

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 200410070181.1

[51] Int. Cl.

A61K 31/255 (2006.01)

A61K 9/20 (2006.01)

A61P 31/04 (2006.01)

[43] 公开日 2006 年 2 月 8 日

[11] 公开号 CN 1729968A

[22] 申请日 2004.8.5

[21] 申请号 200410070181.1

[71] 申请人 北京琥珀光华医药科技发展有限公司
地址 100070 北京市丰台区看丹路 4 号院甲 6
号航天银星科技孵化器 227 室

[72] 发明人 王翰斌 王立峰

权利要求书 1 页 说明书 2 页

[54] 发明名称

含有新鱼腥草素钠的口服组合物

[57] 摘要

本发明涉及的药用组合物用于口服途径，使用特定日剂量的新鱼腥草素钠对抗菌消炎有效。本发明涉及制备含有新鱼腥草素钠口服途径的方法。其特征在于该组合物含有 5 – 80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠和任选的药学上可授受的用于口服的载体。本发明的方法可以提供任何可方便给药形式的新鱼腥草素钠的药用组合物，包括经口或胃肠外给药形式。它特别适合制备为经口给药形式，特别是药学上可接受形式的新鱼腥草素钠的片剂或胶囊。该方法包括给予 5 – 20、20 – 50 或 50 – 80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。优选，该方法包括给予 10mg、20mg、40mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

1. 一种含有新鱼腥草素钠的口服药物，其特征在于该组合物口服应用，含有 5-80mg 药学上可接受形式的口服化合物和任选的药学上可接受的载体。
2. 权利要求 1 的口服途径的组合物，它含有 5-20mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。
3. 权利要求 1 的口服途径的组合物，它含有 20-50mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。
4. 权利要求 1 的口服途径的组合物，它含有 50-80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。
5. 权利要求 1 的口服途径的组合物，它含有 20mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。
6. 权利要求 1 的口服途径的组合物，它含有 40mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。
7. 一种制备含有 5-80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠口服途径的组合物和药学上可接受的口服载体的药用组合物的方法，该方法包括将 5-80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠口服途径的组合物和药学上可接受的口服载体相混合。
8. 权利要求 7 的方法，其中制备的组合物为单位口服途径剂型。
9. 权利要求 7 的方法，其中制备的组合物为片剂。

含有新鱼腥草素钠的口服组合物

本发明涉及的药用组合物用于口服途径，尤其涉及此组合物在医药口服途径中的用途、涉及制备此组合物口服途径产品的方法并涉及该口服产品方法中使用的组合物。

研究已经发现单一、特定日剂量的新鱼腥草素钠对抗菌消炎有效。而将其用于注射使用领域。我们发现了制备含有新鱼腥草素钠口服途径的方法。

因此，在第一个方面，本发明提供含有新鱼腥草素钠的口服药用组合物(适合为单位剂型)，其特征在于该组合物含有 5-80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠和任选的药学上可接受的用于口服的载体。

适合的药学上可接受的形式包括溶剂化物形式。

在此所用术语“药学上可接受的”包括人类和兽用两种用途。

在另一个方面，本发明提供制备含有 5-80mg 药学上可接受形式新鱼腥草素钠和药学上或接受的口服载体药用组合物方法，该方法包括将 5-80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠与药学上可接受的口服载体混合，并且任选随后将产生的组合物配制为可供口服的给药的形式。

如上所述，本发明也提供制备含有药学上可接受形式的药用组合物的另外的方法，该方法特别适合制备单位剂型的新鱼腥草素钠。因此，本发明还提供制备药学上可接受形式的新鱼腥草素钠和药学上可接受的载体的药用组合物方法，该方法包括：

1. 制备含有药学上可接受形式的口服新鱼腥草素钠的组合物；
2. 将口服组合物与药学上可接受的载体混合，得到所需的口服新鱼腥草素钠的组合物，并随后将产生的组合物配制为可供给药的形式。

优选新鱼腥草素钠的药用组合物的可供给药形式为单位剂量的组合物。

除特别指明外，适合的单位剂量含有多至 80mg，如 5-80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

其他的单位剂量包括在此所提及的那些剂量。

适合的药学上可接受的预给药组合物为药学上可接受形式的新鱼腥草素钠的浓缩物(优选为粒状浓缩物)。该粒状浓缩物特别适合于被稀释以得到给药组合物，优选为片剂或胶囊。

在另一个方面，本发明提供含有药学上可接受形式的新鱼腥草素钠和药学上可接受载体的组合物，其特征在于所述组合物为药学上可接受形式的新鱼腥草素钠的浓缩物，适合于被稀释以得到给药组合物。

本发明的方法可以提供任何可方便给药形式的新鱼腥草素钠的药用组合物，包括经口或胃肠外给药形式。它特别适合制备为经口给药形式，特别是药学上可接受形式的新鱼腥草素钠的片剂或胶囊。

