

申請日期	91 年 5 月 24 日
案 號	91111107
類 別	

A4  
C4

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書		
一、發明 名稱	中 文	
	英 文	
二、發明 創作人	姓 名	(4) 神戶英芳 (5) 水野博之 (6) 今森勝美
	國 籍	(4) 日本國千葉縣市川市真間二-二-一八
	住、居所	(5) 日本國千葉縣印旛郡富里町日吉台一-二四-一九  (6) 日本國千葉縣四街道市下志津新田二五二-一-八六
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	國 籍	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

(由本局填寫)

承辦人代碼：

A6

大類：

B6

IPC分類：

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ， 有 無主張優先權日本 2001年5月25日 2001-156853 有主張優先權

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

029474

## 五、發明說明 ( )

### 技術領域

本發明係關於醫藥配合劑，更詳細而言，具有優良的止咳作用與去痰作用，可作為去痰藥等有利應用之醫藥配合劑。

### 先前技術

自過去大多數的感冒等大多會伴隨著咳或痰的產生，感冒用醫藥配合劑中大多配合具有止咳作用的成分、或具有去痰作用的成分。又，以止咳、去痰的為主要目的的止咳去痰藥已多數上市。

然而，作為市面上的感冒用醫藥配合劑，因具有該止咳作用或去痰作用之配合量受到限制，其效果不僅未充分，又對於止咳去痰劑而言，亦未有令人十分滿足的止咳效果。

因此，期待開發具有更優良止咳效果之醫藥配合劑。

### 發明的揭示

本發明者，欲得到具有更優良的止咳、去痰作用的醫藥配合劑，組合種種具有止咳作用的藥劑，與其他醫藥成分，對其有效性做檢討結果，發現作為去痰藥的 fudostein，單獨使用時雖不會顯示止咳作用，但組合具有止咳作用之藥劑時，發現顯著增強止咳藥的止咳作用，而完成本發明。

即，本發明提供一種含有 fudostein 與具有止咳作用的

**029475**

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

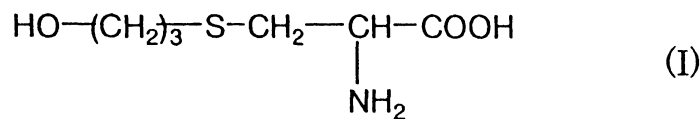
## 五、發明說明 ( 2 )

藥劑為特徵之醫藥配合劑。

實施發明的最佳形態

本發明的醫藥配合劑，係由配合 fudostein 與以止咳藥作為有效成分之者。

本發明所使用的 fudostein 係為，下述式 (I) 所表示的 S-(3-羥基丙基)-L-半胱胺酸，將此作為去痰劑係為有用的事，已於特開平 2-3674 號中報告。



然而該 fudostein 配合具有止咳作用的藥劑之醫藥配合劑係為未知。

本發明的醫藥組成物中，除 fudostein 之外，其鹽類，例如可使用 fudostein 的無機酸鹽鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽等。

本發明的醫藥配合劑中 fudostein 或其鹽類的配合量，雖無特別限制，一般成年人 1 日量為 12mg~2400mg。較佳為成年人 1 日量為 40mg~1200mg。

另一方面，使用於本發明醫藥配合劑之具有止咳作用之藥劑，可舉出作為止咳藥劑的例子，可舉出鹽酸氯丙烯醯胺、鹽酸氯苯息定、tipepdine citrate, DibunateNa, 美沙芬 (Dextromethorphan HBR)，美沙芬·

phenolfutaphosphate, Hybenzic acid tipepidine, Phendyzoic

029476

本紙張尺度適用中國國家標準 (CNS) A4規格 (210×297公釐)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 3 )

acid cloperastin, codeine phosphate, zihydrocodein phosphate, Pentoxyverine Citrate, Noscapine HCl, Noscapine, dl-Methylephedrine HCl, dl-methylephedorinsaccharinate, Carbetapentane citrate, Dimemorfan phosphate, Benproperine phosphate, Isoaminile citrate, Oxeladine citrate, Oxeladine tannic acid, Eprazinone HCl, Crobtinol HCl, Chlophedianol HCl, Hominoben HCl, l-methylephedrine HCl, Trimetoquinol HCl, 鹽酸苯基丙醇胺, Methoxyphenamine HCl, Oxymethepanol, Ahen, Ethylmolhyne HCl, Molhyne HCl, Molhyne sulfate, Ahenalcaroid HCl, TRK-851, CS-003 等，這些可單獨或 2 種以上合併使用。

本發明的醫藥配合劑中，上述具有止咳作用的藥劑之配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為 1mg~20g，較佳為成年人 1 日量為 1.2mg~10g。

本發明的醫藥配合劑中，除上述必須成分之外更可添加其他藥效成分。作為如此藥效成分的例子，可舉出 1 種或 2 種以上選自氣管擴張劑、抗組織胺劑、興奮劑、生物藥、抗酸劑或黏膜保護劑、殺菌劑。

上述成分之中，作為支氣管擴張劑，可舉出胺茶鹼、聯丙烯基、茶鹼、羥丙茶鹼、膽茶、腎上腺素、鹽酸麻黃鹼、硫酸異丙腎上腺素、鹽酸異丙腎上腺素、硫酸間羥異丙腎上腺素、言酸氣喘通、硫酸柳丁胺醇、硫酸叔丁喘

029477

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

## 五、發明說明 ( 4 )

寧、鹽酸妥布特羅、鹽酸普魯卡地魯、溴氫酸酚丙喘寧、富馬酸福莫特羅、鹽酸雙氫醇胺、Mabuterol HCl、溴化抗乙醯膽鹼、FlutropiumBr、溴化氧膽鹼、溴化硫膽鹼、沙美特羅、硫酸六甲雙喘定、Ro25-1553、血管作用性腸管肽衍生物 (VIP/PACAP 衍生物) 等，這些可單獨或 2 種以上並用使用。

支氣管擴張劑的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為  $10 \mu\text{g} \sim 1000\text{mg}$ ，較佳為成年人 1 日量為  $42\text{mg} \sim 600\text{mg}$ 。

又，作為抗維他命藥劑的例子，可舉出 Isothipendyl HCl, Diphenylpyraline HCl, Diphenhydramin HCl, Dipheterol HCl, Triprolidine HCl, 鹽酸特比安明, 鹽酸桑西胺, Phenetazin HCl, Methodirazin, Diphenhydramine 水楊酸, 二苯二磺酸 Carbinoxamine, 酒石酸 alimemazine, 丹寧酸 diphenhydramine, teoculic acid diphenylpyrarine, Napadysilic acid mebuhydrorine, Promethazine methylene 二水楊酸鹽, 馬來酸 carbinoxamine, dl-馬來酸氯苯比胺, d-馬來酸氯苯比胺, 磷酸 dipheterol, Promethazine, Mequitazine, cyproheptadine HCl, Iproheptine HCl, Clematine fumaric acid, epnastin HCl, Olobatazine HCl, Pheqisophenazine HCl, Loratadine, vepotastine vesilic acid, mizolastine, NIP-531 等，這些可單獨或 2 種以上合併使用。抗組織胺藥劑的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

029478

## 五、發明說明 ( )

本醫藥配合劑中亦可更添加維他命類，或消炎酵素藥。

且，作為維他命類的例子可舉出，辛硫胺素、Prosultiamine, fulsultiamine, fulsultiamine HCl, Bisbentiamine, Benfotiamine, Disetiamine HCl, Sicotiamine, Cocalboxylase, Tiaminedisulfid, 鹽酸硫胺素、硝酸硫胺素、硝酸雙硫胺素、硫胺素二鯨蠟硫酸酯鹽、bisibutiamine 等維他命 B1 及其衍生物與其鹽類、核黃素、丁酸核黃素、磷酸核黃素鈉、黃素腺嘌呤二核苷酸鈉等維他命 B2 及其衍生物與其鹽類、抗壞血酸、抗壞血酸鈉、抗壞血酸鈣等維他命 C 及其衍生物與其鹽類、橙皮苷及其衍生物與其鹽類、維他命 F、醋酸松香油、棕櫚酸松香油等維他命 A 及其衍生物與其鹽類、檸檬酸生育酚、檸檬酸生育酚鈉、醋酸生育酚、生育酚等維他命 E 及其衍生物與其鹽類等。這些可單獨或 2 種以上合併使用。

