



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 102670675 B

(45) 授权公告日 2014. 04. 16

(21) 申请号 201210191204. 9

(22) 申请日 2012. 06. 11

(73) 专利权人 广东岭南职业技术学院

地址 510663 广东省广州市天河区大观中路  
492 号

(72) 发明人 何刚 陈辉芳

(74) 专利代理机构 广州市华学知识产权代理有  
限公司 44245

代理人 黄磊

(51) Int. Cl.

A61K 36/185(2006. 01)

A61P 17/00(2006. 01)

A61P 31/10(2006. 01)

A61K 31/4412(2006. 01)

A61K 127/00(2006. 01)

(56) 对比文件

黑毅. 环吡司胺. 《简明新药手

册》. 2002, 742.

石靖等. 6 种绿化植物挥发性有机物抑菌效  
果研究. 《安徽农业科学》. 2011, 第 39 卷 (第 23  
期), 13929-13930, 13937.

审查员 陈蕾

权利要求书1页 说明书4页

(54) 发明名称

一种治疗脚气的搽剂及其制备方法

(57) 摘要

本发明公开了一种治疗脚气的搽剂及其制备方法, 该搽剂含有法国梧桐树叶提取物和环吡司胺, 两者的质量比为 (5-10):1; 所述的法国梧桐树叶提取物是法国梧桐树叶的醇提浸膏, 由以下步骤制备得到: 将法国梧桐树叶用乙醇溶液浸渍 5-10 天, 然后过滤, 将滤液浓缩至浸膏, 得到法国梧桐树叶的醇提浸膏。本发明将法国梧桐树叶提取物与环吡司胺配伍使用, 使该搽剂的抗癣菌的抗菌谱增大, 抗菌作用增强, 且治愈后的脚气病不易复发。本发明的搽剂无异味, 气味清香宜人; 其作用温和、对皮肤无任何刺激性。

1. 一种治疗脚气的搽剂,其特征在于:活性成分为法国梧桐树叶提取物和环吡司胺,两者的质量比为(5-10):1;

所述的法国梧桐树叶提取物是法国梧桐树叶的醇提浸膏,由以下步骤制备得到:将法国梧桐树叶用50%乙醇溶液浸渍5-10天,然后过滤,将滤液浓缩至浸膏,得到法国梧桐树叶的醇提浸膏。

2. 根据权利要求1所述的治疗脚气的搽剂,其特征在于:所述的法国梧桐树叶提取物与环吡司胺的质量比为8:1。

3. 根据权利要求1所述的治疗脚气的搽剂,其特征在于:所述治疗脚气的搽剂中还含有聚乙二醇和乙醇。

4. 根据权利要求3所述的治疗脚气的搽剂,其特征在于:所述的乙醇是体积比为50%的乙醇水溶液。

5. 权利要求1-4任一项所述的治疗脚气的搽剂的制备方法,其特征在于包括以下步骤:

取法国梧桐树叶提取物,用乙醇溶解后备用;取环吡司胺用乙醇溶解后加入到法国梧桐树叶提取物的乙醇溶液中,再加入聚乙二醇和乙醇,搅匀,即得。

## 一种治疗脚气的搽剂及其制备方法

### 技术领域

[0001] 本发明涉及一种治疗脚气的搽剂及其制备方法。

### 背景技术

[0002] 脚气是一种很常见的真菌感染性皮肤病,俗称脚癣。我国平均发病率近 30%,在一些高发地区如南方和东部沿海地区,发病率甚至高达 60%。在一些特殊职业(如矿工等)发病率可达 80-100%。

[0003] 脚气的危害不可忽视,它既影响日常生活又影响个人形象,而且易传染到身体的其他部位,严重时可引起继发性感染。

[0004] 由于脚气在我国发病率很高,治疗脚气的药品的潜在市场容量很大。现有的脚气药产品很多,其中比较有名的产品有:达克宁、兰美抒、金达克宁、孚琪、玛奇卡珊瑚癣净、必伏、三九选灵等等。

[0005] 目前的脚气药产品都具有一定的抗癣菌作用,但治愈后的脚气易复发;有的产品对皮肤还具有一定的刺激性;有的产品成本较高,零售价较贵;有的产品气味不好闻。

### 发明内容

[0006] 为了克服现有技术的缺点与不足,本发明的首要目的在于提供一种治疗脚气的搽剂。

[0007] 本发明的另一目的在于提供上述治疗脚气的搽剂的制备方法。

[0008] 本发明的目的通过下述技术方案实现:

[0009] 一种治疗脚气的搽剂,含有法国梧桐(Londinensi planum ligna)树叶提取物和环吡司胺,两者的质量比为(5-10):1,优选 8:1;

