



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 新型說明書公告本

(11) 證書號數：TW M643174 U

(45) 公告日：中華民國 112 (2023) 年 07 月 01 日

(21) 申請案號：111210346

(22) 申請日：中華民國 111 (2022) 年 09 月 23 日

(51) Int. Cl. : A61K9/20 (2006.01)

A61P25/04 (2006.01)

A61P29/00 (2006.01)

(71) 申請人：水星生醫股份有限公司(中華民國) (TW)

新北市中和區板南路 653 號 15 樓

(72) 新型創作人：陳朝鎰 CHEN, CHAO-YI (TW)；蔡志佳 TSAI, CHIH-CHIA (TW)

(74) 代理人：何秋遠

申請專利範圍項數：6 項 圖式數：2 共 12 頁

(54) 名稱

二甲雙胍藥錠結構

(57) 摘要

本創作係提供一種二甲雙胍藥錠結構，係包括一厚膠層；一粉膠層，該粉膠層係以醫藥粉末之混合物所構成且包覆於該厚膠層外部，而該醫藥粉末為包括二甲雙胍及賦形劑；及一空心部，該空心部係形成於該厚膠層內部，而該二甲雙胍藥錠結構則可於液體進入時空心部快速崩散以達到快速止痛消炎之功效者。

指定代表圖：

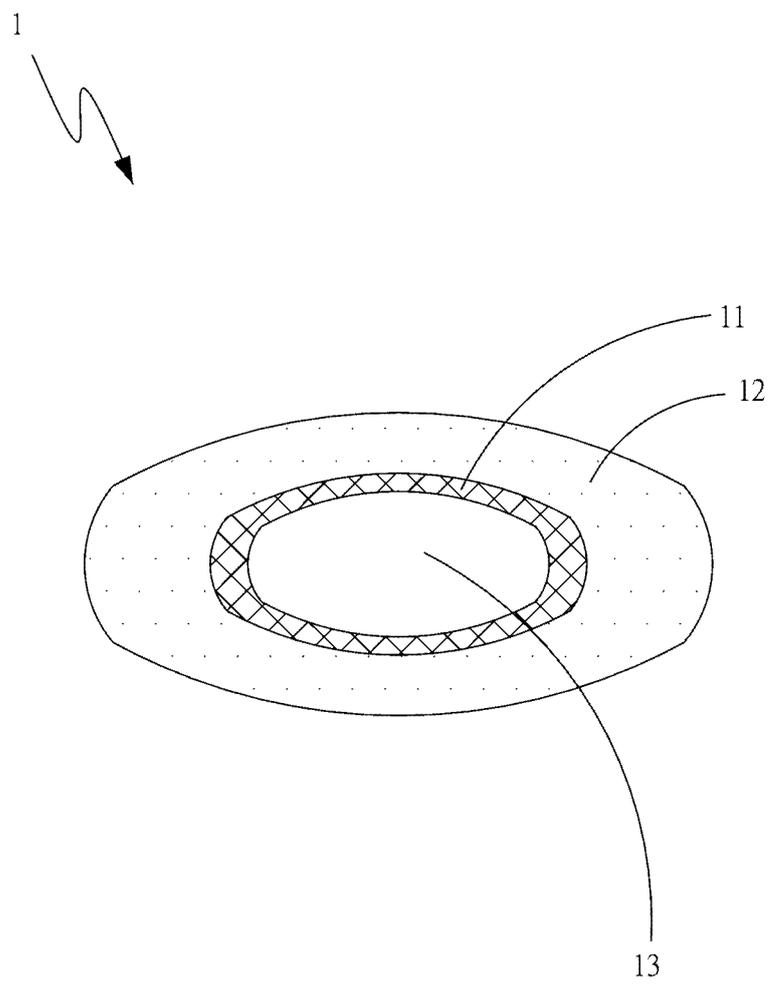
符號簡單說明：

1:二甲雙胍藥錠結構

11:厚膠層

12:粉膠層

13:空心部



第 1 圖



公告本

【新型摘要】

M643174

【中文新型名稱】 二甲雙胍藥錠結構

【中文】本創作係提供一種二甲雙胍藥錠結構，係包括一厚膠層；一粉膠層，該粉膠層係以醫藥粉末之混合物所構成且包覆於該厚膠層外部，而該醫藥粉末為包括二甲雙胍及賦形劑；及一空心部，該空心部係形成於該厚膠層內部，而該二甲雙胍藥錠結構則可於液體進入時空心部快速崩散以達到快速止痛消炎之功效者。