維他命類的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為 0.1mg~2000mg，較佳為成年人 1 日量為 1mg~500mg。

又，作為消炎酵素藥的例子可舉出菠蘿蛋白酶、蛋白酶、Cerapeptidase、半鹼性蛋白酶、鏈激酶、鏈道酶、氯化溶菌酶等，這些可單獨或 2 種以上合併使用。

消炎酵素藥的配合量，一般為成年人 1 日量為 4mg~300mg，較佳為 15mg~60mg。

又，本發明的醫藥配合劑中，作為 Fudostein 以外去痰

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 8 )

劑的例子，可舉出愈瘡木酚、gaiphenesin、碘化鉀、氨茴香精、碳酸氫鈉、鹽酸溴己胺、碳化半胱胺酸、乙醯半胱胺酸、鹽酸甲基半胱胺酸、鹽酸易咳嗉、氨茶鹼、茶鹼、丙脞茶鹼、脞丙茶鹼、氯化銨、甲酚磺酸鉀、I-薄荷醇、鹽酸三甲醇、鹽酸苯基丙醇胺、鹽酸甲氧基非那明等，這些可單獨或 2 種以上合併使用。Fudostein 的配合量應需要而決定，但一般為成年人 1 日量為 1mg~3000mg，較佳為成年人 1 日量為 6mg~900mg。

本發明的醫藥配合劑，適當組合上述各藥劑有效成分及藥學上可被接受的製劑添加物，依據一般方法，可經錠劑、顆粒劑、細粒劑、散劑、硬膠囊劑、軟膠囊劑、丸劑、片劑、滴劑、懸浮劑、乳劑、內服液劑、糖漿劑、乾糖漿劑、吸入劑、口腔黏膜附著製劑等經口投與型態之固體、半固體或液狀製劑經製劑化而調製出。且，各藥劑有效成分，經微膠囊、毫微膠囊、微顆粒、毫微顆粒等微小粒子後，可作為前述的製劑。

本發明的醫藥配合劑的調製，雖無特別限制，可經種種方法而實施。例如製劑必須調整成錠劑、顆粒劑、細粒劑、散劑、膠囊劑、丸劑、乾糖漿劑等造粒粉末時，可利用含有水或有機溶劑的溶液或分散液之噴霧造粒法、攪拌造粒法、流動造粒法、轉動造粒法、轉動流動造粒法等濕式造粒法、使用粉粒狀結合劑之壓密造粒法等之乾式造粒法等一般被利用的造粒法而製造。

而製劑為顆粒劑、細粒劑、散劑等時，混合含有有效

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線



## 五、發明說明 ( g )

成分粉末或造粒末經分成小包填充即可，作為膠囊劑時，粉末劑、造粒劑、小型的錠劑等使用膠囊填充劑填充於膠囊而製造。又，作為錠劑時，混合有效成分的粉末、粉末劑、細粒劑、顆粒劑或丸劑製劑添加物，再壓縮成型即可。

且，糖衣錠、薄膜糖衣錠、糖衣顆粒等之糖衣製劑時，使用平版包覆法、流動包覆法、轉動包覆法及組合這些之糖衣劑將錠劑或顆粒劑包覆即可。糖衣劑可溶解及/或分散於有機溶劑中進行噴霧包覆，又直接散佈糖衣劑，經熱及壓力等進行乾燥包覆。糖衣劑的包覆量，依劑型等而選擇，一般以錠劑而言為 0.1~100 質量%、丸劑、顆粒劑而言為 0.1~200 質量%、細粒劑而言為 0.1~300 質量%。

且，糖漿劑、甘香酒劑、檸檬水劑、萃取劑、飲料劑等內服液劑或液狀或半固體之軟膠囊劑、硬膠囊劑等，一般與各藥劑有效成分與純水等溶劑等的製劑添加物其中一部份經混合·溶解·分散，加入剩下的溶劑等製劑添加物調整液量而製造。若必要可使用酸或鹼進行 pH 調整亦可。且，含有脂溶性成分時，經使用界面活性劑、可溶化劑、乳化劑、懸浮劑等製劑添加物而可溶化、乳化、懸浮化。若必要於調整時，可實施加溫、冷卻、氮氣取代、過濾、滅菌處理等。

本發明的醫藥配合劑，若必要可使用製劑添加物，賦予藥效成分的安定化、緩釋性、速崩性、速溶性、溶解性的改善、味道的隱藏、服用感的改善等的功能。這些功能

029483

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 10 )

的附加方法，可使用一般使用的方法進行，例如藥效成分可使用將顆粒分別添加之製藥方法、多層顆粒的製藥方法、多層錠或有核錠之製藥方法，各顆粒經打錠的製藥方法、微膠囊之製藥方法、糖衣錠、薄膜糖衣錠、糖衣顆粒等之糖衣製劑製造方法、發泡製劑之製造方法、藥瓶製劑的製造方法、口腔內崩解製劑的製造方法、基質製劑的製造方法、共粉碎的製造方法、固體溶體之製造方法、添加甜味劑或清涼化劑之方法、抗氧化劑或安定（化）劑的添加方法、調整特定 pH·粘度·浸透壓·鹽濃度之方法等種種方法，或組合這些方法。

本發明的醫藥配合劑之製造而言，所使用的藥學上被接受的製劑添加物，可舉出安定劑、安定化劑、界面活性劑、可塑劑、潤滑劑、可溶劑、還元劑、緩衝劑、甜味劑、基劑、吸著劑、改味劑、結合劑、懸浮劑、抗氧化劑、光澤化劑、糖衣劑、劑皮、濕潤劑、濕潤調整劑、填充劑、消泡劑、清涼化劑、著色劑、香味劑、香料、糖衣劑、等張化劑、軟化劑、乳化劑、黏稠化劑、黏稠劑、發砲劑、pH 調整劑、稀釋劑及賦形劑、分散劑、崩壞劑、崩壞輔助劑、崩壞延長劑、芳香劑、防濕劑、防腐劑、保存劑、溶劑劑、溶解輔助劑、溶劑、流動化劑、靜電防止劑、增量劑、保濕劑、付濕劑等添加劑。較具體可舉出以下製劑添加物，可單獨使用或 2 種以上混合使用。

首先作為賦形劑、基劑、填充劑的具體例子，可舉出

DL-丙胺酸、dl-蘋果酸、D-山梨糖醇、D-山梨糖醇液、D-甘

029484

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 11 )

