



PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

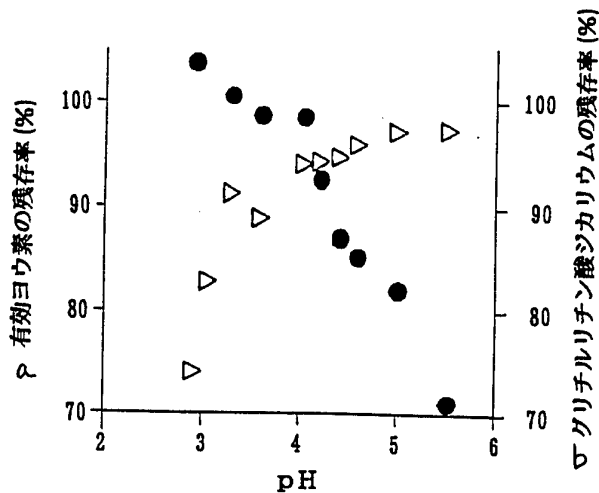
| | | |
|--|-----------|---|
| <p>(51) 国際特許分類6 A61K 33/18, 47/28, 47/32</p> | <p>A1</p> | <p>(11) 国際公開番号 WO96/35434</p> <p>(43) 国際公開日 1996年11月14日(14.11.96)</p> |
| <p>(21) 国際出願番号 PCT/JP96/01175 (22) 国際出願日 1996年4月26日(26.04.96)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平7/109350 1995年5月8日(08.05.95) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 興和株式会社(KOWA CO., LTD.)[JP/JP] 〒460 愛知県名古屋市中区錦三丁目6番29号 Aichi, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および (75) 発明者/出願人 (米国についてののみ) 稲木敏男(INAGI, Toshio)[JP/JP] 〒411 静岡県三島市西若町6-10-203 Shizuoka, (JP) 金箱 眞(KANEBAKO, Makoto)[JP/JP] 〒416 静岡県富士市川成島88-3 Shizuoka, (JP) 新川泰弘(SHINKAWA, Yasuhiro)[JP/JP] 〒417 静岡県富士市中野490-156 Shizuoka, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 有賀三幸, 外(ARUGA, Mitsuyuki et al.) 〒103 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号 共同ビル Tokyo, (JP)</p> | | <p>(81) 指定国 AU, CA, CN, HU, KR, NO, NZ, SG, US, VN, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p> |

(54) Title : LARYNGEAL BACTERICIDAL AND ANTISEPTIC COMPOSITION

(54) 発明の名称 喉用殺菌消毒薬組成物

(57) Abstract

A laryngeal bactericidal and antiseptic composition containing povidone-iodine and dipotassium glycyrrhizinate, being comfortable for use, and having an excellent stability.



● 有効ヨウ素の残存率 (%) ^a

▽ グリチルリチン酸ジカリウムの残存率 (%) ^b

a ... Percentage of residual available iodine (%)

b ... Percentage of residual dipotassium glycyrrhizinate (%)

(57) 要約

本発明は、ポビドンヨード及びグリチルリチン酸ジカリウムを含有する喉用殺菌消毒薬組成物に関する。この組成物は使用感に優れ、しかも安定性が良好である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

| | | | | | | | |
|----|--------------|----|-------------|----|-----------|----|------------|
| AL | アルバニア | DE | ドイツ | LI | リヒテンシュタイン | PL | ポーランド |
| AM | アルメニア | DK | デンマーク | LC | セントルシア | PT | ポルトガル |
| AT | オーストリア | EE | エストニア | LK | スリランカ | RO | ルーマニア |
| AU | オーストラリア | ES | スペイン | LR | リベリア | RU | ロシア連邦 |
| AZ | アゼルバイジャン | FI | フィンランド | LS | レソト | SE | スウェーデン |
| BA | ボスニア・ヘルツェゴビナ | FR | フランス | LT | リトアニア | SG | シンガポール |
| BB | バルバドス | GA | ガボン | LU | ルクセンブルグ | SI | スロヴェニア |
| BE | ベルギー | GB | イギリス | LV | ラトヴィア | SK | スロヴァキア |
| BF | ブルキナ・ファソ | GE | グルジア | MC | モナコ | SZ | スワジランド |
| BG | ブルガリア | GN | ギニア | MD | モルドヴァ共和国 | TD | チュニジア |
| BJ | ベナン | GR | ギリシャ | MG | マダガスカル | TG | トーゴ |
| BR | ブラジル | HU | ハンガリー | MK | マケドニア共和国 | TJ | タジキスタン |
| BY | ベラルーシ | IE | アイルランド | ML | マリ | TM | トルクメニスタン |
| CA | カナダ | IL | イスラエル | MN | モンゴル | TR | トルコ |
| CC | 中央アフリカ共和国 | IS | アイスランド | MR | モリタニア | TT | トリニダード・トバゴ |
| CG | コンゴ | IT | イタリア | MW | マラウイ | UA | ウクライナ |
| CH | スイス | JP | 日本 | MX | メキシコ | UG | ウガンダ |
| CI | コート・ジボアール | KE | ケニア | NE | ニジェール | US | アメリカ合衆国 |
| CM | カメルーン | KG | キルギスタン | NL | オランダ | UZ | ウズベキスタン |
| CN | 中国 | KP | 朝鮮民主主義人民共和国 | NO | ノルウェー | VN | ベトナム |
| CU | キューバ | KR | 大韓民国 | NZ | ニュージーランド | | |
| CZ | チェコ共和国 | KZ | カザフスタン | | | | |