【指定代表圖】 第 1 圖

【代表圖之符號簡單說明】

二甲雙胍藥錠結構 . . . 1

厚膠層 . . . 11

粉膠層 . . . 12

空心部 . . . 13

【新型說明書】

【中文新型名稱】 二甲雙胍藥錠結構

【技術領域】

【0001】 本創作係有關於一種藥錠結構，尤指一種可快速崩散以達到快速止痛消炎之二甲雙胍藥錠結構。

【先前技術】

【0002】 二甲雙胍(metformin)是一種歷史悠久且相對安全的口服降血糖藥，屬於雙胍類降血糖藥，是糖尿病患者的用藥首選，其機轉為AMPK活化劑，預期能帶來止痛效果；通常普遍使用於克錠(Uformin)、庫魯化錠(Glucophage)、伏糖(Loditon)、沁樂寬(Glibudon)等。二甲雙胍(metformin)藉由降低肝臟製造葡萄糖的量、減少腸道吸收葡萄糖、以及增加人體對糖分的利用，來達到降血糖的作用外，還能增加細胞對胰島素的敏感性，讓身體運用島素的效率增加；亦即，能夠減少新葡萄糖的產生、提高島素對舊葡萄糖的作用，達到降低血糖的效果。

【0003】 二甲雙胍主要經由腎臟代謝，因此使用此藥品前及用藥期間，定期檢查腎功能非常重要。又，二甲雙胍的主要作用在腸胃道，所以腹瀉、消化不良、脹氣是最常見的副作用或不良反應。又，服用二甲雙胍後可能會有極低的機率造成發生「乳酸中毒」的罕見副作用。依據衛生署核准的藥品仿單記載，服用二甲雙胍將會有約十萬分之三的機率會導致「乳酸中毒」的風險。

【0004】 值得注意的是，乳酸中毒是二甲雙胍罕見而嚴重的不良反應，雖然機率極低，卻有一半的患者因此死亡，大多是腎功能不全的患者。所謂「乳

酸中毒」指的是人體乳酸生成的量大於代謝的速度，造成乳酸在血液中大量堆積。常見症狀有疲倦嗜睡、全身無力、肌肉痠痛、呼吸困難、畏寒、眩暈、胃腸不舒服；嚴重者甚至會出現意識障礙、血壓下降、心跳減慢、昏迷等致命危機。

【0005】 目前現有二甲雙胍起使劑量為500mg，每天2-3次。二甲雙胍之每日最大劑量：3000 mg。80歲以上老年患者不建議開始使用二甲雙胍治療。由於主要是腎臟代謝，因此腎功能不佳的人不能使用。此外，高齡、心臟衰竭、肺部、肝臟功能不佳者、嚴重感染、脫水、酗酒、以及與顯影劑併用(兩天內)等，都會增加乳酸中毒的風險，也都是二甲雙胍的使用禁忌。

【0006】 另外，二甲雙胍是一種流動性和壓縮性特徵差的高水溶性藥物，因此，它不能以其純化形式壓制；又，由於是高劑量藥物，因此，在片劑生產過程中傾向於實施終端封閉，以致可能會導致產量損失和品質受損。為了改善流動性和壓縮性，習知技術建議採用特定大小和密度範圍的特殊賦形劑與二甲雙胍混合，然後直接壓制混合物的方法；或者採用一種使粒性二甲雙胍和水膠體形成的緩釋製劑與水性溶劑形成顆粒產品，然後乾燥該顆粒產品降低剩餘的水分含量的方法。然而，採用特定微粒大小和密度範圍的賦形劑，卻造成製備過程冗長、複雜；因而，導致增加製造成本。

【0007】 又，亦有建議採用一種以含有二甲雙胍和緩釋物質的單個顆粒形式形成內部固體顆粒相，把形成內部固體顆粒相的單個顆粒與含有緩釋物質的外部固體連續相混合，內部固體顆粒相的粒子分散和包埋在該外部固體連續相中。將二甲雙胍和緩釋物質的濕制粒與水性或有機溶劑製成內部顆粒相。隨後乾燥該內部顆粒相，並與外部連續相混合，壓制成片劑的方法。但是，大多數

