

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200710001159.5

[51] Int. Cl.

*A61K 31/137 (2006.01)*

*A61K 9/70 (2006.01)*

*A61P 25/04 (2006.01)*

*A61P 25/36 (2006.01)*

*A61M 37/00 (2006.01)*

[43] 公开日 2007 年 8 月 22 日

[11] 公开号 CN 101019844A

[22] 申请日 2007.1.22

[21] 申请号 200710001159.5

[71] 申请人 陶 燃

地址 100700 北京市东城区南门仓 5 号北京  
军区总医院成瘾医学中心

[72] 发明人 陶 燃

权利要求书 1 页 说明书 3 页

[54] 发明名称

盐酸曲马多的透皮贴片制剂

[57] 摘要

本发明公开了一种盐酸曲马多的透皮贴片制剂。该透皮贴片剂可用于超声波给药体系、离子导入给药体系、电穿孔给药体系、高压气体给药体系。所述盐酸曲马多的透皮贴片剂型可用于治疗各种急慢性疼痛、手术疼痛、癌症疼痛，并用于戒毒治疗。

1. 一种盐酸曲马多的透皮贴片制剂，其特征是，包括盐酸曲马多。
2. 根据权利要求 1 所述的透皮贴片制剂，其特征是，所述制剂是被引用于超声波给药体系、离子导入给药体系、电穿孔给药体系、高压气体给药体系中的透皮贴片制剂。
3. 根据权利要求 2 所述的透皮贴片制剂，其特征是，优选所述制剂是用于超声波给药体系的制剂。
4. 根据权利要求 1-3 中任一项所述的透皮贴片制剂的用途，其特征是，所述用途用于各种急慢性疼痛、手术疼痛、癌症疼痛，并用于戒毒治疗。

## 盐酸曲马多的透皮贴片制剂

### 技术领域

本发明涉及用于各种急慢性疼痛、手术疼痛、癌症疼痛，并用于戒毒治疗的透皮贴片制剂。进一步，本发明专利涉及用低频超声给药系统给药，发挥治疗各种急慢性疼痛、手术疼痛、癌症疼痛，并用于戒毒治疗。

### 背景技术

疼痛是人类最常见的一种疾病，全世界有数百万人深受其困扰，仅北京就至少有 600 万疼痛患者。目前各种急慢性疼痛主要用口服药物对症治疗为主，口服药物对胃肠道有严重刺激，且疗效短，效果不明显，特别是一些局部的疼痛，口服药物难以到达，从而使效果更差。故需要提供在局部产生很好止疼疗效的新剂型的药物。

盐酸曲马多，性状为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味苦，有引湿性，本品在水中及易溶，在乙醇和三氯甲烷中易溶，在丙酮中微溶，在乙醚中不溶。作用与用途：本品为中枢性镇痛药，盐酸曲马多作用于中枢神经系统，通过激动吗啡受体来激活“镇痛系统”，进而阻断痛觉传导，用于治疗中、重度以上的疼痛，广泛用于中度和严重急慢性疼痛和疼痛手术及外科手术、手术后止痛，诊断措施或治疗引起的疼痛。长期应用本品可能引起耐药及身心依赖，故出现盐酸曲马多的透皮贴片制剂是符合市场需求的。

透皮给药系统(transdermal therapeutic system, TTS 或 transdermal drug delivery, TDD)是指在皮肤表面给药,使药物以恒定或接近恒定的速度透过皮肤,进入人体循环产生全身或局部疗效。TTS 是无创伤性给药新途径,是第三代药物制剂开发研究热点。可避免首过效应和药物在胃肠道的降解。透皮可恒速释药,降低药物不良反应。美国 FDA 1981 年第一个批准的透皮治疗系统东莨菪碱上市,而后硝酸甘油、可乐定、硝异梨醇、芬太尼、烟碱、睾酮及双氯芬酸贴片相继上市。目前还没有盐酸曲马多的透皮贴片制剂的出现。

透皮给药系统的给药剂量是由有效释药面积和药物的透皮率决定的,大多数药物由于自身理化性质,其透皮速度满足不了治疗要求,而实际应用又制约了透皮制剂的面积。超声波法是利用 1-5MHZ 的低频超声波促进药物透皮吸收的方法。其作用机理可能与给药部位的温度升高、超声波的辐射压和降低药液与皮肤间的电位能等有关。一般认为超声波导入透入皮肤深度可达 5cm,而离子导入不超过 1cm,在时间方面,超声波导入 5-10min,而离子导入一般为 20-30min。

为改变现有技术中的缺陷,制备更好的适合于患者的药物剂型,特提供本发明专利。

### 发明内容

本发明的第一个目的是保护含有盐酸曲马多的透皮贴片制剂。包括盐酸曲马多。

本发明的另一个目的是盐酸曲马多的透皮贴片制剂用于治疗各种急慢性疼痛、手术疼痛、癌症疼痛,并用于戒毒治疗。

本发明涉及一种用于超声波给药体系、离子导入给药体系、电穿孔给药体系、高压气体给药体系中含有盐酸曲马多的透皮贴片的制剂。特别优选是在超声波给药体系中应用的盐酸曲马多的透皮贴片的剂型。

本发明请求保护的剂型包括盐酸曲马多的透皮贴片。

所述透皮贴片剂可以使用本领域技术人员熟知的任何方法置备。如将活性药物制成溶液，再加入能够制成凝胶剂。

### 具体实施方式

实施例 1、制备含有盐酸曲马多的透皮贴片剂。所述方法包括将药物溶解在水中，加入敷料，搅拌形成凝胶，在经过包装，制成凝胶状透皮贴片剂。

实施例 2、在使用超声电导仪治疗过程中使用凝胶透皮贴片剂。

将实施例 1 制备得到的贴片装入治疗头对应的放置位置，压牢。去除贴片凹面的防粘纸，将贴片连同治疗头粘固于治疗部位的皮肤，治疗结束后再去除。

本发明提出的新的盐酸曲马多的透皮贴片剂，但是本发明的内容不仅仅限于本发明的实施例，一些依据本发明实施例的内容进行的简单变化也应落入本发明的保护之中。