明 細 書

喉用殺菌消毒薬組成物

技術分野

本発明は、甘味を有し、刺激及び灼熱感が改善され、使用感に優れ、しかも成分の安定性が良好な喉用殺菌消毒薬組成物に関する。

背景技術

ポビドンヨードを有効成分とする喉用殺菌消毒薬としては、希釈水溶液としてのうがい薬や、ルゴール液のように直接喉に塗布する製剤の他、近年上市された、簡易噴霧型あるいは吐出型容器により、喉に直接付着させる液剤が知られている。

しかしながら、これらの喉用殺菌消毒薬は、辛味、刺激感、灼熱感などがあるため、幼児、子供、老人などが使用する場合には、むせたり、せき込んだり、吐き出したりしてしまうことが多く、目的とする効果が十分に得られないという問題があった。

このような問題の原因としては、ポビドンヨード自体の問題として、ポビドンヨード中の有効ヨウ素による搔痒感、灼熱感などの副作用の他、製剤中に含まれる揮発性物質の量、基剤成分による刺激などが考えられている。

ポビドンヨード自体の問題は、製剤設計上において解決しなければならないが、有効ヨウ素の性質、安定性などの点から配合成分が制限されていた。

例えば、ポビドンヨード製剤の刺激をマスクするために、製剤学上一般的に用いられている成分、例えば甘味料としてショ糖、果糖、ブドウ糖、乳糖、麦芽糖などの糖類を配合すると、両成分が相対的に分解してしまう。また、香料を配合する場合には、多量に配合しないと効果が得られないが、これらを多量に配合すると、溶解性、味、使用感などの点で問題が生じてくる。

従って、本発明の目的は、使用感に優れ、しかもポビドンヨードが安定な喉用殺菌消毒薬組成物を提供することにある。

発明の開示

かかる実情において、本発明者らはカンゾウエキスの甘味と矯味作用に注目し、各種エキス類、抽出成分、その他塩類について、ポビドンヨード溶液中への配合の可能性を検討した結果、ポビドンヨードとグリチルリチン酸ジカリウムを組合わせて用いれば、ポビドンヨードの殺菌作用に影響することがなく、使用感に優れ、しかも安定な喉用殺菌消毒薬が得られることを見出し、本発明を完成した。

また、カンゾウエキス類については、使用感の改善効果はあるものの、有効ヨウ素の活性を低下させてしまうため殺菌作用が得られなくなることから、配合は困難であった。グリチルリチン酸、グリチルリチン酸モノアンモニウム、グリチルリチン酸モノカリウム、グリチルレチン酸、グリチルレチン酸ステアシル及びステアリン酸グリチルレチニルについては、溶解量が少なく使用感を改善する目的が達成できなかったことから、配合は困難であった。更に、3-サクシニルオキシグリチルレチン酸二ナトリウムについては、有効ヨウ素の活性を低下させるため殺菌作用が得られなくなることから、配合は困難であった。

