람직하다. 결정 셀룰로오스의 함유량이 5질량부 이상이면, 부형제를 사용하여 얻어진 정제의 경도가 향상된다. 결정 셀룰로오스의 함유량이 20질량부 이하이면, 부형제를 사용하여 얻어진 정제의 붕괴성이 향상된다.

[0023] 부형제에는, 경화제로서 말티톨, 이소말토, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상을 함유하고 있다. 경화제는, 이소말토를 포함하는 것이 바람직하다. 또한, 경화제는, 단독으로 사용되어도 2종 이상이 병용되어도 된다.

[0024] 경화제는 2종 이상이 병용되는 경우, 말티톨, 말토오스 및 락토오스로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 화합물과, 이소말토를 포함하는 것이 바람직하다.

[0025] 부형제 중에 있어서의 경화제의 함유량은, 전분 100질량부에 대하여 0.2 내지 10질량부가 바람직하고, 0.3 내지 8질량부가 더욱 바람직하고, 0.5 내지 5질량부가 더욱 더 바람직하고, 0.6 내지 3질량부가 특히 바람직하고, 0.7 내지 2질량부가 가장 바람직하다. 경화제의 함유량이 0.2질량부 이상이면, 부형제를 사용하여 얻어진 정제의 경도가 향상된다. 경화제의 함유량이 10질량부 이하이면, 부형제를 사용하여 얻어진 정제의 붕괴성이 향상된다.

[0026] 또한, 부형제에는, 그의 물성을 손상시키지 않는 범위 내에서, 활택제, 효소 등의 첨가제가 함유되어 있어도 된다. 활택제로서는, 예를 들어 스테아르산칼슘, 스테아르산나트륨, 스테아르산칼륨, 스테아르산마그네슘 등을 들 수 있다.

[0027] 부형제의 제조 방법은, 구성 성분을 균일하게 혼합할 수 있으면 특별히 한정되지 않으며, 예를 들어 전분과 결정 셀룰로오스와 경화제를 범용의 혼합 장치를 사용하여 균일하게 혼합함으로써 제조할 수 있다.

[0028] 부형제는, 분말을 정제화하기 위해 사용된다. 분말로서는 특별히 한정되지 않으며, 예를 들어 분말상의 세정제, 분말상의 약제, 분말상의 조미료, 분말상의 식품, 분말상의 건강 식품 및 분말상의 건강 보조 식품(서플리먼트) 등을 들 수 있다.

[0029] 부형제를 사용하여 분말을 정제화하는 방법으로서는, 예를 들어 원료가 되는 분말과 부형제를 혼합한 후, 정제화(타정)하면 된다. 부형제를 사용하여 분말을 정제화하는 방법으로서는 공지된 방법을 사용할 수 있으며, 예를 들어 직접 타정법, 건식 과립 압축법 등을 들 수 있다. 구체적으로는, (1) 원료가 되는 분말 및 부형제와, 필요에 따라 첨가제를 혼합한 후, 타정하는 방법(직접 타정법), (2) 원료가 되는 분말 및 부형제와, 필요에 따라 첨가제를 혼합하여 과립을 제작하고, 이 과립을 타정하는 방법(건식 과립 압축법) 등을 들 수 있다. 이와 같이, 상기 부형제에 의하면, 각종 분말을 공지된 방법으로 용이하게 정제화할 수 있다. 부형제를 사용하여 분말을 정제화하여 얻어진 정제 중에 있어서, 원료가 되는 분말의 함유량과 부형제의 함유량의 비(분말의 함유량/부형제의 함유량)는, 6.4 이하가 바람직하다. 부형제를 사용하여 분말을 정제화하여 얻어진 정제 중에 있어서, 원료가 되는 분말의 함유량과 부형제의 함유량의 비(분말의 함유량/부형제의 함유량)는 0.1 이상이 바람직하다.

[0030] 상기 부형제를 사용하여 얻어진 정제는, 물에 대하여 우수한 붕괴성을 갖고 있기 때문에, 예를 들어 분말이 세정제인 경우에는, 정제를 예를 들어, 세탁기에 투입하는 것만으로도 빠르게 붕괴되고, 세정제를 물에 용해시킬

수 있기 때문에, 세정제의 세정 효과를 양호하게 발휘시킬 수 있다.

[0031] 또한, 분말이 약제인 경우에는 환자가 정제를 복용하면, 정제는 체내에 있어서 체액에 의해 빠르게 붕괴되고, 약제를 체내에 원활하게 흡수시켜 우수한 약효를 발현시킬 수 있다.

[0032] 실시예

[0033] 이하에, 실시예를 사용하여 본 발명을 보다 구체적으로 설명하지만, 본 발명은 이들 실시예에 의해 한정되지 않는다.

[0034] (실시예 1 내지 27, 비교예 1 내지 9)

[0035] 전분으로서 타피오카 전분, 옥수수 전분, 감자 전분 및 쌀 전분과, 결정 셀룰로오스로서 결정 셀룰로오스 1(아사히 가세이 케미컬즈사제 상품명 「세오라스」), 결정 셀룰로오스 2(에이켄 쇼지사제 상품명 「헤바텐 101」) 및 결정 셀룰로오스 3(에이켄 쇼지사제 상품명 「헤바텐 102」)과, 경화제로서 이소말토, 말티톨, 말토오스 및 락토오스를 표 1 및 표 2에 나타낸 소정량씩 교반기에 공급하고, 균일하게 혼합하여 부형제를 제조하였다.