露糖醇、L-天冬胺酸、L-谷氨醯胺、 $\beta$ -還糊精、胺基乙基磺酸、糖粉、阿拉伯橡膠、阿拉伯橡膠粉末、褐藻酸、褐藻酸鈉、褐藻酸丙二醇酯、 $\alpha$ 化澱粉、肌醇、乙醇、乙基纖維、辛基癸機三甘油酯、opdrybage、橄欖油、油酸、陶土、可可脂、酪蛋白、酪蛋白鈉、天然膠、焦糖、巴西棕櫚蠟、羧基乙烯基聚合物、羧基甲基澱粉鈉、carmellose、camellose Ca、camellose Na、甘草、澱粉、澱粉粉末、咕噸橡膠、木糖醇、檸檬酸、檸檬酸鈉、檸檬酸二鈉、甘胺酸、甘油、甘油脂肪酸酯、葡糖酸鈣、葡糖酸鈉、croscamellose Na、交聯性聚乙烯吡咯烷酮、桂皮粉末、矽酸鋁酸鎂、矽酸鈣、矽酸鎂、玄米麴、琥珀化明膠、芝麻油、小麥澱粉、小麥胚芽粉、米澱粉、膽固醇、紅花油、沙輪蜜蠟、二羥基鋁胺基乙酸鹽、dimethyl polinoxan (內服用)、蔗糖脂肪酸酯、硬脂醇、硬脂酸、硬脂酸鈣、硬脂酸聚烴氧基 40、硬脂酸鎂、玉米蛋白、倍半油酸山梨糖醇酐、鯨蠟醇、石膏、明膠、山梨糖醇酐脂肪酸酯、大豆硬化油、大豆油、滑石、葡聚糖 40、糊精、脫氫醋酸鈉、玉米糖漿、玉米澱粉、玉米澱粉造粒物、西黃耆膠、西黃耆膠粉末、三醋精、菜子油、珍珠、裸麥汁乾燥粉末、蜂蜜、石蠟、馬鈴薯澱粉、巧克力片、羥基丙基澱粉、羥基丙基纖維、羥基丙基纖維、羥基丙基甲基纖維 2208、羥基丙基甲基纖維 2906、羥基丙基甲基纖維 2910、羥基丙基甲基纖維苯二酸酯、蓖麻油、葵花油、植酸油、非那西汀、葡萄糖、葡糖水合物、prulan、丙二醇、丙二醇脂肪酸酯、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 15 )

camellose Na、甘草、澱粉粉末、咕噸橡膠、檸檬酸、檸檬酸鈣、檸檬酸鈉、甘油、甘油脂肪酸酯、croscamellose Na、交聯性聚乙烯吡咯烷酮、矽酸鎂、小麥澱粉、米澱粉、膽鹼磷酸鹽、紅花油、沙輪蜜蠟、丁二酸二辛酯磺酸鈉、蔗糖脂肪酸酯、硬脂酸、硬脂酸鈣、硬脂酸聚烴氧基 40、硬脂酸鎂、倍半油酸山梨糖醇酐、明膠、山梨糖醇酐脂肪酸酯、滑石、大豆油、糊精、玉米澱粉、西黃耆膠粉末、三油酸山梨糖醇酐、蜂蜜、石蠟、麥芽糖澱粉、羥基乙基澱粉、羥基乙基甲基澱粉、羥基丙基澱粉、羥基丙基纖維、羥基丙基甲基纖維 2910、羥基丙基甲基纖維 2910 混合物、蓖麻油、福馬酸、福馬酸一鈉、丙二醇、丙二醇脂肪酸酯、膨潤土、聚乙烯吡咯烷酮、聚環氧乙烷 (105) 聚環氧丙烷 (5) 乙二醇、聚環氧乙烷 (160) 聚環氧丙烷 (30) 乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 40、聚山梨酸酯 20、聚山梨酸酯 40、聚山梨酸酯 60、聚山梨酸酯 80、聚乙烯縮醛二乙基胺基乙酸鹽、聚磷酸鈉、macrogol 1500、macrogol 300、macrogol 400、macrogol 4000、macrogol 6000、甲基矽酸鋁酸鎂、甲基磷酸鈉、甲基纖維、木蠟、單油酸山梨糖醇酐、單硬脂酸鋁、單硬脂酸甘油、單棕櫚酸山梨糖醇酐、單月桂酸山梨糖醇酐、月桂基硫酸鈉、lauromacrogol、磷酸氫鈣、磷酸氫鈣造粒物、磷酸二氫鈣、乾燥氫氧化鋁膠、輕質氧化鋁、輕質無水矽酸、結晶纖維、結晶纖維、carmellose Na、硬化油、含水二氧化矽、合成矽酸鋁、氧

**029489**

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 16 )

化鈦、四脫氫醋酸鈉、重質無水矽酸、醋酸乙烯樹脂、醋酸苯二酸纖維、氫氧化鋁鎂、氫氧化鈉、純化蟲膠、純化大豆卵磷脂、純白糖、大豆卵磷脂、第三磷酸鈣、碳酸鎂、碳酸氫鈉、碳酸鈣沈澱、低取代羧基甲基澱粉鈉、低取代羥基丙基纖維、乳酸、濃甘油、白色蟲膠、白糖、部分 $\alpha$ 化澱粉、無水乙醇、無水檸檬酸、無水檸檬酸鈉、無水焦磷酸鈉、流動石蠟等。

作為 pH 調整劑、等滲壓劑、緩衝劑的具體例，可舉出 dl-蘋果酸、D-山梨糖醇、D-山梨糖醇液、D-甘露糖醇、D-酒石酸、L-天冬胺酸鎂、L-精胺酸、L-谷胺酸、L-谷胺酸鈉、己二酸、抗壞血酸、胺基乙基磺酸、木糖醇、檸檬酸、檸檬酸鈣、檸檬酸鈉、檸檬酸二鈉、甘胺酸、甘油、葡糖酸- $\delta$ -內酯、葡糖酸鈣、琥珀酸、琥珀酸二鈉六水合物、煙鹼酸醯胺、葡萄糖、福馬酸一鈉、丙二醇、聚磷酸鈉、macrogol 4000、馬來酸、甲基磷酸鈉、磷酸二氫鉀、磷酸二氫鈉、玫瑰油、安息香酸、安息香酸鈉、氯化鉀、氯化鈣、氯化鈉、氯化鎂、鹽酸、葡糖胺鹽酸、果糖、乾燥亞硫酸鈉、乾燥碳酸鈉、稀鹽酸、酒石酸、醋酸、氫氧化鈉、氫氧化鎂、生理食鹽水、碳酸鈉、碳酸氫鈉、乳酸、乳酸鈣、乳糖、濃甘油、冰醋酸、無水檸檬酸、無水檸檬酸鈉、無水焦磷酸鈉、無水磷酸一氫鈉、無水磷酸三鈉、無水磷酸二氫鈉、硫酸氫鈉等。

作為界面活性劑、乳化劑、發泡劑的具體例子，可舉出 D-山梨糖醇、乙醇、角叉菜膠、羧基乙烯基聚合物、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 17 )

carmellose Na、瓜爾豆膠、甘油、甘油脂肪酸酯、膽固醇、沙輪蜜蠟、二辛基鈉磺琥珀酸鹽、蔗糖脂肪酸酯、硬脂醇、硬脂酸、硬脂酸聚烴氧基 40、倍半油酸山梨糖醇酐、鯨蠟醇、明膠、山梨糖醇酐脂肪酸酯、滑石、三油酸山梨糖醇酐、石蠟、麥芽糖澱粉、羥基乙基甲基澱粉、丙二醇、丙二醇脂肪酸酯、果膠、聚環氧乙烷 (105) 聚環氧丙烷 (5) 乙二醇、聚環氧乙烷 (160) 聚環氧丙烷 (30) 乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 40、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚烴氧基 35 蓖麻油、聚山梨酸酯 20、聚山梨酸酯 60、聚山梨酸酯 80、macrogol 400、甘油三肉豆蔻酸辛癸酯、甲基纖維、單油酸山梨糖醇酐、單硬脂酸甘油、單棕櫚酸甘油酸山梨糖醇酐、單月桂酸山梨糖醇酐、氧化月桂基二甲基胺液、基月桂基硫酸鈉、lauromacrogol、乾燥碳酸鈉、酒石酸、氫氧化鈉、純化大豆卵磷脂、大豆卵磷脂、碳酸鉀、碳酸氫鈉、中鏈脂肪酸三甘油酯、無水矽酸、棉子油、大豆油混合物、流動石蠟等。

作為濕潤劑、濕潤調整劑、結合劑、懸浮化劑、黏稠劑、粘著劑、粘著增強劑、軟化劑、可塑劑的具體例子，可舉出 D-山梨糖醇、D-山梨糖醇液、D-甘露糖醇、RSSNo.1 生橡膠、β 克菌丹、β-環糊精、丙烯酸·丙烯酸辛酯共聚物、丙烯酸 2-乙基己基·乙烯基吡咯烷酮共聚物溶液、丙烯酸 2-乙基己基·甲基丙烯酸 2-乙基己基·甲基丙烯酸十二烷共聚物溶液、丙烯酸酯·醋酸乙烯基共聚物、丙烯酸