[0010] 所述的法国梧桐树叶提取物是法国梧桐树叶的醇提浸膏,由以下步骤制备得到:将法国梧桐树叶用乙醇溶液浸渍 5-10 天,然后过滤,将滤液浓缩至干浸膏,得到法国梧桐树叶的醇提浸膏;

[0011] 所述治疗脚气的搽剂中还含有聚乙二醇和乙醇;此处的聚乙二醇仅起到增溶剂和分散剂的作用,乙醇则是溶剂;

[0012] 所述的乙醇优选体积比为 50% 的乙醇水溶液。

[0013] 上述的治疗脚气的搽剂的制备方法,包括以下步骤:

[0014] 取法国梧桐树叶提取物,用适量乙醇溶解后备用;取环吡司胺用适量乙醇溶解后加入到法国梧桐树叶提取物的乙醇溶液中,再加入适量聚乙二醇和乙醇,搅匀,得到法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂。

[0015] 法国梧桐属于落叶乔木,属金缕梅目、悬铃木科、悬铃木属。民间用其树叶的水提取液治疗脚气(香港脚)有较好的疗效。有资料证明,法国梧桐树叶的醇浸渍液对红色毛癣菌、须癣毛癣菌等多种癣菌有较好的抑制和灭杀作用。

[0016] 环吡司胺是一种抗癣菌的化学原料药物,主要用于抗表皮癣菌、白色念珠菌、新型

隐球菌、毛发癣菌等真菌。

[0017] 法国梧桐树叶醇提液的抗菌谱和环吡司胺的抗菌谱不一样,两者合用具有协同作用能使抗癣菌的抗菌谱扩大、抗菌作用增强,有利于彻底治愈脚气。

[0018] 本发明的搽剂相对于现有技术具有如下的优点及效果:

[0019] 1、本发明的治疗脚气的搽剂无异味,气味清香宜人;其作用温和、对皮肤无任何刺激性。

[0020] 2、本发明将法国梧桐树叶提取物与环吡司胺配伍使用,使该搽剂的抗癣菌的抗菌谱增大,抗菌作用增强,且治愈后的脚气病不易复发。

[0021] 3、法国梧桐树叶秋末落得遍地都是,只要人工收集就能有丰富的原料。因此本发明的搽剂是变废为宝,生产成本极低。

### 具体实施方式

[0022] 下面结合实施例对本发明作进一步详细的描述,但本发明的实施方式不限于此。

[0023] 实施例 1

[0024] 一种治疗脚气的搽剂,由以下步骤制备得到:

[0025] (1)取 300g 法国梧桐树叶,洗净、晾干、粉碎,然后用 50% 的乙醇水溶液 5000ml 浸渍 7 天,然后过滤,将滤液浓缩至浸膏,得到 80g 干浸膏,即为法国梧桐树叶的醇提浸膏;

[0026] (2)取法国梧桐树叶的醇提浸膏 80g,用适量 50% 的乙醇水溶液溶解后备用;取 10g 环吡司胺,用适量的 50% 的乙醇水溶液溶解后加入到到法国梧桐树叶的醇提浸膏的乙醇溶液中,再加入 200ml 聚乙二醇,用 50% 的乙醇水溶液定容至 1000ml,搅匀,得到法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂。

[0027] 实施例 2

[0028] 一种治疗脚气的搽剂,由以下步骤制备得到:

[0029] (1)法国梧桐树叶的醇提浸膏的制备方法同实施例 1 步骤(1);

[0030] (2)取法国梧桐树叶的醇提浸膏 50g,用适量 50% 的乙醇水溶液溶解后备用;取 10g 环吡司胺,用适量的 50% 的乙醇水溶液溶解后加入到到法国梧桐树叶的醇提浸膏的乙醇溶液中,再加入 200ml 聚乙二醇,用 50% 的乙醇水溶液定容至 1000ml,搅匀,得到法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂。

[0031] 实施例 3

[0032] 一种治疗脚气的搽剂,由以下步骤制备得到:

[0033] (1)法国梧桐树叶的醇提浸膏的制备方法同实施例 1 步骤(1);

[0034] (2)取法国梧桐树叶的醇提浸膏 100g,用适量 50% 的乙醇水溶液溶解后备用;取 10g 环吡司胺,用适量的 50% 的乙醇水溶液溶解后加入到到法国梧桐树叶的醇提浸膏的乙醇溶液中,再加入 200ml 聚乙二醇,用 50% 的乙醇水溶液定容至 1000ml,搅匀,得到法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂。

[0035] 法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂的体外抗癣菌试验

[0036] 1、体外抗癣菌试验(包括液体和固体连续稀释法)

