



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 101912410 A

(43) 申请公布日 2010. 12. 15

(21) 申请号 201010258444. 7

(22) 申请日 2010. 08. 17

(71) 申请人 南京明生医药技术有限公司

地址 211103 江苏省南京市江宁区东山街道
润麒路 99 号

(72) 发明人 季刚 王殿广 赵萍

(74) 专利代理机构 北京路浩知识产权代理有限公司 11002

代理人 王加岭 张庆敏

(51) Int. Cl.

A61K 31/795(2006. 01)

A61P 15/02(2006. 01)

A61P 15/00(2006. 01)

A61P 31/04(2006. 01)

A61P 31/10(2006. 01)

权利要求书 1 页 说明书 4 页

(54) 发明名称

用于阴道冲洗的药物

(57) 摘要

本发明提供了一种用于阴道冲洗的药物, 其为重量百分浓度 4~8% 的聚甲酚磺醛溶液。本发明还提供了上述药物的应用。本发明的优点在于, 由于人体健康的阴道环境的酸碱度约在 4.0~4.6, 呈弱酸性, 因此本发明药物的 pH 值更接近于阴道内的酸性环境, 能够减少对身体的刺激作用, 并保护阴道的生理环境; 此外, 本发明药物直接用于阴道冲洗, 能够有效抑制多种病原菌、真菌等, 从而对宫颈炎、阴道感染(如细菌、滴虫和霉菌引起的白带增多)或外阴瘙痒等疾病具有良好的治疗效果。

1. 一种用于阴道冲洗的药物,其特征在于,其为重量百分浓度4~8%的聚甲酚磺醛溶液。
2. 根据权利要求1所述的药物,其特征在于,其为重量百分浓度6%的聚甲酚磺醛溶液。
3. 权利要求1或2所述的药物在制备治疗阴道及宫颈疾病的药物中的应用。
4. 根据权利要求3所述的应用,其特征在于,所述宫颈疾病为宫颈炎、阴道感染或外阴瘙痒。

用于阴道冲洗的药物

技术领域

[0001] 本发明涉及一种直接用于阴道冲洗的药物,具体地说,涉及一种直接用于阴道冲洗的聚甲酚磺醛溶液。

背景技术

[0002] 聚甲酚磺醛具有广谱抗菌作用,包括常见的革兰氏阳性菌、革兰氏阴性菌、霉菌和病毒等,其中 *Gardnerella Vaginitis*、厌氧菌、滴虫和念珠菌对其尤为敏感;但 Doderlein Vaginal Flore(阴道乳酸杆菌菌丛)却基本不受影响。其药理作用机制为:通过高酸和蛋白凝固作用杀灭细菌、霉菌和滴虫,选择性地引起坏死或病变组织及柱状上皮蛋白变性,引起血管收缩和血浆蛋白凝固而止血。目前,聚甲酚磺醛尚无引起耐药性的报道。聚甲酚磺醛对坏死或病变组织具有选择性的凝固排除作用,能够促进组织再生和上皮的重新覆盖;健康的鳞状上皮则不受影响,而柱状上皮的胞浆和细胞核却可能在接触本品后发生肿胀,随后几秒钟皱缩。

[0003] 聚甲酚磺醛溶液是目前常用的剂型之一,其为红棕色液体, pH 值小于 1,以间甲酚-6-磺酸二聚体计的浓度为 36%(重量),相对密度为 1.13~1.17。该聚甲酚磺醛溶液用于治疗使用子宫托造成的压迫性溃疡、宫颈息肉切除或切片检查后的止血,尖锐湿疣及加速电凝治疗后的伤口愈合;乳腺炎的预防(乳头皲裂的烧灼);皮肤伤口与病变的局部治疗(如烧伤、肢体溃疡、褥疮、慢性炎症等)能够加速坏死组织的脱落,止血和促进愈合过程及用于尖锐湿疣的治疗;还可用于治疗口腔粘膜和牙龈的炎症、口腔溃疡及扁桃体切除后的止血。

[0004] 但是,上述聚甲酚磺醛溶液的酸性过强,对人体的刺激较大,因此只能用于局部灼烧治疗,而不能直接用于阴道冲洗。

发明内容

[0005] 本发明的目的在于提供一种能够直接用于阴道冲洗的药物。

[0006] 本发明的另一目的在于提供所述药物的应用。

[0007] 为了实现上述目的,本发明的用于阴道冲洗的药物,其为重量百分浓度 4~8%(以间甲酚-6-磺酸二聚体计)的聚甲酚磺醛溶液。优选的是重量百分浓度为 6%(以间甲酚-6-磺酸二聚体计)的聚甲酚磺醛溶液。