029491

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 18 )

乙基·甲基丙烯酸甲基共聚物分散液乙醯基甘油脂肪酸酯、丙烯酸絲織蛋白共聚物樹脂、丙烯酸甲基·丙烯酸-2-乙基己基共聚物樹脂乳化劑、丙烯酸樹脂烷醇胺液、硬脂酸鎂、胺基烷基甲基丙烯酸酯聚合物 E、胺基烷基甲基丙烯酸酯聚合物 RS、胺基乙基磺酸、支鏈澱粉、糖粉、阿拉伯橡膠、阿拉伯橡膠粉末、褐藻酸鈉、褐藻酸丙二醇酯、 $\alpha$ 化澱粉、酯橡膠、乙醇、乙基纖維、異抗壞血酸鈉、aubata 粉末、橄欖油、油酸鈉、陶土、可可脂、酪蛋白鈉、天然膠、焦糖、巴西棕櫚蠟、羧基乙烯基聚合物、羧基甲基乙基先纖維、羧基甲基澱粉鈉、carmellose、camellose Ca、camellose Na、澱粉、澱粉粉末、咕噸橡膠、醋酸苯甲基、瓜爾豆膠、檸檬酸鈉、甘胺酸、甘油、甘油脂肪酸酯、葡糖酸- $\delta$ -內酯、矽酸鎂、矽酸鎂鋁、柯巴樹脂、Copolyvidone、芝麻油、小麥澱粉、米澱粉、火棉膠、軟骨素硫酸鈉、沙輪蜜蠟、二辛基鈉磺琥珀酸鹽、順聚異普林橡膠、二羥基鋁胺基乙酸鹽、二丁基羥基甲苯、二甲基聚矽氧烷（內服用）、二甲基聚矽氧烷·二酸化矽混合物、蔗糖脂肪酸酯、硬脂醇、硬脂酸、硬脂酸鋁、硬脂酸鈣、硬脂酸聚烴氧基、硬脂酸聚烴氧基 40、苯乙烯·異普林·苯乙烯嵌和共聚物、苯乙烯異普林橡膠、倍半油酸山梨糖醇酐、鯨蠟醇、明膠、蟲膠、山梨糖醇酐脂肪酸酯、溶劑石腦油、大豆硬化油、滑石、達碼樹脂、葡聚糖 70、糊精、萜烯樹脂、澱粉（可溶性）、玉米澱粉、玉米油、西黃耆膠、西黃耆膠粉末、三油酸山梨糖醇酐、菜子油、高

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 19 )

順聚異普林橡膠〔分子量 47000〕、蜂蜜、石蠟、馬鈴薯澱粉、begum neutral、羥基乙基纖維、羥基乙基纖維、羥基乙基甲基纖維、羥基丙基纖維、羥基丙基澱粉、羥基丙基甲基纖維 2208、羥基丙基甲基纖維 2906、羥基丙基甲基纖維 2910、羥基丙基甲基纖維乙酸琥珀酸鹽、羥基丙基甲基纖維苯二酸酯、乙烯吡咯烷酮·醋酸乙烯共聚物、增效醚、蓖麻油、葡萄糖、福馬酸、福馬酸·硬脂酸·聚乙烯乙酸鹽二乙基胺基乙酸鹽·羥基丙基甲基纖維 2910 混合物、福馬酸硬脂基鈉、prulan、丙二醇、丙二醇脂肪酸酯、果膠、膨潤土、聚乙烯吡咯烷酮、聚丙烯酸、聚丙烯酸鈉、聚丙烯酸水溶液、聚丙烯酸部分中和物、聚異伸丁基、聚環氧乙烷(160)聚環氧丙烷(30)乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚山梨酸酯 20、聚山梨酸酯 60、聚山梨酸酯 80 聚乙烯乙酸鹽二乙胺乙酸鹽、聚乙烯醇(完全皂化物)、聚乙烯醇(部分皂化物)、聚丁烯、聚磷酸鈉、macrogol 1500、macrogol 20000、macrogol 300、macrogol 400、macrogol 4000、macrogol 600、macrogol 6000、馬來昔化松香甘油酯、蜜蠟、甲基丙烯酸·丙烯酸 n-丁基共聚物、甲基丙烯酸共聚物 L、甲基丙烯酸共聚物 LD、甲基丙烯酸共聚物 S、甲基矽酸鋁酸鎂、甲基磷酸鈉、甲基纖維、甲醯乙烯酯·無水馬來酸共聚物、木蠟、單硬脂酸甘油、月桂基硫酸鈉、lauromacrogol、花生油、磷酸、磷酸氫鈣、松香、氯化鈣、氯化鈉、氯化鎂、含水羊毛脂、水解明膠粉末、水解澱粉加輕質無水矽酸、果糖、乾燥氫氧化

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線



## 五、發明說明 ( 21 )

8471、opadryOY-S-9607、橄欖油、陶土、可可脂、夏枯草、硬化蓖麻油、焦糖、棕櫚蠟、羧基乙烯基聚合物、羧基甲基乙基澱粉鈉、羧基甲基澱粉鈉、camellose Ca、camellose Na、檸檬酸三乙基、甘油、甘油脂肪酸酯、矽酸鈣、琥珀化明膠、小麥澱粉、米澱粉、沙輪蜜蠟、二甲基胺基乙基丙烯酸甲酯·甲基丙烯酸甲酯共聚物、二甲基聚矽氧烷（內服用）、二甲基聚矽氧烷·二氧化矽酸混合物、蔗糖脂肪酸酯、二氧化矽乳化劑、矽消泡劑、沈香粉末、硬脂酸鈣、硬脂酸聚烴氧基 40、硬脂酸鎂、玉米蛋白、倍半油酸山梨糖醇酐、鯨蠟醇、石膏、明膠、山梨糖醇酐脂肪酸酯、滑石、萜烯樹脂、澱粉（可溶性）、玉米澱粉、玉米油、三乙酸甘油酯、三油酸山梨糖醇酐、珍珠粉、蜂蜜、石蠟、馬鈴薯澱粉、羥基丙基纖維、羥基丙基甲基纖維 2208、羥基丙基甲基纖維 2906、羥基丙基甲基纖維 2910、羥基丙基甲基纖維 2910·氧化鈦·macrogol 400 混合物、羥基丙基甲基纖維乙酸琥珀酸鹽、羥基丙基甲基纖維苯二酸酯、增效醚、蓖麻油、酞酸二乙酯、丁基酞基丁基乙二醇、葡萄糖、福馬酸·硬脂酸·聚乙烯乙酸鹽二乙基胺基乙酸鹽·羥基丙基甲基纖維 2910 混合物、prulan、丙二醇、膨潤土、聚乙烯吡咯烷酮、聚環氧乙烷（105）聚環氧丙烷（5）乙二醇、聚環氧乙烷（160）聚環氧丙烷（30）乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 40、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚山梨酸酯 80、聚乙烯乙酸鹽二乙胺基乙酸鹽、聚乙烯醇（部分皂化物）、聚丁烯、聚磷酸鈉、