親水聚合物常常會與水系統反應，造成濕制粒的困難，甚至會影響釋放特性，以及採用有機溶劑也會產生溶劑殘留等之各種問題。

【0008】從而，業界莫不引頸期待開發出一種能夠解決上述習知技術的各種問題之用於二甲雙胍藥錠結構。

【新型內容】

【0009】爰此，為有效解決上述之問題，本創作之主要目的在於提供一種尤指一種可快速崩散以達到快速止痛消炎之二甲雙胍藥錠結構。

【0010】為達上述目的，本創作係提供一種二甲雙胍藥錠結構，係包括一厚膠層；一粉膠層，該粉膠層係以醫藥粉末之混合物所構成且包覆於該厚膠層外部，而該醫藥粉末為包括二甲雙胍及賦形劑；及一空心部，該空心部係形成於該厚膠層內部。

【0011】根據本創作之一實施例，其中所述厚膠層之成分包含有填充劑、稀釋劑、賦形劑、黏合劑、緩釋劑及甜味劑的至少一種或其組合。

【0012】根據本創作之一實施例，其中所述賦形劑係包括PVP、PEG、聚合物的至少一種或其組合。

【0013】根據本創作之一實施例，其中所述粉膠層之成分更包含有填充劑、稀釋劑、賦形劑、黏合劑、緩釋劑及甜味劑的至少一種或其組合。

【0014】根據本創作之一實施例，其中所述粉膠層厚度大於該厚膠層厚度。

【0015】根據本創作之一實施例，其中所述粉膠層具有一壓痕。

【圖式簡單說明】

【0016】

第1圖係本創作二甲雙胍藥錠結構之剖面示意圖。

第2圖係本創作二甲雙胍藥錠結構之實施示意圖。

【實施方式】

【0017】 本創作之上述目的及其結構與功能上的特性，將依據所附圖式之較佳實施例予以說明。

【0018】 在以下，針對本創作有關二甲雙胍藥錠結構之構成及技術內容等，列舉各種適用的實例並配合參照隨文所附圖式而加以詳細地說明；然而，本創作當然不是限定於所列舉之該等的實施例、圖式或詳細說明內容而已。

【0019】 再者，熟悉此項技術之業者亦當明瞭：所列舉之實施例與所附之圖式僅提供參考與說明之用，並非用來對本創作加以限制者；能夠基於該等記載而容易實施之修飾或變更而完成之創作，亦皆視為不脫離本創作之精神與意旨的範圍內，當然該等創作亦均包括在本創作之申請專利範圍。

【0020】 又，以下實施例所提到的方向用語，例如：「上」、「下」、「左」、「右」、「前」、「後」等，僅是參考附加圖示的方向。因此，使用的方向用語是用來說明，而並非用來限制本創作；再者，在下列各實施例中，相同或相似的元件將採用相同或相似的元件標號。

【0021】 首先，請參閱第1圖所示，係為本創作二甲雙胍藥錠結構之剖面示意圖，由圖中可清楚看出，其中所述二甲雙胍藥錠結構1係包括有一厚膠層11及一粉膠層12及一空心部13。

【0022】 其中所述厚膠層11之成分包含有填充劑、稀釋劑、賦形劑、黏合劑、緩釋劑及甜味劑的至少一種或其組合。

【0023】 而該粉膠層12係以醫藥粉末之混合物所構成且包覆於該厚膠層11外部，而該醫藥粉末為包括二甲雙胍及賦形劑，又該醫藥粉末更包括有填充劑、稀釋劑、賦形劑、黏合劑、緩釋劑及甜味劑的至少一種或其組合，而其中該粉膠層12厚度大於該厚膠層11厚度，並進一步包括崩解劑、潤滑劑中之至少一種。

【0024】 而其醫藥粉末的成分，舉例來說，例如，可以是由鹽酸二甲雙胍(Metformin Hydrochloride)、乙醇(Alcohol 95%)、2,6-二丁基對甲酚(Butylated Hydroxytoluene)、膠狀無水型二氧化矽(Colloidal Silicon Dioxide)、羥丙基纖維素(Hydroxypropyl Cellulose (HPC-EF))、矽酸鋁鎂(Magnesium Aluminosilicate)、微晶纖維素(Microcrystalline cellulose)、聚乙二醇(Polyethylene Glycol 4000 (PEG 4000))、聚環氧乙烷(Polyethylene Oxide (Polyox WSR N-303))、聚乙烯吡咯烷酮(Polyvinylpyrrolidone K-90 (PVP K90))、月桂基硫酸鈉 (Sodium Lauryl Sulfate (SLS, SDS))；十二烷基硫酸鈉)、羧甲基澱粉鈉(Sodium carboxymethyl starch (Sodium Starch Glycolate))；甘醇酸澱粉鈉)、二氧化鈦(Titanium dioxide)構成的混合物。