[0037] (1)体外抑菌试验

[0038] 取灭菌后的小试管若干支,用沙氏培养基稀释实施例 1 得到的搽剂,使其最终浓

度(以法国梧桐树叶的醇提浸膏和环吡司胺的总浓度计)为分别为 :80、40、20、10、5、2.5、1、0.5、0.25、0mg/ml。每管加入  $5 \times 10^2$  个真菌 /ml 菌液 0.1ml,置于 28℃ 培养箱内培养 7d,观察有无癣菌生长,以无癣菌生长的最高搽剂稀释倍数为该搽剂的最低抑菌浓度(MIC)。

[0039] 同上法稀释搽剂,制备搽剂浓度梯度平板,待琼脂凝固后,用接种环取菌接种于搽剂平板上,置于 28℃ 培养箱内培养 7d,观察有无癣菌生长,以无癣菌生长的搽剂最高稀释倍数为该搽剂的最低抑菌浓度(MIC)。

[0040] 以上试验同时设立培养基对照和生理盐水对照。

[0041] (2) 体外杀菌试验

[0042] 取最低抑菌浓度以上的不长菌的培养物,分别转种于琼脂平板上 28℃ 培养 7d,观察有无癣菌生长,以无癣菌生长的搽剂最高的稀释倍数的浓度为该搽剂的最低杀菌浓度(MBC)。

[0043] 以活菌计数法测定搽剂的杀菌时间。取减半浓度的实施例 1 的搽剂,每管 2ml,将已稀释的菌液 0.1ml 接种于搽剂的试管内,并立即计时,分别于 10、30、60min 时取出 0.1ml 置于无菌平皿内,并立即以 1ml 沙堡氏琼脂作倾注平板,28℃ 培养 7d,进行菌落计数。

[0044] 2、止痒试验

[0045] 豚鼠按性别、体重随机为 3 组,每组 8 只。分别为对照组、高剂量组、低剂量组。试验前一天将各组豚鼠左后足足背剪去毛,涂药(实施例 1 得到的搽剂)一次。实验当天,用砂纸轻度擦伤左后足足背剪毛处,以轻度渗血为度,面积为  $1\text{cm}^2$ ,局部再涂搽剂(实施例 1 得到的搽剂)一次,对照组涂等量的生理盐水。第二次涂药 10min 后,开始在创伤处滴加 0.02% 磷酸组胺溶液(按 0.05ml/ 只滴加),此后每隔 4min 依 0.02%、0.03%、0.04%、0.05%、0.06%……递增浓度,每次均为 0.05ml/ 只,直至出现豚鼠回头用舌头舔左后足足背(因出现足背瘙痒),以最后出现豚鼠回头舔左后足足背时所给予的磷酸组胺总量为致痒阈值,记录各组的致痒阈值。

[0046] 3、结果

[0047] 实验结果见表 1-2。

[0048] 表 1 法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂体外抗癣菌作用

[0049]

菌株	MIC (mg/ml)	MBC (mg/ml)	杀菌时间(分钟)		
			10	30	60
红色毛癣菌	1	1	-	-	-
须癣毛癣菌	1	1	-	-	-
絮状表皮癣菌	1	2.5	+	+	-
石膏样毛癣菌	2.5	5	+	+	-
白色念珠菌	1	1	-	-	-
新型隐球菌	1	1	-	-	-

[0050] 注:“+”为长菌,即未被杀死;“-”为不长菌,即已被杀死。

[0051] 表 2 法国梧桐树叶·环吡司胺搽剂对豚鼠磷酸组胺致痒反应的影响

[0052]

组别	剂量 (g/100 g 体重)	动物数 (只)	致氧阈(磷酸组胺总量) ( $\bar{x} \pm SD$ mg)
搽剂	0.2	8	207.35 $\pm$ 104.52 <sup>2)</sup>
搽剂	0.1	8	132.22 $\pm$ 56.26 <sup>2)</sup>
对照组 (生理盐水)	0.2	8	46.20 $\pm$ 17.05

[0053] 搽剂高、低剂量组与对照组相比<sup>2)</sup> $P < 0.01$

[0054] 从表 1 可知：本发明的法国梧桐叶·环吡司胺搽剂对红色毛癣菌、须癣毛癣菌、石膏样毛癣菌、絮状表皮癣菌、白色念珠菌、新型隐球菌等真菌均有较强的抑制和杀灭作用，减半浓度的药液可在 1 小时内将上述 6 种癣菌全部杀死。

[0055] 各种手足癣、皮肤癣的共同的主要的症状为瘙痒，从表 2 可得知：法国梧桐叶·环吡司胺搽剂对豚鼠有明显的止痒作用，给药组与对照组相比有非常显著的差异( $P < 0.01$ )。

[0056] 上述实施例为本发明较佳的实施方式，但本发明的实施方式并不受上述实施例的限制，其他的任何未背离本发明的精神实质与原理下所作的改变、修饰、替代、组合、简化，均应为等效的置换方式，都包含在本发明的保护范围之内。