

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl<sup>7</sup>

A61K 31/11

A61K 9/02

A61P 13/08 A61P 1/10

# [12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 97105968.3

[45]授权公告日 2002年1月30日

[11]授权公告号 CN 1078462C

[22]申请日 1997.7.9 [24]颁证日 2002.1.30

[21]申请号 97105968.3

[73]专利权人 辛国芳

地址 255036 山东省淄博市中心医院 B 超室

[72]发明人 辛国芳 王 强

[56]参考文献

哈尔滨医科大学学报 21(5) 1987. 1. 1 侯国平等醋酸棉酚栓生物利用度测定

哈尔滨医药, 5(3) 1985. 1. 1 李长春等棉酚栓剂抗生育作用的研究

上海医科大学学报, 21(1) 1994. 1. 1 袁涛等面酚对体外人肥大前列腺成纤维细胞的作用

审查员 李人久

[74]专利代理机构 淄博科信专利代理有限公司

代理人 耿 霞

权利要求书 1 页 说明书 3 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 棉酚和/或其衍生物作为有效成分在制备用于治疗前列腺炎的栓剂中的应用

[57]摘要

棉酚和/或其衍生物作为有效成分在制备用于治疗前列腺炎的栓剂中的应用。

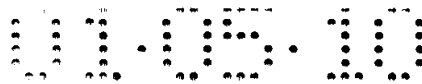
I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

01.05.10

## 权 利 要 求 书

---

- 1、棉酚和/或其衍生物作为有效成分在制备用于治疗前列腺炎的栓剂中的应用。



# 说明书

棉酚和/或其衍生物作为有效成分在制备用于治疗前列腺炎的栓剂中的应用

本发明属于药物领域,特别涉及一种以棉酚及其衍生物为有效成分的药的新剂型和新用途。

棉酚或其衍生物如醋酸棉酚、甲酸棉酚是一种具有广泛药理作用的药物,20多年来,国内外医药工作者对其进行了大量的基础与临床应用研究,认为棉酚或其衍生物除了有确切的干扰男性生精功能,抑制生育作用之外,还有治疗气管炎、子宫肌瘤、子宫内膜异位症、功能性子宫出血、副睾郁积症、抗癌等作用,这在1983年版由北京人民卫生出版社王浴生等著《中药药理与应用》第1126--1131页有记载,但这些作用并未在临床上广泛应用,因此有必要进一步开发利用。

既往临床主要以口服棉酚片剂为主进行治疗。因多需长期大量应用,副作用大,有可能产生低血钾等副作用,而且以片剂治疗不适合局部病症的治疗。

本发明的目的是以棉酚和/或其衍生物作为有效成分在制备用于治疗前列腺炎的栓剂中的应用,疗效好、减少副作用。

本发明的技术方案实现了发明目的,棉酚和/或其衍生物作为有效成分在制备用于治疗前列腺炎的栓剂中的应用。

以棉酚或(和)其衍生物为有效成分的药的用途可以作为治疗前列腺炎、前列腺增生、习惯性便秘的药。

根据临床需要的不同,每枚栓剂中可以含不同剂量的有效成分,为5--100mg,直肠及毗邻脏器病症的治疗,剂量可小,远处脏器病变的治疗,剂量可大。药栓的基质可以是油性基质如:可可豆脂等,也可以是水溶性基质,如:聚乙二醇类。亦根据不同需要选用,用油性基质时,棉酚释较慢,可用于直肠及其毗邻脏器病变;用水溶性基质时,棉酚释出较快,可用于远处脏器病变的治疗。基质的用量同常规栓剂制作用量,一般为2克左右。

栓剂的制作方法同常规方法,将药栓基质加热至其熔点,将所需量的棉酚加入溶化的

基质搅匀后注入药栓模具(栓剂形状可如子弹头形),待冷却固化后取出,包装,保存在 35 以下备用。

本发明制成栓剂后,除仍具有已公开的干扰男性生精功能,抑制生育作用,治疗气管炎、子宫肌瘤、子宫内膜异位症、功能性子宫出血、副睾郁积症、抗癌等作用功能外,对于治疗前列腺炎、前列腺增生、习惯性便秘亦有较好的疗效。象前列腺增生,目前多是激素类药,副作用大,价格昂贵。前列腺炎,一般用抗菌素,疗效不理想。而用本发明不但疗效好而且成本低,副作用小。

药栓进入直肠后,基质在体温温度溶化,有效成分释出,通过直肠中、下静脉及肛管静脉吸收,吸收速度快而且不经过肝脏直接进入大循环,可防止或减少药物在肝脏中降解和对肝脏的毒性作用,从而大大提高药物的生物利用度。另外由于其吸收不经过胃、小肠,完全避免了胃肠消化液对药物的影响,直肠给药对于直肠及其毗邻脏器病变的治疗更有直接渗透作用。栓剂能使棉酚等有效成分的用量(总量)达到最小,而疗效达到最佳。

我们用可可豆脂为药栓基质,制备了每枚含醋酸棉酚 5mg 的棉酚栓,栓形为子弹头形,每枚约 2 克。患者每晚一次一枚塞入肛门内使用,应用前后观察记录临床症状及 B 超检查,连用三个月为一疗程,统计疗效。结果:子宫肌瘤 30 例中,治愈 11 例,好转 12 例,无效 7 例;子宫肌腺病 30 例,治愈 3 例,好转 25 例,无效 2 例;子宫功能性出血 30 例,治愈 15 例,好转 9 例,无效 6 例;前列腺炎 100 例,治愈 43 例,好转 32 例,无效 25 例;前列腺增生症 100 例,治愈 38 例,好转 45 例,无效 17 例;习惯性便秘 100 例,治愈 68 例,好转 21 例,无效 11 例。使用中均未发现明显毒副作用,无血钾降低。

上述作为治疗前列腺炎、前列腺增生、习惯性便秘的诊断标准和疗效标准如下:

#### 一、前列腺炎:

诊断标准:1、有会阴部胀痛或不适,尿道口有分泌物,尿频、腰酸、性功能减退等症之三项以上;

2、前列腺液检查:白细胞数大于 10 个/HP;

3、前列腺液培养细菌阳性。

疗效标准:1、治愈:临床症状完全或大部消失,前列腺液常规检查白细胞数少于 10 个/HP;细菌培养阴性;

2、好转:临床症状明显减轻,前列腺液检查白细胞数明显减少,细菌培养转阴;

3、无效:症状无明显改善,前列腺液白细胞无变化或细胞培养仍阳性。

## 二、前列腺增生:

诊断标准:1、有排尿困难,尿频,夜尿次数多,尿潴留等症状之三项以上;

2、经腹或直肠 B 超检查,排除前列腺癌等恶性病变后,测量前列腺的左右径及前后径,根据 Terris 氏公式计算,前列腺重量(克) $>33$  克

疗效标准:1、治愈:临床症状完全或大部消失,B 超检查并计算前列腺重量接近或小于 33 克;

2、好转:临床症状明显减轻,B 超检查并计算前列腺重量减少 10%;

3、无效:临床症状无明显改善,B 超检查并计算前列腺重量减少少于 10%。

## 三、习惯性便秘:

诊断标准:大便干结,有时粪便可呈球形,甚则排便困难,两天以上排便一次;排除肠道器质性病变所致便秘。

疗效标准:1、治愈:大便变软或变稀,每日排便 1 ~ 2 次,随访半年无复发;

2、好转:大便变软或变稀,每日排便 1 ~ 2 次,停药后有复发;

3、无效:仍大便干结,两天以上排便一次。