すなわち、本発明は、ポビドンヨード及びグリチルリチン酸ジカリウムを含有することを特徴とする喉用殺菌消毒薬組成物を提供するものである。

図面の簡単な説明

図1は、有効ヨウ素及びグリチルリチン酸ジカリウムの安定性に対するpHの影響を示す図である。

発明を実施するための最良の形態

本発明の喉用殺菌消毒薬組成物において、ポビドンヨードは全組成中に0.05～1重量/容量%、特に0.3～0.6重量/容量%配合するのが好ましい。

また、グリチルリチン酸ジカリウムは、全組成中に0.05～1重量/容量%、特に0.2～0.4重量/容量%配合するのが好ましく、この範囲内であると、甘味があり、使用感がより優れたものが得られる。

なお、グリチルリチン酸ジカリウムとしては、日本薬局方外規準又は化粧品原料基準に記載されているものを使用することができる。

本発明の喉用殺菌消毒薬組成物は、基剤成分（溶剤）にポビドンヨード及びグリチルリチン酸ジカリウムを溶解することにより製造される。ここで用いられる基剤成分（溶剤）としては、例えば水、エタノール、プロピレングリコール、グリセリン等が挙げられ、これらの1種又は2種以上を組合わせて用いることができる。

また、本発明の喉用殺菌消毒薬組成物には、前記必須成分の他、例えばウイキョウ油、スペアミント油、*d l*-カンフル、*l*-メントール、ケイヒ油、ハッカ油、バニリン、ストロベリーエキス等の着香剤、香料；塩化リゾチーム、アラントイン、トラネキサム酸等の抗炎症剤に代表される活性成分などを、本発明の効果を損わない範囲で適宜配合することができる。また、ヨウ化カリウムに代表されるヨウ化アルカリ金属を溶解補助剤として配合することができる。

更に、本発明の喉用殺菌消毒薬は、pHが3～5、特にpH3.5～4.5であると、ポビドンヨード及びグリチルリチン酸ジカリウムの安定性がともに、より高くなり好ましい。ここで、pHを調整するのに用いられるpH調整剤としては、例えば塩酸、ホウ酸、リン酸などの無機酸、酢酸、乳酸、クエン酸などの有機酸、アスコルビン酸、クエン酸二ナトリウム、リン酸二水素カリウム、アミノ酢酸などの緩衝剤が挙げられる。これらのpH調整剤は、所望のpHにするのに必要な量を添加すればよい。

本発明の喉用殺菌消毒薬組成物は、例えばエタノール及び水の混液等の溶剤にポビドンヨード及びグリチルリチン酸ジカリウムを溶解し、濃グリセリン等の他の溶剤を加えて攪拌し、pH調整剤でpHを3～5に調整することにより製造するのが好ましい。

実施例

次に、実施例を挙げて本発明を更に説明するが、本発明はこれら実施例に限定されるものではない。

実施例1

表1に示す組成の喉用殺菌消毒薬を製造し、味覚による官能試験を行った。結果を表2に示す。

(製法)

エタノール及び精製水の混合液にポビドンヨード、グリチルリチン酸ジカリウム、ヨウ化カリウム及び ℓ -メントールを溶解し、濃グリセリン及び塩酸を加えて攪拌し、精製水で100mlとした。

(官能試験方法)

各殺菌消毒薬を簡易噴霧型容器(25ml)に充填し、7名のパネラーが喉に2回直射したときの味覚を、「不快な辛味がある」、「辛味がある」、「やや辛味がある」、「やや甘味がある」、「甘味がある」及び「不快な甘味がある」のいずれかで評価し、結果をその人数で示した。

表 1

| 成分 | 本 発 明 品 | | | | 比較品 |
|-------------------|---------|--------|--------|--------|--------|
| | 1 | 2 | 3 | 4 | |
| ポビドンヨード | 0.45g | 0.45g | 0.45g | 0.45g | 0.45g |
| グリチルリチン酸 ジカリウム | 0.05g | 0.2g | 0.5g | 1.0g | - |
| ヨウ化カリウム | 1.0g | 1.0g | 1.0g | 1.0g | 1.0g |
| ℓ -メントール | 0.3g | 0.3g | 0.3g | 0.3g | 0.3g |
| 濃グリセリン | 80.0g | 80.0g | 80.0g | 80.0g | 80.0g |
| エタノール | 15.0g | 15.0g | 15.0g | 15.0g | 15.0g |
| 塩酸 | 適量* | 適量* | 適量* | 適量* | 適量* |
| 精製水 | 全100ml | 全100ml | 全100ml | 全100ml | 全100ml |

