



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

254358

(11)

(B1)

(51) Int. Cl.⁴

A 61 K 31/045

(22) Přihlášeno 18 04 85

(21) PV 2862-85

(40) Zveřejněno 14 05 87

(45) Vydáno 15 11 88

(75)
Autor vynálezu

KUBEC FRANTIŠEK RNDr., ŠRAJER RAJMUND RNDr.,
JUCHELKA JIŘÍ ing., OPAVA

(54) Antitusicko-expektorační přípravek

Antitusicko-expektorační přípravek pro použití v humánní medicíně, především v pediatrii. Vynález řeší složení přípravku s antitusickým působením a účinkem expektoračním, kterých se dosáhne kombinací citranu butamirátu, lékořicového extraktu a guaiphenesinu za použití běžných pomocných farmaceutických látek.

Vynález se týká složení nového antitusického přípravku s expektoračním působením. Je ve formě roztoku určeného k užívání v podobě kapek. Dávkování zaručuje kapací vložka. Obsahuje citran butamirátu, extrakt lékořicový, guaiphenesin a farmaceutické pomocné látky.

Ve světě je známý velký počet antitusických resp. expektoračních přípravků, které uvádějí složení a/nebo způsob přípravy a dobře je u nich osvětlen mechanismus účinku.

Jedním z antitusik, které se v současné farmakoterapii používá je přípravek na bázi citranu butamirátu, který ale vykazuje nepatrnou expektorační aktivitu. Z tohoto důvodu je pro některé indikace málo vhodný. Především se jedná o terapii suchého dráždivého, obtížně ztišitelného kašle při virových infekcích horních a dolních dýchacích cest.

Výše uvedené nedostatky a problémy jsou odstraněny tím, že v přípravku podle vynálezu se pracuje s látkami exaktně používanými ve farmacii, a že se vyšlo z jejich precizně definovaných vlastností, což umožňuje s jistotou předpokládat i výsledný efekt přípravku, toto bylo potvrzeno rozsáhlým klinickým zkoušením.

Přípravek obsahuje kombinaci citranu butamirátu 0,05 až 0,5 % hmot., guaiphenesinu 1,0 až 10,0 % hmot., extraktu lékořicového 0,1 až 2 % hmot. a látek zabezpečujících stabilitu chemickou, mikrobiologickou a přijatelnou chuťovou korekci.

Dále je předmět vynálezu objasněn na dvou příkladech, aniž by se na tyto omezoval.

P ř í k l a d č. 1

Citran butamirátu	0,40 % hmot.
Guaiphenesin	10,00 % hmot.
Extrakt lékořicový	0,30 % hmot.
Aroma (alpské květy)	0,20 % hmot.
Polysorbát 80	0,10 % hmot.
Líh 95%	30,00 % hmot.
Voda dest.	0 70 % hmot.
Propylenglykol	do 100,00 % hmot.

P ř í k l a d č. 1 - Způsob přípravy

Do homogenizačního zařízení se nařazuje za obvyčné teploty líh a propylenglykol, postupně se přidává citran butamirátu, guaiphenesin a lékořicový extrakt, poté se přidá předem připravená směs aromátu, polysorbátu a vody. Vše se dokonale zhomogenizuje, zfiltruje a rozplní.

P ř í k l a d č. 2

Citran butamirátu	0,20 % hmot.
Guaiphenesin	5,00 % hmot.
Dihydrochlorid emetinu	0,15 % hmot.
Extrakt lékořicový	0,20 % hmot.
Aroma (kapky proti kašli)	0,25 % hmot.
Polysorbát 20	0,50 % hmot.
Líh 95%	15,00 % hmot.
Glycerin	20,00 % hmot.
Propylenglykol	20,00 % hmot.
Voda dest.	do 100,00 % hmot.

P ř í k l a d č. 2 - Způsob přípravy

Do homogenizačního zařízení se nařazuje za obvyčné teploty, líc, glycerin, polovina množství vody, propylenglykol a postupně se přidává citran butamirátu, guaiphenesin, lékořicový extrakt a dihydrochlorid emetinu. Poté se přidá předem připravená směs aromatu, polysorbátu a druhá polovina vody. Vše se dokonale zhomogenizuje, zfiltruje a rozplní.

Farmakologie přípravku podle vynálezu

Byly vykonány testy akutní toxicity s příznivým výsledkem. Rovněž se provedlo prodloužené podávání přípravku - subakutní toxicita s následným histologickým zkoumáním. I tento test měl příznivý výsledek.

Klinické zkušenosti s přípravkem podle vynálezu

Přípravek byl vyzkoušen na předních klinikách na celkem 241 dětských pacientech a 31 dospělých. Jako srovnávací přípravek byl použit jednodílný "čistě" antitusický preparát s obsahem citranu butamirátu o stejné koncentraci účinné látky. Zkoušeno bylo na souborech pacientů definovaných v zastoupení podle pohlaví na 50 %. Přípravek se aplikoval u následujících nemocí - akutní zánět nosohltanu, akutní zánět hltanu, akutní zánět hrtanu, akutní zánět průdušnice, akutní zánět průdušek, zánět plic a průdušek, hyperreaktivita při zánětu průdušnice a průdušek, chronický zánět průdušek a u dalších nemocí dýchacích cest.

Hodnoceny byly parametry - frekvence kašle, intenzita kašle a odkašlávání. Těžiště při hodnocení parametrů expektorace bylo v klinickém hodnocení ve spojení s anamnézou. Dále byla sledována viskozita sputa a z výsledků vyplývá, že přípravek podle vynálezu má dobrý sekretomotorický a mukokinetický efekt, projevující se velkou a snadnou expektorací. Příznivě byla ovlivněna i plicní ventilace - zlepšení hodnot jejich základních ukazatelů.

Toto se vysvětluje hlenovou očištěnou průduškového stromu a bronchospasmolytickým a aktivitu cílů zvyšujícím účinkem látky éteru guajakolglycerinu. Za hlavní výhodu a přínos je třeba pokládat výborné působení u chřipkového onemocnění, tzn. u virových infekcí dýchacích cest, spojených se suchým kašlem, který působením přípravku podle vynálezu přechází již po krátké době užívání na formu "vlhkou", dochází tedy k expektoraci a dobrému vykašlávání. Přípravek byl všemi pacienty výborně snášen. Nevykazoval žádné vedlejší vedlejší/nežádoucí účinky.

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

Antitusicko-expektorální přípravek ve formě roztoku obsahující kombinaci citranu butamirátu v množství 0,05 až 0,5 % hmot., extraktu lékořicového v množství 0,1 až 0,2 % hmot., aromatu, propandiolu, etanolu, solubilizátoru a vody, vyznačující se tím, že obsahuje guaiphenesin v množství 1 až 10 % hmot.