【0025】 而其中該賦形劑係包括PVP、PEG、聚合物的至少一種或其組合，另該填充劑為選自於微晶纖維素、矽化微晶纖維素中之至少一種，與該稀釋劑為選自於甘露醇、糖醇中之至少一種，及該黏合劑為選自於葡萄糖、乳糖中之至少一種，與該緩釋劑為選自於聚乳酸中之至少一種；該甜味劑為選自於異麥芽酮糖醇(Isomalt)中之至少一種。

【0026】 而其中二甲雙胍藥錠結構1製造方法之具體方式為，可以是首先將已經良好混合的含有賦形劑及二甲雙胍的粉末，透過該藥錠製造裝置(未圖式)均勻鋪設在一藥錠成形平台(未圖式)上，該製造裝置具備一小孔徑的噴頭、一大孔徑的噴頭、及一藥錠成形平台與其製造裝置(未圖式)上，利用該具有小孔徑的噴頭噴塗一膠體，該膠體與粉末黏合形成所述粉膠層12，此時，粉膠層12與厚膠層11的噴塗，透過該大小不同的孔徑之噴頭噴塗，形成具有空心部13的二甲雙胍藥錠結構1，且其中厚膠層11所噴塗之膠體孔隙率為小於該粉膠層12所噴塗之膠體孔隙率。

【0027】 又或者二甲雙胍藥錠結構1的製造方法可以採用渦流狀由內而外製造。例如，首先，利用大孔徑噴頭在內圈噴塗大孔徑的膠以形成厚膠層11；當厚膠層11快完成時，再接著落下醫藥粉末。落下的醫藥粉末，由於下層尚有小孔徑的膠搭配厚膠層11，使醫藥粉末也能夠黏著於厚膠層11及其厚膠層11以外的區域，於醫藥粉末落下後，再噴塗上小孔徑的膠，重複上述步驟直到推疊至空心部13完成後再返回前述步驟。如此，就能夠形成包括有厚膠層11、粉膠層12及空心部13之二甲雙胍結構1。

【0028】 藉此，本創作之二甲雙胍藥錠結構1是具有特定黏合膠比例，並且具有依照固定或不固定漸縮或漸增方式，規律地以呈圓形或橢圓形之環型噴膠而形之空心部的空心狀藥錠結構。因此，不會引起血糖水平和血漿胰島素水平的波動並能夠達成快速止痛效果，而其中的黏合劑中可以進一步含有水解速度及吸收速度皆比蔗糖慢的異麥芽酮糖醇，藉以避免引起血糖水平和血漿胰島素水平的波動，並且達到快速止痛效果。

【0029】 另外，本創作本創作之二甲雙胍藥錠結構是利用特有黏合劑以一定比例將二甲雙胍以粉末堆疊黏合；因而，可以使藥錠結構比一般傳統藥劑較為鬆散；另外，因為是以特有孔徑的方式製成，所以，能夠增加藥錠的表面積、增加吸收速率、加快藥物作用時間，進而能夠達到快速止痛的效果，並且本創作之二甲雙胍藥錠結構除了傳統吞嚥劑型以外，較佳者為口溶型；藉此改善服用的方便性。

【0030】 因此，本創作之二甲雙胍藥錠結構除了能夠透過口溶方式讓藥錠更細小化後再進入胃腸、能夠提供所需的緩釋性能以外，而且能夠強化AMPK活化效果、減少服用劑量、並減低對病患血糖波動，進而能夠加強止痛效果。

【0031】 再請參閱第2圖所示，係為本創作二甲雙胍藥錠結構之實施示意圖，其中所述粉膠層12具有一壓痕121，而該粉膠層12係為該二甲雙胍藥錠結構1之表層，故該二甲雙胍藥錠結構1之表層形成有所述壓痕121，以使該二甲雙胍藥錠結構1可透過該壓痕折成二個半粒。

【0032】 以上已將本創作做一詳細說明，惟以上所述者，僅為本創作之一較佳實施例而已，當不能限定本創作實施之範圍，即凡依本創作申請範圍所作之均等變化與修飾等，皆應仍屬本創作之專利涵蓋範圍。