029495

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

## 五、發明說明 ( 23 )

末、乙醇、EDTA 鈣二鈉、EDTA 鈉、異抗壞血酸、異抗壞血酸鈉、可可脂、羧基乙烯聚合物、camellose Ca、camellose Na、澱粉、咕噸橡膠、木糖醇、檸檬酸、檸檬酸鈣、檸檬酸鈉、甘胺酸、甘油、甘油脂肪酸酯、葡糖酸- $\delta$ -內酯、葡糖酸鈣、桂皮粉末、芝麻油、軟骨素硫酸鈉、水楊酸鈉、水楊酸苯基、二丁基羥基甲苯、蔗糖脂肪酸酯、硬脂酸、硬脂酸鋁、硬脂酸聚羥氧基、硬脂酸鎂、倍半油酸山梨糖醇酐、鯨蠟醇、明膠、山梨糖醇酐脂肪酸酯、山梨酸、山梨酸鉀、滑石、葡聚糖、葡聚糖 40、葡聚糖 70、脫氫醋酸、脫氫醋酸鈉、生育酚、薄荷醇、茶酚、煙醯胺、蜂蜜、間氧基安息香酸異丁基、間氧基安息香酸異丙基、間氧基安息香酸乙基、間氧基安息香酸丁基、間氧基安息香酸丙基、間氧基安息香酸甲基、泛酸鈣、羥基丙基纖維、對苯二酚、焦磷酸四鈉、焦亞硫酸鈉、非那西汀、丁基羥基茴香醚、葡萄糖、富馬酸、富馬酸一鈉、聚乙烯吡咯烷酮、聚丙烯酸部分中和物、聚環氧乙烷(160)聚環氧丙烷(30)乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚山梨酸酯 20、聚山梨酸酯 60、聚山梨酸酯 80、聚乙烯醇(部分皂化物)、聚磷酸鉀、聚磷酸鈉、macrogol 300、macrogol 400、macrogol 4000、馬來酸、丙二酸、甲基矽酸鋁酸鎂、甲基磷酸鈉、甲基纖維、甲基橙皮苷、單硬脂酸鋁、單硬脂酸甘油、桉油、月桂基硫酸鈉、龍腦粉末、蘋果酸、磷酸、磷酸氫鈉、磷酸二氫鉀、磷酸二氫鈣、亞硫酸氫鈉、安息香酸、安息香酸鈉、安息香酸苯甲基、氯化

029497

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 28 )

藻萃取物、小球藻粉末、桂皮酊劑、桂皮粉末、桂皮油、琥珀酸、琥珀酸二鈉六水合物、琥珀酸一鈉、昆布粉末、糖精、糖精鈉、藏紅花、藏紅花酊劑、山椒酊劑、山椒粉末、縮砂粉末、生姜酊劑、生姜粉末、生姜油、沈香粉末、肉桂醛、硬脂酸、薄荷油、當藥、蘇葉粉末、大豆油、大棗、蒲公英根、草乾燥萃取物、丹寧酸、丁香酊劑、丁香油、陳皮酊劑、辣椒、辣椒粉末、辣椒酊劑、唐繪酊劑、唐繪粉末、苦木粉末、鳳梨粉末香料 51357、鳳梨粉末香料 59492、蜂蜜、薄荷水、薄荷油、香草粉末香料 5428632、焦磷酸四鈉、葡萄酒、葡萄糖、葡萄糖果糖液糖、福馬酸、福馬酸一鈉、薄荷粉末、聚乙烯吡咯烷酮、還原麥芽糖、還原麥芽糖液、MALTSUPEX、麥芽糖、蒼草乾燥萃取物、甲基纖維、薄荷醇粉末、桉油、龍腦、龍腦粉末、磷膠液體、蘋果果汁、蘋果酸、蘋果醋、蘋果濃縮果汁（500%）、檸檬油、玫瑰水、玫瑰油、蜂王膠、液糖、氯化鈉、氯化鎂、鹽酸、果糖、果糖葡萄糖液糖、乾燥酵母、還原麥芽糖、稀鹽酸、高葡萄糖麥芽糖、高果糖液糖、黑砂糖、酒石酸、酒石酸氫鉀、食用胡蘿蔔粉末、醋酸、麥芽糖、純化甘草萃取物粉末、純化蜂蜜、純化白糖、純化白糖球狀顆粒、脫脂奶粉、單糖漿、碳酸氫鈉、中鏈脂肪酸三甘油酯、銅葉綠酸鈉、乳酸、乳糖、濃甘油、梅子肉萃取物、白糖、冰醋酸、粉糖、粉末還原麥芽糖、無水乙醇、無水檸檬酸、無水焦磷酸鈉、丁酸乙基、綠茶粉末等。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

## 五、發明說明 ( 26 )

作為吸附劑的具體例子可舉出，陶土、camellose Ca、含水二氧化矽、矽酸鎂、輕質無水矽酸、矽酸鈉土、結晶纖維、合成矽酸鋁、氧化鋁、氫氧化鋁、碳酸鎂、沈澱碳酸鈣、糊精、二氧化矽、彭潤土、甲基矽酸鋁酸鎂、藥用碳等。

作為消泡劑的具體例子，可舉出乙醇、甘油脂肪酸酯、二甲基聚矽氧烷（內服用）、二甲基聚矽氧烷·二氧化矽混合物、蔗糖脂肪酸酯、矽樹脂乳化劑、矽消泡劑、硬脂酸聚烴氧基 40、山梨糖醇酐脂肪酸酯、三油酸山梨糖醇酐、聚山梨酸酯 80。

作為咀嚼劑的具體例，可舉出 d-龍腦等。

作為著色劑的具體例，可舉出棕兒茶丹寧粉末、鬱金香萃取液、黃色三三氧化鐵、Opaspre-K-1-24904、橘子香料、褐色氧化鐵、炭黑、焦糖、胭脂紅、胡蘿蔔素、 $\beta$ -胡蘿蔔素、甘草萃取物、金箔、黑氧化鐵、輕質無水矽酸、氧化鈦、三三氧化鐵、食用青色 1 號、食用黃色 4 號、食用黃色 4 號鋁沈澱、食用黃色 5 號、食用紅色 2 號、食用紅色 3 號、食用紅色 102 號、氫氧化鈉、滑石、銅葉綠素鈉、銅葉綠酸、裸麥綠葉萃取物、d-龍腦、肉豆蔻酸辛基月桂基、藥用碳、丁酸核黃素、綠茶粉末、磷酸核黃素鈉、玫瑰油等。

作為無痛劑的具體例子，可舉出肌醇、碳酸氫鈉、丁香油、葡萄糖、丙二醇、Lidocaine 等。

由以上所得的本發明醫藥配合劑，該組成物中所含的

123500

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

## 五、發明說明 ( 27 )

fudostein 與具有止咳作用之藥劑互相作用於彼此藥劑上，可增強彼此之效果，故該醫藥配合劑可作為，特別為使用於治療、緩和產生痰的感冒等疾病之醫藥極為有用。

即，如以下試驗例所示，fudostein 的去痰效果因並用具有止咳作用之藥劑而增強，且具有止咳作用之藥劑的消炎作用亦因並用 fudostein 而增強。期待更優良的治療效果。

### 實施例

以下舉出實施例及試驗例對本發明做更具體的說明，但本發明不受這些實施例的任何限制。

### 試驗例 1

對止咳作用試驗：

依據下述方法，對 fudostein 與具有止咳作用之藥劑並用時之相乘效果做調查。其結果如表 1 所示。

### (方法)

作為實驗動物，使用 1 群 5 匹的 300 至 400 克的哈多雷 (Hartley) 系雄性土撥鼠。依據宮田氏們的方法 (Arch. Int. Pharmacodyn. Ther. 第 304 卷，第 277 頁，1990 年)，將二氧化硫氣體暴露裝置中 1 天 2 小時，連續進行 8 天將土撥鼠暴露其中而做成氣管炎土撥鼠。將如表 1 所示成分及投與量之檢體，於暴露開始日 1 天 1 次做 8 天暴露

029501

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 29 )

用，但此與 fudostein 並用投與時更顯示止咳作用的增強。又，顯示用量反應性，兩劑的並用可顯示止咳作用的相乘效果。其結果，與 fudostein 並用時顯示更增強止咳藥的止咳作用。

### 實施例 1

錠劑：

使用 1200g 的 fudostein、60g 的溴氫氧右旋美蘇仿、38g 的玉米澱粉、1g 的滑石及 1g 的硬脂酸鎂，依常法成爲打錠粉末。使用旋轉打錠機打錠該打錠粉末，製成直徑 8.5 mm，1 錠爲 250mg 的錠劑。