[0008] 本发明药物是将 50%的聚甲酚磺醛溶液,加水搅拌,混合均匀,然后经灌装、检验制得;其 pH 约为 1.5~5.0,相对密度为 0.99~1.05。

[0009] 本发明还提供所述用于阴道冲洗的药物在制备治疗阴道及宫颈疾病的药物中的应用。所述阴道及宫颈疾病为宫颈炎、阴道感染(如细菌、滴虫和霉菌引起的白带增多)或外阴瘙痒等。

[0010] 本发明的优点在于,由于人体健康的阴道环境的酸碱度约在 4.0~4.6,呈弱酸性,因此本发明药物的 pH 值更接近于阴道内的酸性环境,能够减少对身体的刺激作用,并

保护阴道的生理环境；此外，本发明药物直接用于阴道冲洗，能够有效抑制多种病原菌、真菌等，从而对宫颈炎、阴道感染（如细菌、滴虫和霉菌引起的白带增多）或外阴瘙痒等疾病具有良好的治疗效果。

具体实施方式

[0011] 以下通过具体实施例来进一步说明本发明，但不用来限制本发明的范围。

[0012] 实施例 1

[0013] 在 120g 浓度为 50%（重量）的聚甲酚磺醛溶液中，加入 880g 蒸馏水，搅拌均匀后灌装，检验。制成浓度为 6% 的聚甲酚磺醛溶液，pH 为 4.6。

[0014] 实施例 2

[0015] 在 80g 浓度为 50%（重量）的聚甲酚磺醛溶液中，加入 920g 蒸馏水，搅拌均匀后灌装，检验。制成浓度为 4% 的聚甲酚磺醛溶液，pH 为 5.0。

[0016] 实施例 3

[0017] 在 160g 浓度为 50%（重量）的聚甲酚磺醛溶液中，加入 840g 蒸馏水，搅拌均匀后灌装，检验。制成浓度为 8% 的聚甲酚磺醛溶液，pH 为 1.5。

[0018] 实施例 4

[0019] 以实施例 1～3 制得的聚甲酚磺醛溶液为样品，分别测定其对多种阴道病原菌的 MIC₉₀，结果如表 1～3 所示。

[0020] 表 1 实施例 1 的聚甲酚磺醛溶液对阴道致病菌的 MIC₉₀

[0021]

阴道的病原菌	实施例 1 的聚甲酚磺醛溶液 MIC ₉₀ (μg/mL)
白色念珠菌	0.5
光滑念珠菌	0.5
热带念珠菌	0.12
克柔念珠菌	0.5
酿酒念珠菌	0.12
近平滑念珠菌	0.12
白假丝酵母菌	0.5
光滑假丝酵母菌	0.12
热带假丝酵母	0.12
克柔假丝酵母菌	0.12
真菌	1.0

[0022] 表 2 实施例 2 的聚甲酚磺醛溶液对阴道致病菌的 MIC₉₀

[0023]

阴道的病原菌	实施例 2 的聚甲酚磺醛溶液 MIC ₉₀ (μg/mL)
白色念珠菌	1.0
光滑念珠菌	2.0
热带念珠菌	0.5
克柔念珠菌	0.5
酿酒念珠菌	0.5
近平滑念珠菌	0.5
白假丝酵母菌	1.0
光滑假丝酵母菌	1.0
热带假丝酵母	0.5
克柔假丝酵母菌	0.5
真菌	4.0

[0024]

[0025] 表 3 实施例 3 的聚甲酚磺醛溶液对阴道致病菌的 MIC₉₀

[0026]

阴道的病原菌	实施例 3 的聚甲酚磺醛溶液 MIC ₉₀ (μg/mL)
白色念珠菌	0.5
光滑念珠菌	0.12
热带念珠菌	0.12
克柔念珠菌	0.5
酿酒念珠菌	0.5
近平滑念珠菌	0.12
白假丝酵母菌	0.5
光滑假丝酵母菌	0.12
热带假丝酵母	0.12
克柔假丝酵母菌	0.12
真菌	1.0

[0027] 从表 1～表 3 可以看出,浓度为 6%、4%及 8%的聚甲酚磺醛溶液均具有良好的抑制阴道病原菌的效果。但是,实施例 1 的浓度为 6%和实施例 3 的浓度为 8%的聚甲酚磺醛溶液相比,其 pH 值更接近人体阴道,对人体的刺激性最小,而且两者的体外抗菌活性相差不大;另外,实施例 1 的浓度为 6%和实施例 2 的浓度为 4%的聚甲酚磺醛溶液相比,体外的抗菌活性更好,综上所述,本发明的用于阴道冲洗的药物最优选的是 6%的聚甲酚磺醛溶液。

[0028] 虽然,上文中已经用一般性说明及具体实施方式,对本发明作了详尽的描述,但在

本发明基础上,可以对之作一些修改或改进,这对本领域技术人员而言是显而易见的。因此,在不偏离本发明精神的基础上所做的这些修改或改进,均属于本发明要求保护的范围。