【符號說明】

【0033】

二甲雙胍藥錠結構 . . . 1

厚膠層 . . . 11

粉膠層 . . . 12

壓痕 . . . 121

空心部 . . . 13

【新型申請專利範圍】

【請求項1】 一種二甲雙胍藥錠結構，係包括：

一厚膠層；

一粉膠層，該粉膠層係以醫藥粉末之混合物所構成且包覆於該厚膠層外部，而該醫藥粉末為包括二甲雙胍及賦形劑；及

一空心部，該空心部係形成於該厚膠層內部。

【請求項2】 如請求項1所述之二甲雙胍藥錠結構，其中所述厚膠層之成分包含有填充劑、稀釋劑、賦形劑、黏合劑、緩釋劑及甜味劑的至少一種或其組合。

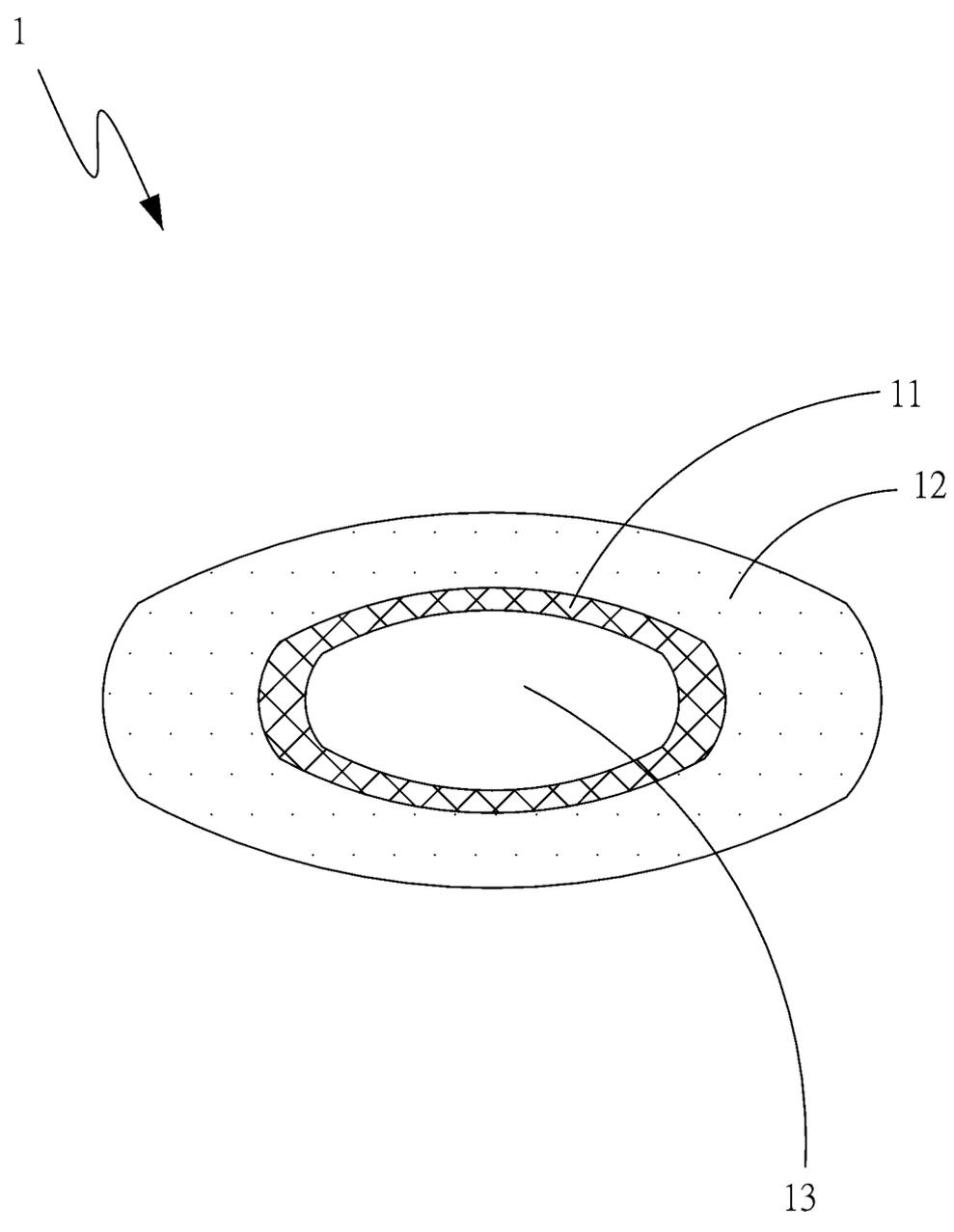
【請求項3】 如請求項1所述之二甲雙胍藥錠結構，其中所述賦形劑係包括PVP、PEG、聚合物的至少一種或其組合。