[0036] 분말로서 세정제(가오사제 상품명 「어택」) 또는 조미료(아지노모또사제 상품명 「크노르 컵 스프」) 60질량부와, 부형제 40질량부를 균일하게 혼합하여 정제 조성물을 제작하였다. 이 정제 조성물을 타정기에 공급하여 직접 타정법에 의해 타정압 14kN으로 정제(두께: 9㎜, 중량: 3500㎎)로 하였다.

[0037] 얻어진 정제의 붕괴성 및 경도를 하기의 요령으로 측정하고, 그 결과를 표 1 및 표 2에 나타내었다.

[0038] 〔붕괴성〕

[0039] 얻어진 정제를 24.9℃의 물 1리터 중에 투입하였다. 정제를 정지 상태의 수중에 투입하고, 정제가 그의 부피의 2/3 붕괴된 시점으로부터 60rpm의 회전수로 물을 교반하고, 정제가 완전히 붕괴될 때까지 교반하였다. 정제를 정지 상태의 수중에 투입한 후 정제가 완전히 붕괴될 때까지의 시간을 측정하였다. 정제를 정지 상태의 수중에 투입한 후 300초 경과해도 붕괴되지 않은 경우에는 「Bad」라 하였다.

[0040] 〔경도〕

[0041] 얻어진 정제의 경도를 경도계(후지와라 세이사꾸쇼사제 상품명 「기야식 경도계」)를 사용하여 측정하였다.

표 1

	부형제(결합부)						경화제			분말	붕괴성(초)	경도(kgf)
	당피오카 전분	옥수수 전분	감자 전분	쌀 전분	결정 셀룰로오스 1	결정 셀룰로오스 2	결정 셀룰로오스 3	이소말토	말티톨	말토오스	락토오스			
실시예1	100	0	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	세정제	66	6.0
실시예2	100	0	0	0	6	0	0	1.3	0	0	0	세정제	120	5.8
실시예3	100	0	0	0	18	0	0	1.3	0	0	0	세정제	48	4.4
실시예4	100	0	0	0	10	0	0	0.3	0	0	0	세정제	75	4.4
실시예5	100	0	0	0	10	0	0	8	0	0	0	세정제	121	4.8
실시예6	100	0	0	0	10	0	0	0	0.3	0	0	세정제	100	4.0
실시예7	100	0	0	0	10	0	0	0	1.3	0	0	세정제	112	4.1
실시예8	100	0	0	0	10	0	0	0	8	0	0	세정제	140	4.4
실시예9	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0.3	0	세정제	80	4.1
실시예10	100	0	0	0	10	0	0	0	0	1.3	0	세정제	95	4.3
실시예11	100	0	0	0	10	0	0	0	0	8	0	세정제	130	4.5
실시예12	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0.3	세정제	80	4.0
실시예13	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	1.3	세정제	95	4.2
실시예14	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	8	세정제	125	4.5
실시예15	100	0	0	0	10	0	0	0.65	0.65	0	0	세정제	67	4.9
실시예16	100	0	0	0	10	0	0	0.65	0	0.65	0	세정제	63	4.8
실시예17	100	0	0	0	10	0	0	0.65	0	0	0.65	세정제	59	4.7
실시예18	100	0	0	0	10	0	0	0	0.65	0.65	0	세정제	73	4.5

[0042]

표 2

	부형제(질량부)										분말	붕괴성(초)	경도(kgf)
	타피오카 전분	옥수수 전분	감자 전분	쌀 전분	결정 셀룰로오스			경화제					
					1	2	3	이소말토	말티톨	말토오스	락토오스		
실시예19	100	0	0	0	10	0	0	0	0.65	0	0.65	세정제	78	4.6
실시예20	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0.65	0.65	세정제	86	3.9
실시예21	0	100	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	세정제	140	4.8
실시예22	0	0	100	0	10	0	0	1.3	0	0	0	세정제	130	4.5
실시예23	0	0	0	100	10	0	0	1.3	0	0	0	세정제	135	4.5
실시예25	100	0	0	0	0	10	0	1.3	0	0	0	세정제	60	3.8
실시예26	100	0	0	0	0	0	10	1.3	0	0	0	세정제	58	4.0
실시예27	100	0	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	조미료	66	4.2
비교예1	100	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0	세정제	102	2.1
비교예2	100	0	0	0	0	0	0	1.3	0	0	0	세정제	73	1.8
비교예3	100	0	0	0	0	0	0	0	1.3	0	0	세정제	79	2.2
비교예4	100	0	0	0	0	0	0	0	0	1.3	0	세정제	72	2.8
비교예5	100	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1.3	세정제	100	2.5
비교예6	0	0	0	0	10	0	0	1.3	0	0	0	세정제	Bad	14.2
비교예7	0	0	0	0	10	0	0	0	1.3	0	0	세정제	Bad	14.7
비교예8	0	0	0	0	10	0	0	0	0	1.3	0	세정제	Bad	13.9
비교예9	0	0	0	0	10	0	0	0	0	0	1.3	세정제	Bad	16.8

[0043]

산업상 이용가능성

[0044] 본 발명의 부형제에 의하면, 다양한 용도에 사용되는 분말[예를 들어, 세정제, 약제, 조미료, 식품, 건강 식품, 건강 보조 식품(서플리먼트) 등]을 용이하게 정제로 할 수 있다. 얻어진 정제는, 물 또는 체내에 있어서 빠르게 붕괴되면서도 우수한 경도를 갖고 있다.

[0045] (관련 출원의 상호 참조)

[0046] 본 출원은, 2016년 6월 28일에 출원된 일본 특허 출원 제2016-128150호에 기초한 우선권을 주장하고, 이 출원의 개시는 이들의 전체를 참조함으로써 본 명세서에 도입된다.