*:pH4になる量

表 2

| 回答(人) | 本 発 明 品 | | | | 比較品 |
|----------|---------|---|---|---|-----|
| | 1 | 2 | 3 | 4 | |
| 不快な辛味がある | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
| 辛味がある | 0 | 0 | 0 | 0 | 4 |
| やや辛味がある | 1 | 0 | 0 | 0 | 2 |
| やや甘味がある | 3 | 1 | 1 | 0 | 0 |
| 甘味がある | 3 | 6 | 6 | 6 | 0 |
| 不快な甘味がある | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 |

表2の結果から明らかなように、グリチルリチン酸ジカリウムを配合しない比較品では、辛味があり、使用感が悪かったのに対し、グリチルリチン酸ジカリウムを0.05～1.0重量/容量%配合した本発明品では、いずれも甘味があり、優れた使用感を示した。

実施例2

表3に示す組成の喉用殺菌消毒薬を実施例1と同様にして、pH2～6に調整して製造した。これを、60℃で1週間保存したときの、pHによる有効ヨウ素及びグリチルリチン酸ジカリウムの安定性に対する影響を調べた。結果を残存率で図1に示す。

表 3

| 成 分 | 本 発 明 品 | |
|---------------|---------|--------|
| | 5 | 6 |
| ポビドンヨード | 0.2g | 0.2g |
| グリチルリチン酸ジカリウム | 0.2g | 0.2g |
| ヨウ化カリウム | 1.0g | 1.0g |
| ℓ-メントール | 0.3g | 0.3g |
| 濃グリセリン | 80.0g | 80.0g |
| エタノール | 15.0g | 15.0g |
| pH調整剤 | 塩酸 | クエン酸 |
| 精製水 | 全100ml | 全100ml |

図1の結果から明らかなように、本発明の喉用殺菌消毒薬は、pH3～5の範囲において、有効ヨウ素の安定性はpHがアルカリ側に傾くにつれて悪くなるが、グリチルリチン酸ジカリウムの安定性はpHが酸性側に傾くにつれて悪くなり、両成分は相反する安定性の挙動を示したが、この範囲であれば、十分な安定性が得られる。

実施例3

表4に示す組成の喉用殺菌消毒薬を実施例1と同様にして製造し、実施例1と同様に味覚による官能試験を行った。結果を表5に示す。

表 4

| 成 分 | 本 発 明 品 | | | |
|---------------|---------|--------|--------|--------|
| | 7 | 8 | 9 | 10 |
| ポビドンヨード | 0.05g | 0.1g | 0.7g | 1.0g |
| グリチルリチン酸ジカリウム | 0.2g | 0.2g | 0.2g | 0.2g |
| ヨウ化カリウム | 1.0g | 1.0g | 1.0g | 1.0g |
| メントール | 0.3g | 0.3g | 0.3g | 0.3g |
| 濃グリセリン | 80.0g | 80.0g | 80.0g | 80.0g |
| エタノール | 15.0g | 15.0g | 15.0g | 15.0g |
| 塩酸 | 適量* | 適量* | 適量* | 適量* |
| 精製水 | 全100ml | 全100ml | 全100ml | 全100ml |

*:pH4になる量

表 5

| 回 答 (人) | 本 発 明 品 | | | |
|----------|---------|---|---|----|
| | 7 | 8 | 9 | 10 |
| 不快な辛味がある | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 辛味がある | 0 | 0 | 0 | 0 |
| やや辛味がある | 0 | 0 | 0 | 0 |
| やや甘味がある | 0 | 1 | 0 | 2 |
| 甘味がある | 7 | 6 | 7 | 5 |
| 不快な甘味がある | 0 | 0 | 0 | 0 |

