

Винахід відноситься до медицини і може бути використаним для лікування запальних захворювань горла і слизових оболонок порожнини рота.

Антисептичні пігулки для смоктання (АПС) у вигляді льодяників або пастилок містять одну або декілька діючих антисептичних речовин у подібній до карамелі або карамельній масі. Відомо використання як діючої речовини анатолу і 2,4-діхлорбензалкоголю ("Ангисепт доктора Тайса, Регистр лекарственных средств России", М., "РЛС-2000", 1999, с.935"), рідкого екстракту тим'яна ("Бронхikum пастилки от кашля"; так само, с.992), екстракту шалфею з вітаміном С ("Доктор Тайс-леденцы; так само, с.936), хлоргексидину ("Дрилл боль в горле"; так само, с.980), диклоніна гідрохлориду ("Колдрекс Лари Плюс"; так само, с 1033), 4-діхлорбензоїлового спирту та амілметакрезолу ("Фарингопилс"; так само, с.701).

Недоліком цих препаратів є розвиток алергічних реакцій на хлорорганічний, що в них міститься, та невисока ефективність екстрактів. До того ж, деякі з цих препаратів визивають розлад функції шлунково-кишкового тракту, нудоту, блювання.

Найбільш близьким до заявленого технічного рішення за суттю є смоктальні пігулки "Септолете", які містять (% мас): бензалконій хлорид-0,08; ментол-0,1; м'ятне масло-0,08; евкаліптове масло-0,05; тімол-0,05; карамельна маса-до 100. Недоліком такої якості пігулок є відносно висока токсичність бензалконій хлориду, що призводить до блювання та нудоти при передозуванні добового прийому, а також алергічні реакції людей на цей препарат.

Метою цього винаходу є розширення асортименту АПС, підвищення їх ефективності і нешкідливості.

Поставлена мета досягається тим, що в пігулку (льодяник, пастилку) у вигляді карамельної маси, що містить антисептик, ментол, м'ятне масло та тімол, як антисептик вводять мірамистин при таких співвідношеннях компонентів (% мас):

мірамистин	-0,05-0,10
ментол	-0,08-0,12
м'ятне ефірне масло	-0,064-0,1
евкаліптове ефірне масло	-0,044-0,06
тімол	-0,044-0,06
карамельна маса	-до 100.

З цієї маси формуються пігулки (льодяники, пастилки) масою від 1,0г до 1,5г.

Мірамистин (ФС 42-3498-98) дозволений до застосування у виді 0,01% водного розчину як засіб для профілактики венеричних захворювань, шляхом введення до уретри, вагіни та обробки зовнішніх статевих органів (ВФС 42-2048-91). Він є антисептиком з групи четвертинних аміних сполук (ЧАС) і діє як катіоактивний детергент. Завдяючи емульгійним властивостям, мірамистин деполіаризує мембрани клітинної оболонки мікроорганізмів і підвищує їх проникливість. Оказує бактерицидну дію на грампозитивні та грамнегативні бактерії і фунгіцидну на широкий спектр грибів, а також має віруліцидні властивості щодо складних вірусів: грипу, адено-, герпес-, ВІЛ.

Мірамистин не має подразнюючої дії на слизові оболонки порожнини рота, носоглотки, уретри, вагіни, очеревини, ока, не порушує мукоциліарний транспорт миготливого епітелію дихальних шляхів. У мірамистина виявлена антиалергічна та імуноад'ювантна (посилююча місцеві імунні реакції) дія.

Такий широкий спектр біологічної активності і дуже низької токсичності (LD₅₀ для мишей 1400 мг/кг) підтверджує доцільність застосування мірамистину в заявленій якості. Це також є можливим тому, що мірамистин високостійкий при t 180°C.

Ментол і м'ятне ефірне масло виявляють смаковий і м'який знеболювальний ефект. Тімол дає додатковий антисептичний ефект, а евкаліптове ефірне масло - очищуючу дію, полегшуючи відділення харкотиння.

Антисептичну дію заявленого складу та його варіантів (таб.1) перевіряли загальноприйнятими мікробіологічними методами (серійних розведень, дисків і методом "колодязів") на рідких і щільних поживних середовищах щодо тест-культур грампозитивних (Staphylococcus aureus 209P), грамнегативних (Escherichia coli) і грибів (Candida albicans).

В табл.2 наведені результати проведених досліджень з яких видно, що антисептичні властивості мірамистину в заявленому складі не знижуються. В той же час, вміст мірамистину вище 0,1% змінює смак, тому застосування його у таких концентраціях не доцільне.

Випробовування ефективності заявлених АПС проводили на обмеженому контингенті людей-добровольців (7 чоловік), які мали симптоми запалення слизової порожнини рота - стоматиту, а також фарингіту. Вони смоктали по 1 пігулці (льодянику) через 2-3 години. У всіх, кого випробували, спостерігалось значне покращення стану протягом 1-3 діб. Дві людини (автори-заявники) уживали на добу по 10 пігулок протягом 2 тижнів (14 днів) з метою виявлення побічних явищ, пов'язаних з передозуванням. Жодних неприємних відчуттів або проявів з боку слизової порожнини рота і шлунково-кишкового тракту виявлено не було.

Таким чином, як видно з наведених даних, оптимальним є співвідношення компонентів у межах, що заявлені у формулі винаходу.

Таблица 1

Варианти заявлених антисептических пигулок

Компонент	Номер варианту							
	1	2	3	4	5	6	7	8
Мірамистин	0,01	0,05	0,08	0,1	0,2	0,05	0,1	-
Ментол	0,05	0,08	0,1	0,12	0,15	-	-	0,15
Масло м'яти	0,15	ОД	0,08	0,06	0,2	-	-	0,25

Масло евкаліпту	0,03	0,04	0,05	0,06	0,1	-	-	0,16
Тімол	0,03	0,04	0,05	0,06	0,1	-	-	0,16
Карамельна основа	99,83	99,69	99,64	99,6	99,25	-	-	99,28
Вода	-	-	-	-	-	99,95	99,9	-

Примітка: зразок № 5 не використовували з причини його гіркуватого присмаку

Таблиця 2

Результати вивчення антимікробної активності мірамістину і заявленого складу

Номер зразку	Діаметр пригнічення росту тест-культури (мм)		
	S.aureus	E.coli	C.albicans
1	15,6±1,5	9,6±0,8	16,2±1,2
2	30,0±3,6	19,6±1,8	32,6±3,6
3	32,4±3,4	21,8±1,9	34,2±3,3
4	38,4±3,4	28,4±2,2	36,8±3,4
5	34,6±3,5	23,6±2,2	35,2±3,4
6	20,2±3,4	12,8±1,6	22,6±3,6
7	35,4±3,6	24,3±2,1	34,2±3,3
8	5,5±0,2	3,2±0,1	6,2±0,3

Примітка: розшифровку складу зразка див. табл. 1