### 實施例 2

液劑：

使用 8g 的 fudostein、400mg 的溴氫氧右旋美蘇仿、20g 的赤蘚醇、100mg 的焦糖、70mg 的安息香酸鈉及 100mg 的香料溶解於純水中，添加適量的磷酸調整 pH，以純水調製全量爲 100ml 的液劑。

### 實施例 3

錠劑：

使用 120g 的 fudostein、3g 的磷酸二氫 codeine、5g 的 dl-鹽酸 methylephedrine、0.8g 的馬來酸氫苯吡胺、9g 的無水咖啡因、159.8g 的馬鈴薯澱粉、1.2g 的滑石及 1.2g 的硬

129503

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

# 公告本

92年12月3日 修正  
補充

申請日期	91年5月24日
案號	91111107
類別	A61K 3/198, 9/20, 3/439, 4/400, 4/02, 4/12, A61P 1/10, 1/14

A4  
C4

589177

(以上各欄由本局填註)

## 發明專利說明書

一、發明 名稱	中文	使用於增強止咳作用的醫藥配合劑
	英文	Having improved antitussive effect drug preparations
二、發明 創作人	姓名	(1) 小貫洋一 (2) 岡田實 (3) 坂井裕貴
	國籍	(1) 日本國千葉縣成田市中台二-三-一七
	住、居所	(2) 日本國千葉縣印西市木下東四-七-二〇  (3) 日本國千葉縣四街道市四街道一-二〇-六
三、申請人	姓名 (名稱)	(1) 愛詩愛詩製藥股份有限公司 エスエス製藥株式会社
	國籍	(1) 日本
	住、居所 (事務所)	(1) 日本國東京都中央區日本橋浜町二丁目二番四號
	代表人 姓名	(1) 萱生統

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

裝  
訂  
線

## 五、發明說明 ( 5 )

量為 1mg~300mg，較佳為成年人 1 日量為 3mg~150mg。

且，作為興奮劑的例子，可舉出安息香酸鈉咖啡因、  
咖啡因、dl-甲基黃麻素、dl-甲基黃麻素糖精、苯甲酸鈉咖  
啡因、咖啡因、無水咖啡因、鹽酸麻黃素、鹽酸苯基丙醇  
胺、脫經腎上腺素、I-methylephedrine HCl,  
Methoxyphenamine HCl, dl-鹽酸腎上腺素、dl-鹽酸喘息  
定、硫酸喘息定、硫酸間煙異丙腎上腺素、硫酸叔丁喘  
寧、硫酸柳丁氨醇、Trimetoquinol HCl, 硫酸六甲雙喘  
定、鹽酸氯喘通、Turobuterol HCl, Procaterol HCl,  
Pylbuterol HCl, 酚丙喘寧溴酸、Folmoterolfumarate, 鹽酸  
雙氯醇胺、Mabuterol HCl, 鹽酸乙基半胱胺酸、鹽酸甲基  
半胱胺酸、甲黃麻鹼等，這些可單獨或 2 種以上合併使  
用。

興奮劑的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，  
以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為 1~900  
mg，較佳為成年人 1 日量為 5~300mg。

又，作為生物藥的例子可舉出麻黃、南天實、櫻皮、  
遠志、甘草、桔梗、車前子、車前草、石蒜、遠志、貝  
母、茴香、黃柏、黃連、菝葜、春黃菊、桂皮、龍膽、牛  
黃、獸膽、砂參、生薑、蒼朮、丁字、陳皮、白朮、地  
龍、竹節、竹節人參、人參、黃根、葛根、杏仁、香附  
子、梗米、厚朴、五味子、紫胡、細辛、芍藥、蘇葉、大  
棗、麥門冬、半夏、茯苓、葛根湯、桂枝湯、香酥散、紫  
胡桂枝湯、小紫胡湯、小青龍湯、麥門冬湯、半夏厚朴

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂



## 五、發明說明 ( 6 )

湯、麻黃湯、荊芥、連翹、辛夷、桃仁、附子等的生藥末及其萃取物等。這些可單獨或 2 種以上合併使用。生物藥粉末的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為，萃取物（原生藥換算量）0.001g~300 g，粉末為 0.0004g~60g，較佳為成年人 1 日量的萃取物（原生藥換算量）為 0.005g~10 g，粉末為 0.001g~3g。

另一方面，作為抗酸劑或黏膜保護藥的例子，可舉出胺基醋酸、酸化鎂、碳酸鎂、矽酸鎂、合成矽酸鋁、合成 hydrotalsite、二氫化鋁·胺基醋酸鹽、氫氧化鋁膠體、乾燥氫氧化鋁膠體、氫氧化鋁·碳酸鎂混合乾燥膠體·碳酸鎂共沈澱物、氫氧化鎂·硫酸鋁鉀共沈澱物、甲基矽酸鋁酸鎂、氫氧化鎂、硫酸鋁、sucralfate 等，這些可單獨或 2 種以上合併使用。

抗酸劑或黏膜保護藥的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為 10mg~8000mg，較佳為成年人 1 日量為 100mg~4000 mg。

作為殺菌劑的例子，可舉出氯化十六烷基匹力丁、Decalinium Cl、氯己定 HCl 等，這些可單獨或 2 種以上並用使用。

殺菌劑的配合量，依所並用的其他藥物之種類或量，以各公知配合方法而決定，但一般為成年人 1 日量為 0.05mg~50mg，較佳為成年人 1 日量為 0.125mg~5mg。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

## 五、發明說明 ( 12 )

果膠、膨潤土、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯酸鈉、聚乙烯酸部分中和物、聚異丁烯、聚環氧乙烷 ( 105 ) 聚環氧丙烷 ( 5 ) 乙二醇、聚環氧乙烷 ( 160 ) 聚環氧丙烷 ( 30 ) 乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 40、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚硬脂磺酸鈉、聚山梨酸酯 60、聚山梨酸酯 80、聚乙烯聚甲醛二乙基胺基乙酸酯、聚乙烯醇 ( 部分皂化物 )、聚乙烯醇·二乙二醇混合物、牡蠣粉末、macrogol 1500、macrogol 1540、macrogol 20000、macrogol 300、macrogol 400、macrogol 4000、macrogol 6000、麥芽糖醇、蜜蠟、肉豆蔻醇、甘油三肉豆蔻酸酯辛癸基、甲基丙烯酸共聚物 LD、甲基矽酸鋁酸鎂、丙烯酸甲酯·甲基丙烯酸共聚物、甲基纖維、木蠟、單硬脂酸鋁、單硬脂酸甘油、月桂基硫酸鈉、lauromacrogol、花生油、磷酸一氫鈉、磷酸氫鈣、磷酸氫鈣粗物、磷酸氫鈉、磷酸二氫鉀、磷酸二氫鈣、磷酸二氫鈉、玫瑰油、松香、氯化鈉、果糖、乾燥小球藻、乾燥酵母、乾燥氫氧化鋁膠、乾燥硫酸鎂、寒梅粉、還原麥芽糖、含水二氧化矽、含水無晶形氧化矽、輕質無水矽酸、輕質流動石蠟、鯨蠟、結晶纖維、結晶纖維 ( 粗 )、結晶纖維 ( 微粗 )、結晶纖維·carmellose Na、硬化油、合成矽酸鋁、合成矽酸鋁·羥基丙基澱粉·結晶纖維、合成 Hydrotalcite、氧化鈦、氧化鎂、蛇油、酒石酸、酒石酸氫鉀、重質無水矽酸、小麥粉、小麥胚芽油、消毒用乙醇、燒石膏、醋酸鉀、醋酸苯二酸纖維、麥芽糖、氫氧化鋁鎂、氫氧化鋁·碳酸鎂·碳酸鉀共沈澱物、氫氧化鋁·碳酸氫鈉共沈澱

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 13 )