表5の結果から明らかなように、本発明品はいずれも甘味があり、使用感に優れたものであり、また、安定性にも優れたものであった。

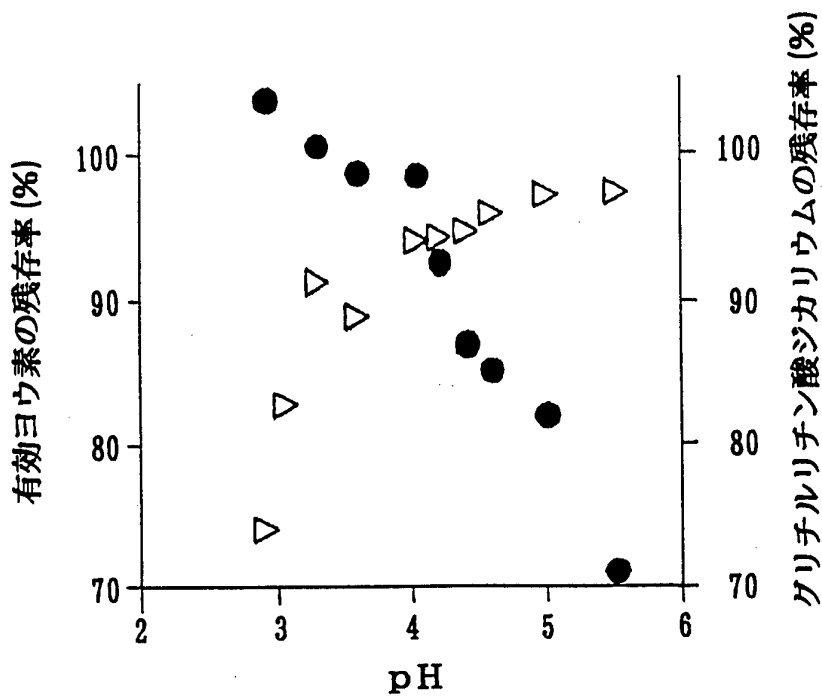
産業上の利用分野

本発明の喉用殺菌消毒薬組成物は、甘味を有し、刺激及び灼熱感が改善され、使用感に優れるとともに、成分の安定性も良好なものである。

請 求 の 範 囲

1. ポビドンヨード及びグリチルリチン酸ジカリウムを含有することを特徴とする喉用殺菌消毒薬組成物。
2. ポビドンヨードを0.05～1重量/容量%、グリチルリチン酸ジカリウムを0.05～1重量/容量%含有する請求項1記載の喉用殺菌消毒薬組成物。
3. pHが3～5である請求項1又は2記載の喉用殺菌消毒薬組成物。
4. 更に溶剤を含有するものである請求項1～3のいずれか1項記載の喉用殺菌消毒薬組成物。
5. 溶剤が、水、エタノール、プロピレングリコール及びグリセリンから選ばれる1種又は2種以上である請求項4記載の喉用殺菌消毒薬組成物。
6. 更に、溶解補助剤、着香剤、香料及び抗炎症剤から選ばれる成分を含有するものである請求項1～5のいずれか1項記載の喉用殺菌消毒薬組成物。

図 1



- 有効ヨウ素の残存率 (%)
- ▷ グリチルリチン酸ジカリウムの残存率 (%)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP96/01175

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁶ A63K33/18, 47/28, 47/32

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁶ A61K33/18, 47/28, 47/32

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| A | JP, 58-152808, A (Kyushin Seiyaku Co., Ltd.), September 10, 1983 (10. 09. 83) (Family: none) | 1 - 6 |
| A | JP, 6-172192, A (Kenya Otsuka and another), June 21, 1994 (21. 06. 94) (Family: none) | 1 - 6 |
| A | JP, 7-330619, A (Kobayashi Pharmaceutical Co., Ltd. and another), December 19, 1995 (19. 12. 95) (Family: none) | 1 - 6 |

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

July 18, 1996 (18. 07. 96)

Date of mailing of the international search report

July 30, 1996 (30. 07. 96)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))
 Int.Cl.⁶ A61K33/18, 47/28, 47/32

B. 調査を行った分野
 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))
 Int.Cl.⁶ A61K33/18, 47/28, 47/32

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの


国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

| C. 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------|---|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| A | JP, 58-152808, A, (救心製薬株式会社) 10. 9月. 1983 (10. 09. 83) (ファミリーなし) | 1-6 |
| A | JP, 6-172192, A, (大塚賢哉, 他) 21. 6月. 1994 (21. 06. 94) (ファミリーなし) | 1-6 |
| A | JP, 7-330619, A, (小林製薬株式会社, 他) 19. 12月. 1995 (19. 12. 95) (ファミリーなし) | 1-6 |

C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

| | |
|---|---|
| <p>* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願</p> | <p>の日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献</p> |
|---|---|

| | |
|--------------------------|------------------------|
| 国際調査を完了した日 18. 07. 96 | 国際調査報告の発送日 30.07.96 |
|--------------------------|------------------------|

| | | |
|---|--|---------|
| 国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | 特許庁審査官 (権限のある職員) 松浦新司  | 4C 8314 |
| | 電話番号 03-3581-1101 内線 3452 | |