药学上可接受的载体可包括任何常规的药学上可接受的载体，包含常规的药学上可接受的赋形剂。然而，由于种药学上可接受的载体在可供给药的形式中不是必不可少，所以它不必含有只与给药有关的赋形剂。例如药学上可接受的载体不必含有润滑剂。

一种具体的组合物含有药学上可接受形式的新鱼腥草素钠、崩解剂、黏合剂和稀释剂。

适当的崩解剂为羟丙基淀粉钠。

适当的黏合剂为 5%聚乙烯吡咯烷酮。

适当的稀释剂包括纤维素，如微晶纤维素和淀粉。

适当的润滑剂为硬脂酸镁。

使用任何适用于所述组合物性质的常规方法可适当的进行所述组合物的制备，如湿法制粒得到粒状的组合物。

将本发明的组合物配制为可供给药形式的方法包括在此引用的参考书中公开的常规制剂

方法，包括压片法。

优选本发明可供给药的组合物适合经口给药。然而，他们也适合于其它给药途径，如胃肠外、舌下或透皮给药。

可供给药的组合物可以为片剂、胶囊剂、粉剂、颗粒剂、锭剂、栓剂、可复制粉剂或液体制剂如口服或无菌胃肠外溶液或悬浮液。

为获得给药的一致性，优选本发明的组合物为单位剂型。

口服给药的单位剂型可以为片剂和胶囊剂，他们可以含有常规赋形剂如黏合剂像糖浆、阿拉伯胶、明胶、山梨醇、黄蓍胶或聚乙烯吡咯烷酮；填充剂如乳糖、蔗糖、玉米淀粉、磷酸钙、山梨醇或甘氨酸；压片润滑剂如硬脂酸镁；崩解剂如淀粉、磷酸钙、山梨醇或甘氨酸；压片润滑剂如硬脂酸镁；崩解剂如淀粉、聚乙烯吡咯烷酮、羟乙酸淀粉钠或微晶纤维素或药学上可接受的润湿剂如十二烷基硫酸钠。

可以通过常规方法混合、填充或压片制备固体混合物（如口服组合物）。如果需要，可以重复混合操作步骤以将所述活性组分分散于使用大量填充剂的组合物中。此类操作步骤是本领域常规的。可以根据正常制药实践中熟知的方法对片剂进行包衣，特别是用膜包衣物水溶液进行包衣。

液体组合物（如口服液体组合物）可以制备为乳液糖浆剂或酏剂形式，或者将它们制备为干燥产物形式，在使用前用水或其它适当的溶媒复制。此类液体制剂可以含有常规的添加剂，如悬浮剂像山梨醇、糖浆、甲基纤维素、明胶、羟乙基纤维素，羧甲基纤维素、硬脂酸铝凝胶、氢化可食用脂肪；乳化剂如卵磷脂、脱水山梨醇单油酸酯或阿拉伯胶；非水溶性溶媒（可以包括食用油）如杏仁油、分馏椰子油、油性酯如甘油、丙二醇或乙醇的酯；防腐剂如对-羟基苯甲酸甲酯或丙酯或山梨酸；并且如果需要可以含有常规的矫味剂或着色剂。

除特别指明外，根据给药的方法不同，本发明的组合物可以含有 0.1% 至 99%（重量）、优选 10% 至 60%（重量）的活性物质。

本发明也提供作为活性治疗剂的含有 5- 80mg 新鱼腥草素钠和药学上可接受的载体的口服组合物。

因此，另一方面，本发明提供使用口服鱼腥草素钠治疗相关疾病的方法，该方法包括每日给予需要的哺乳动物 5 - 80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

具体地讲，该方法包括给予 5 - 20、20 - 50 或 50 - 80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

具体地讲，该方法包括给予 5 - 20mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

具体地讲，该方法包括给予 20- 50mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

具体地讲，该方法包括给予 50- 80mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠

优选，该方法包括给予 10mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

优选，该方法包括给予 20mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

优选，该方法包括给予 40mg 药学上可接受形式的新鱼腥草素钠。

下列实施例说明本发明，但不以任何方式限制本发明。

实施例：片剂制取

将研磨的新鱼腥草素钠、羟丙基淀粉钠、微晶纤维素、淀粉按处方比例混合均匀，用 5% 聚乙烯吡咯烷酮乙醇液适量制粒，60℃干燥，整粒，加入处方量硬酯酸镁混匀，压成 1000 片。

| 组分 | 用量 |
|-----------|------|
| 研磨的新鱼腥草素钠 | 20g |
| 羟丙基淀粉钠 | 5.0g |
| 微晶纤维素 | 30g |
| 淀粉 | 44g |
| 硬酯酸镁 | 1.0g |
| 5%聚乙烯吡咯烷酮 | 适量 |