【請求項4】 如請求項1所述之二甲雙胍藥錠結構，其中所述粉膠層之成分更包含有填充劑、稀釋劑、賦形劑、黏合劑、緩釋劑及甜味劑的至少一種或其組合。

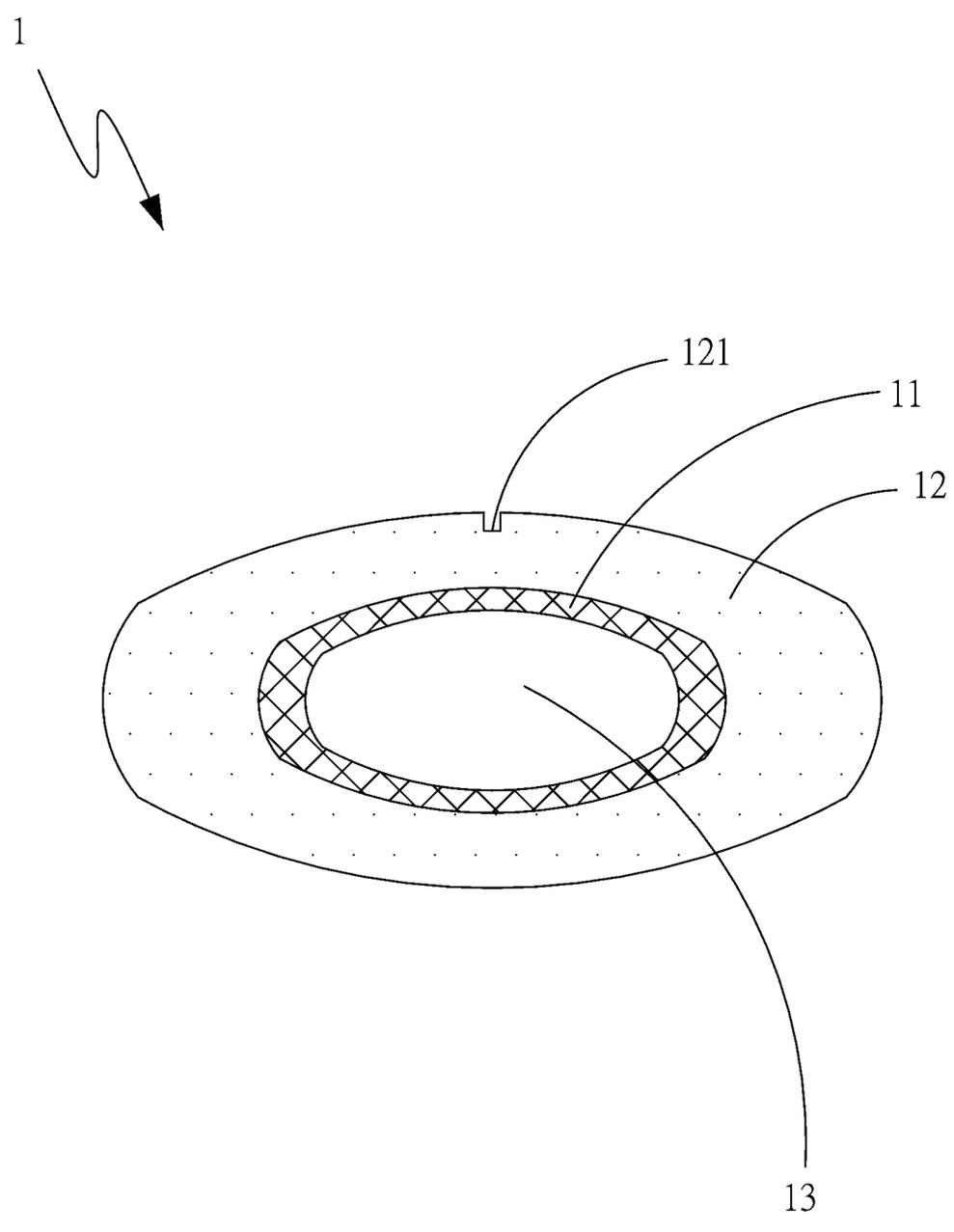
【請求項5】 如請求項1所述之二甲雙胍藥錠結構，其中所述粉膠層厚度大於該厚膠層厚度。

【請求項6】 如請求項1所述之二甲雙胍藥錠結構，其中所述粉膠層具有一壓痕。

【新型圖式】



第 1 圖



第 2 圖