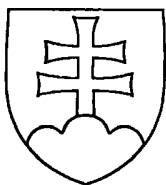


SLOVENSKÁ REPUBLIKA

(19) SK



ÚRAD
PRIEMYSELNÉHO
VLASTNÍCTVA
SLOVENSKEJ REPUBLIKY

ZVEREJNENÁ PRIHLÁŠKA VYNÁLEZU

- (22) Dátum podania: 02.12.94
(31) Číslo prioritnej prihlášky: P 43 41 139.8
(32) Dátum priority: 02.12.93
(33) Krajina priority: DE
(40) Dátum zverejnenia: 05.03.97
(86) Číslo PCT: PCT/EP94/04023, 02.12.94

(21) Číslo dokumentu:

701-96

(13) Druh dokumentu: A3

(51) Int. Cl.⁶ :

A 61K 31/80
A 61K 31/695

(75) Prihlasovateľ a pôvodca vynálezu: Schmidt Alfred, Hamburg, DE;
Upmeyer Hans-Jürgen, München, DE;

(54) Názov prihlášky vynálezu: **Použitie dimeticonu na liečenie áft a zápalov dutiny ústnej**

(57) Anotácia:
Použitie účinnej zložky dimetypolysiloxanu na výrobu farmaceutickej zmesi na liečenie áft a zápalov ústnej dutiny, pričom farmaceutická zmes je vo forme emulzie, ktorá sa aplikuje na postihnutú ústnu sliznicu.

Použitie dimeticonu na liečenie áft a zápalov dutiny ústnej

Oblasť techniky

Vynález sa týka spôsobov liečenia áft a zápalov dutiny ústnej.

Doterajší stav techniky

Afty a stomatitídy sú zápalovými zmenami ústnej sliznice, ktoré sa zjavujú vo forme bolestivých zdurenín edematózných a infiltratívnych ložísk, pokrytých tuhou priľnutou fibrínovou vrstvou, a vredov. Tieto zdurenia sú kruhové a môžu dosiahnuť až veľkosť šošovice alebo fazule. Afty majú mnohoraký pôvod a môžu byť spôsobené infekciami a alergickými reakciami, môžu vyplývať z vnútorných ochorení alebo môžu mať psychosomatický pôvod. K vzniku zápalov sliznice dutiny ústnej môže taktiež viesť potrava, obsahujúca žieravé kyseliny. Tvorenie pľuzgierikov v ústach môžu často spôsobovať tiež lieky, najmä chemoterapeutiká. Ožarovanie môže taktiež spôsobiť aftu. Okrem toho fajčenie môže viesť k tvorbe nikotínovej stomatitídy.

Poranenie sliznice môže byť aj výsledkom sebaoranenia.

Vírusové infekcie môžu byť tiež príčinou ústnych áft. Teda, DNS-vírusy, ako je vírus herpesu simplex, môžu spôsobiť aftóznú stomatitídu, ktorá môže byť opakujúca sa a herpetickú gingivostomatitídu, ktorá má za následok tvorenie pľuzgierov a vredových lézií v dutine ústnej.

Terapia takýchto patologických zmien ústnej sliznice závisí od sily ochorenia a pozostáva z liečenia predpokladaného primárneho ochorenia, obmedzenia činnosti ústnej starostlivosti, potravín alebo stimulujúcich prostriedkov, spôsobujúcich bolesť a lokálneho zmiernenia bolesti farmaceutickými prostriedkami, obsahujúcimi anestetiká, ako sú farmaceutické prostriedky obsahujúce AnesthesinTM. Ďalej sa používajú mierne protizápalové roztoky alebo masti resp. pastilky obsahujúce kortikoidy.

Avšak neprestávajúci výskyt vyvoláva potrebu farmaceutického preparátu, ktorý je schopný ihneď priniesť úľavu od bolesti a tiež rýchlo liečiť aftu a zápal dutiny ústnej a to bez vyvolania možných systémových vedľajších účinkov.