物、氫氧化鋁膠、氫氧化鎂、加氫植物油、生理食鹽水、純化明膠、純化蟲膠、純化蜂蜜、純水、純白糖、純白糖球狀顆粒、大豆卵磷脂、大豆非皂化物、第三磷酸鈣、脫脂奶粉、單糖漿、碳酸銨、碳酸鈣、碳酸鎂、中鏈脂肪酸三甘油酯、碳酸鈣沈澱、低取代羧基甲基澱粉鈉、低取代羥基丙基纖維、天然矽酸鋁、二氧化矽、乳酸、乳酸鈣、乳糖、乳糖粗製物、濃甘油、白色蟲膠、白糖、白糖·澱粉球狀顆粒、半消化體澱粉、微晶體纖維、部分 $\alpha$ 化澱粉、粉糖、粉末纖維、粉末麥芽糖、粉末還原麥芽糖、米粉、無水檸檬酸、無水矽酸水合物、無水磷酸氫鈣、無水磷酸氫鈣造粒物、無水乳糖、無水硫酸鈉、滅菌純水、棉子油、棉子油·大豆油混合物、藥用碳、流動石蠟、硫酸鈣、綠茶粉末等。

其次，作為溶劑、可溶化劑、溶解劑、溶解輔助劑的具體例，可舉出 dl-樟腦、D-甘露糖醇、D-山梨糖醇、D-山梨糖醇液、L-天冬胺酸、L-精胺酸、 $\alpha$ -環糊精、 $\beta$ -環糊精、己二酸、茴香油、酯化玉米油、乙醇、橄欖油、油酸、油酸油烯基、carmellose Na、檸檬酸、檸檬酸鈉、甘胺酸、甘油、甘油脂肪酸酯、芝麻油、紅花油、紅油脂肪酸、水楊酸鈉、紫蘇油、二丁基羥基甲苯、蔗糖脂肪酸酯、硬脂酸聚羥氧基 40、倍半油酸山梨糖醇酐、山梨糖醇酐脂肪酸酯、大豆油、脫氫醋酸鈉、玉米油、三乙酸甘油酯、三油酸山梨糖醇酐、三辛酸甘油酯、菜子油、煙醯胺、薄荷油、羥基丙烯纖維、羥基丙基甲基纖維 2910、蓖

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 14 )

麻油、phenprobamate、葡萄糖、丙二醇、丙二醇脂肪酸酯、聚乙烯吡咯烷酮、聚環氧乙烷(105)聚環氧丙烷(5)乙二醇、聚環氧乙烷(160)聚環氧丙烷(30)乙二醇、聚環氧乙烷硬化蓖麻油、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 40、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60、聚山梨酸酯 20、聚山梨酸酯 60、聚山梨酸酯 80、聚乙烯醇(部分皂化物)、macrogol 1500、macrogol 200、macrogol 300、macrogol 400、macrogol 4000、macrogol 600、macrogol 6000、馬來酸、甘油三肉豆蔻酸異丙基、單油酸山梨糖醇酐、單硬脂酸山梨糖醇酐、椰油、月桂基硫酸鈉、lauromacrogol、花生油、利多卡因、林格氏液、磷酸、磷酸氫鈣、磷酸二氫鉀、安息香酸鈉、安息香酸苯甲基、氯化鈉、氯化鎂、乾燥碳酸鈉、稀鹽酸、魚鱗箔、硬化油、氧化鎂、酒石酸、小麥胚芽油、消毒用乙醇、一般水、醋酸、醋酸苯二酸纖維、氫氧化鈉、生理食鹽水、純化大豆油、純水、純大豆卵磷脂、石油苯炔、大豆卵磷脂、碳酸鈉、碳酸氫鈉、中鏈脂肪酸三甘油酯、低取代羥基丙基纖維、乳酸、濃甘油、白糖、冰醋酸、無水乙醇、無水檸檬酸、無水馬來酸、無水磷酸一氫鈉、滅菌純水、棉子油、流動石蠟等。

作為崩壞劑、崩壞輔助劑、分散劑、防濕劑、流動化劑之具體例子，可舉出 D-山梨糖醇、D-甘露糖醇、己二酸、胺基烷基甲基丙烯酸酯共聚物 RS、阿拉伯橡膠、阿拉伯橡膠粉末、褐藻酸、褐藻酸鈉、褐藻酸丙二醇酯、 $\alpha$ 化澱粉、乙醇、乙基纖維、橄欖油、油酸、羧基乙烯基聚合物、羧基甲基澱粉鈉、carmellose、camellose Ca、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 20 )

鋁膠、寒梅粉、還原麥芽糖、含水二氧化矽、含水無晶形二氧化矽、輕質無水矽酸、含輕質無水矽酸羥基丙基纖維、輕質流動石蠟、結晶纖維、結晶纖維·carmellose Na、硬化油、高分子聚乙烯吡咯烷酮、合成矽酸鋁、合成蠟、氧化鈦、氧化鎂、脂環族飽和烴樹脂、脂肪族烴樹脂、酒石酸鈉鉀、重質無水矽酸、小麥粉、一般水、醋酸乙醯樹脂、醋酸

苯二酸纖維、麥芽糖、氫氧化鋁膠、氫氧化鉀、氫氧化鈉、加氫松香甘油酯、生橡膠、純化明膠、純水、純白糖、石油苯炔、石油樹脂、大豆卵磷脂、單糖漿、碳酸鈣、碳酸鎂、中鏈脂肪酸三甘油酯、沈澱碳酸鈣、低取代羧基丙基纖維、乳酸、乳糖、濃甘油、白色蟲膠、白色凡士林、白糖、微晶體纖維、部分 $\alpha$ 化澱粉、米粉、無水乙醇、棉子油·大豆油混合物、流動石蠟、硫酸鈣、硫酸化蓖麻油鉀鹽·烷基苯炔磺酸鹽混合物等。

作為塗佈劑、糖衣劑、劑皮、光澤化劑、消泡劑的具體例，可舉出 2-甲基-5-乙炔基吡啶甲基丙烯酸酯·甲基丙烯酸共聚物、dl-蘋果酸、D-山梨糖醇、D-山梨糖醇液、D-甘露糖醇、丙烯酸乙基·甲基丙烯酸甲基共聚物分散液、乙醯甘油脂肪酸酯、胺基烷基丙烯酸甲酯共聚物 E、胺基烷基丙烯酸甲酯共聚物 RS、阿拉伯橡膠、阿拉伯橡膠粉末、辛基癸基三甘油酯、opadryOY-6950、opadryOY-22829、opadryOY-S-22835、opadryOY-S-22961、opadryOY-S-7135、opadryOY-S-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 22 )

macrogol 1500、macrogol 1540、macrogol 20000、  
 macrogol 300、macrogol 35000、macrogol 400、macrogol  
 4000、macrogol 600、macrogol 6000、蜜蠟、甘油三肉豆  
 蔻酸酯醇、丙烯酸甲酯共聚物 L、甲基丙烯酸共聚物 LD、  
 甲基丙烯酸共聚物 S、甲基矽酸鋁酸鎂、甲基纖維、木蠟、  
 單硬脂酸鋁、單硬脂酸甘油、單月桂酸山梨糖醇、褐煤酸  
 酯蠟、月桂基硫酸鈉、磷酸氫鈉、磷酸氫鈣、松香、乾燥  
 甲基丙烯酸聚合物 LD、乾燥氫氧化鋁膠、乾燥乳狀白蟲  
 膠、寒梅粉、含水二氧化矽、魚鱗箔、金箔、銀箔、輕質  
 無水矽酸、輕質流動石蠟、含有輕質無水矽酸羥基丙基纖  
 維、鯨蠟、結晶纖維、硬蠟、硬化油、高葡萄糖麥芽糖、  
 合成矽酸鋁、合成蠟、氧化鈦、氧化鎂、小麥粉、熟石  
 膏、醋酸纖維、醋酸乙烷基樹脂、醋酸苯二酸纖維、麥芽  
 糖、氫氧化鋁膠、加氫松香甘油酯、純化明膠、純蟲膠、  
 純石蠟、巴西棕櫚蠟混合蠟、純白糖、第三磷酸鈣、單糖  
 漿、碳酸鈣、碳酸鎂、中金箔、沈澱碳酸鈣、低取代羧基  
 丙基纖維、乳酸鈣、乳糖、濃甘油、白色蟲膠、白糖、部  
 分 $\alpha$ 化澱粉、粉糖、無水矽酸水合物、無水酞酸、無水磷  
 酸氫鈣、藥用碳、流動石蠟、硫酸鈣等。