Dimeticon (dimetylpolysiloxan) sa v súčasnej dobe používa na liečenie nadúvania a plynatosti. Okrem toho je známe použitie dimetylpolysiloxanu na liečenie vredových ochorení žalúdka a dvanástorníka a zápalových ochorení pažeráka a dutiny žalúdka. Napríklad WO 90/07930, ktorý je týmto zahrnutý v prihláške ako odkaz, opisuje schopnosť dimetylpolysiloxanu vytvoriť a udržiavať ochranný film na pažeráku, žalúdku a dvanástorníku po ústnom podaní. Výsledkom toho je vyliečenie vyššie spomenutých ochorení.

Podstata vynálezu

Vynález je založený na neočakávanom zistení, že podanie dimeticonu, najmä roztokov obsahujúcich dimeticon, na ústnu sliznicu so zápalom, spôsobeným aftami alebo stomatitídou, vedie k okamžitej úľave bolesti, pričom táto úľava pretrváva 3 až 4 hodiny od aplikácie. Ďalej sa zistilo, že podanie tekutiny s dimeticonom 3x denne spôsobuje rýchle vyliečenie áft. Markantné zlepšenie bolo pozorované už po dvoch dňoch. Okrem toho neboli zistené žiadne nežiaduce vedľajšie účinky. Ďalšou výhodou je to, že dimeticon má neutrálnu chuť a nemá nepriaznivé účinky na chuťové vnemy počas prijímania potravy.

Dimeticon môže byť podávaný podľa vynálezu vo forme tabliet, kapsúl, náplastí, emulzií, suspenzií a práškov na orálne použitie. Je výhodné, ak sa podáva v tekutej forme a môže byť aplikovaný spolu s biologicky prijateľným nosičom, ako je veľmi jemne rozptýlený oxid kremičitý a/alebo emulziou ako je vodná emulzia soli mastnej kyseliny (napr. stearan horečnatý). Takéto zmesi môžu byť podané ľuďom aj zvieratám v množstve bezpečnom a účinnom na dosiahnutie želaného výsledku. K zmesi môžu byť prípadne pridané zvyčajné ochucovadlá (príchute), ako je mäta pieporná alebo mäta kučeravá, vonné substancie alebo sladidlá ako je AspartamTM alebo cyklamát sodný.

Hladina dávky a požiadavky na dávkovanie môžu byť zvolené odborníkmi v odbore na základe dostupných metód a techník. Špecifická dávka a liečebný režim budú závisieť od takých faktorov, ako sú prudkosť a priebeh aftového ochorenia alebo od dispozície k nim.

Príklady uskutočnenia vynálezu

Nasledujúce príklady majú bližšie objasniť predložený vynález a prispieť k jeho porozumeniu. Slúžia len na ilustráciu a nemajú žiadnym spôsobom limitovať rozsah ochrany.

P r í k l a d

Príprava zmesi na liečenie

100 g dimetylpolysiloxanu, 12 g veľmi jemne mletého oxidu kremičitého a 100 g stearanu horečnatého sa roztaví na vodnom kúpeli a mieša sa za vzniku emulzie. Emulzia sa potom rozriedi vodou a pripraví sa tekutý farmaceutický produkt, ktorý samotný môže byť podávaný vo forme kvapiek.

Príklad použitia

Pacient:	muž
Vek:	46
Diagnóza:	erózie ústnej sliznice (afly) potiahnuté belavou fibrinóznou vrstvou
Pôvod:	neznámy; predpokladaná príčina: konzumácia vysokého množstva citrusových plodov
Liečba:	aplikácia tekutiny obsahujúcej dimeticon na afly trikrát denne
Účinkok:	aplikácia tekutiny s obsahom dimeticonu priniesla okamžitú úľavu od bolesti, ktorá pretrvávala 3 až 4 hodiny
Hojenie:	aplikácia tekutiny obsahujúcej dimeticon trikrát denne spôsobila rýchle zahojenie áft a markantné zlepšenie bolo badateľné už po dvoch dňoch. Po ďalších dvoch dňoch erózie boli odstránené
Vedľajšie účinky:	žiadne

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Použitie dimetypolysiloxanu ako účinnej zložky na výrobu farmaceutickej zmesi na liečenie áft a zápalov dutiny ústnej.
2. Použitie podľa nároku 1, vyznačujúce sa tým, že afty, ktoré sa majú liečiť, sú stomatickou aftózou.
3. Použitie podľa nároku 1, vyznačujúce sa tým, že farmaceutická zmes je vo forme emulzie.