作為安定劑、安定化劑、抗氧化劑、保存劑、防腐劑的具體例  
 子，可舉出己二酸、DL-丙胺酸、dl-樟腦、D-山梨糖醇液、d-龍腦、D-  
 山梨糖醇、D-甘露糖醇、L-抗壞血酸硬脂酸酯、L-抗壞血酸鈉、L-天冬  
 胺酸、L-天冬胺酸鈉、L-精胺酸、1-薄荷醇、 $\beta$ -環糊精、抗壞血酸、胺  
 基甲基磺酸、褐藻酸鈉、褐藻酸丙二醇酯、白蛋白、硫、肌醇、茴香粉

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明 ( 24 )

鈣、氯化鈉、氯化鎂、鹽酸、鹽酸精胺酸、鹽酸半胱胺酸、果糖、乾燥亞硫酸鈉、乾燥碳酸鈉、含水二氧化矽、稀鹽酸、輕質無水矽酸、結晶纖維、硬化油、氧化鎂、酒石酸、醋酸、醋酸生育酚、氫氧化鈉、氫氧化鎂、純化明膠、純化大豆卵磷脂、純白糖、乾燥氫氧化鋁膠、大豆卵磷脂、大豆非皂化物、碳酸鉀、碳酸鈉、氮素、天然維生素 E、乳酸、乳糖、濃甘油、白糖、微晶體纖維、冰醋酸、沒食子酸丙基、無水檸檬酸、無水檸檬酸鈉、無水焦磷酸鈉、無水磷酸鈉、無水磷酸一氫鈉、藥用碳、卵白白蛋白等。

矯味劑、清涼劑、芳香劑、甜味劑之具體例子，可舉出 5'-異浸酸二鈉、5-鳥苷酸二鈉、DL-丙胺酸、dl-樟腦、dl-甘露糖醇、dl-蘋果酸、dl-蘋果酸鈉、DL-酒石酸鈉、d-樟腦、D-木糖、D-山梨糖醇、D-山梨糖酸液、d-龍腦、D-甘露醇、D-酒石酸、L-天冬胺酸、L-天冬胺酸鈉、L-天冬胺酸鎂、L-谷胺酸、L-谷胺酸 L-精胺酸、L-谷胺酸鈉、L-谷胺酸鹽酸鹽、1-薄荷酸、 $\beta$ -環糊精、抗壞血酸、天冬胺酸鹽、棕兒茶粉末、土常山、土常山萃取物、土常山粉末、胺基乙基磺酸、茴香、茴香酞劑、茴香粉末、茴香油、乙醇、乙基香草醛、赤蘚醇、黃柏、黃砷萃取物、黃蓮、黃蓮粉末、芒柄花根乾燥萃取物、橙子、橙油、可可粉末、甘草萃取物、焦糖、碳醯膽鹼、甘草、甘草萃取物、甘草粗萃取物、甘草粉末、木糖醇、檸檬酸、檸檬酸鈣、檸檬酸鈉、甘胺酸、甘油、甘草酸、甘草酸二氫、甘草酸二鉀、甘草酸二鈉、甘草酸單氫、甘草酸三鈉、葡糖酸- $\delta$ -內酯、小球

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 28 )

於二氧化硫氣體之前，進行經口投與。土撥鼠於飼養室 ( chamber ) 內於無麻醉下固定，暴露於二氧化硫氣體的最後一天之隔天，使用超音波噴霧器 ( TUR-3200 日本光電 ) 將辣椒素 (  $10^{-6}$  mol/L ) 向飼養室內噴霧 2 分鐘，引起咳嗽。於噴霧中 2 分鐘與之後 13 分鐘的共計 15 分鐘進行觀察。計算期間所產生的咳嗽次數。

( 結果 )

表 1

試驗群	咳嗽次數
對照群	22.4± 0.8
fudosteин 30mg/kg	22.6± 1.1
美沙芬 (dextromethorphan) 150mg/kg	13.6± 1.0**
美沙芬 (dextromethorphan) 300mg/kg	10.2± 0.6**, \$
fudosteин (30mg/kg)+美沙芬 (150mg/kg)	7.2± 0.7**, ##, \$\$
fudosteин (30mg/kg)+美沙芬 (300mg/kg)	5.2± 0.4**, ##, ++

\*\* ; p &lt; 0 . 0 1 , 對對照群

## ; p &lt; 0 . 0 1 , fudosteин 30mg/kg 群

\$ ; p &lt; 0 . 0 5 , 美沙芬 150mg/kg 群

\$ \$ ; p &lt; 0 . 0 1 , 美沙芬 150mg/kg 群

++ ; p &lt; 0 . 0 1 , 美沙芬 300mg/kg 群

其結果，首先發現單獨投與 fudosteин 時並無顯示具有止咳作用。另一方面，單獨投與美沙芬時雖顯示止咳作

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

結



## 五、發明說明 ( 30 )

脂酸鎂，依常法成爲打錠粉末。使用旋轉打錠機打錠該打錠粉末，製成直徑 8.5mm，1 錠爲 250mg 的錠劑。

## 實施例 4

顆粒劑：

使用 120g 的 fudostein、3g 的磷酸二氫 codeine、3.3g 的氯化溶菌酶、7.5g 的馬來酸氯苯吡胺、89.7g 的玉米澱粉及 83.25g 的赤蘚醇，依常法做成顆粒劑。

## 實施例 5

液劑：

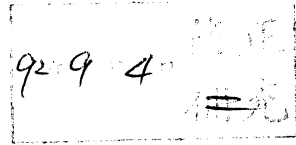
使用 12.8g 的 fudostein、0.2g 的磷酸 codeine、0.3g 的 dl-鹽酸 methylephedrine、0.24 g (力價) 的氯化溶菌酶、48mg 的馬來酸氯苯吡胺、0.24g 的無水咖啡因、60g 的遠志萃取物、60g 的赤蘚醇及 0.4g 的香料溶解於純水中，添加適量的磷酸調整 pH，以純水調製全量爲 240ml 的液劑。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編



四、中文發明摘要(發明之名稱： 使用於增強止咳作用的醫藥配合劑 )

本發明揭示一種醫藥組成物，其特徵為含有 fudosteine 與具有止咳作用之藥劑。該醫藥配合劑為具有優良的止咳去痰作用之感冒藥等醫藥配合劑。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

英文發明摘要(發明之名稱： Having improved antitussive effect drug preparations )

Drug preparations characterized by containing fudosteine and an antitussive. These preparations are drugs to be used for common cold, etc. which have improved antitussive and sputum-removal effects.

訂

線

# 公告本

A8  
B8  
C8  
D8

929x =

## 六、申請專利範圍

第 91111107 號專利申請案

中文申請專利範圍修正本

民國 92 年 9 月 4 日修正

1. 一種使用於增強止咳作用的醫藥配合劑，其特徵為含有 fudosteine 與具有止咳作用之藥劑者。
2. 申請專利範圍第 1 項之醫藥配合劑，其為經口服用藥劑。
3. 申請專利範圍第 1 項或第 2 項之醫藥配合劑，其為止咳化痰藥。
4. 如申請專利範圍第 1 項或第 2 項之醫藥配合劑，其中更配合 1 種或 2 種以上選自支氣管擴張劑、抗組織胺、興奮劑、生物藥、殺菌藥、抗酸劑或黏膜保護劑。
5. 如申請專利範圍第 3 項之醫藥配合劑，其中更配合 1 種或 2 種以上選自支氣管擴張劑、抗組織胺、興奮劑、生物藥、殺菌藥、抗酸劑或黏膜保護劑。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線