



MINISTERO DELLO SVILUPPO ECONOMICO
DIREZIONE GENERALE PER LA TUTELA DELLA PROPRIETÀ INDUSTRIALE
UFFICIO ITALIANO BREVETTI E MARCHI

UIBM

DOMANDA NUMERO	101994900382410
Data Deposito	26/07/1994
Data Pubblicazione	26/01/1996

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K		

Titolo

COMPOSIZIONE COSMETICA ED ANTIMICOTICA E SUO METODO DI PREPARAZIONE

DESCRIZIONE

di Brevetto per Invenzione Industriale

di **AMMAR** Khodor

di nazionalità Italiana

a 40100 BOLOGNA - via Degli Orti, 5

Inventore: **AMMAR** Khodor TO 94A00061G

La presente invenzione è relativa ad una composizione cosmetica avente azione di riduzione e/o progressiva scomparsa di antiestetività cutanee quali smagliature, acne, cicatrici, macchie scure, e presentante inoltre spiccata attività antimicotica. L'invenzione è inoltre relativa ad un metodo di preparazione di tale composizione e ad un metodo cosmetico che la utilizza.

E' noto che un gran numero di persone sono affette da problemi estetici connessi con malattie o deterioramento di zone cutanee più o meno estese: per esempio acne, esiti di incidenti (cicatrici), rughe, smagliature, punti neri e macchie scure; tali antiestetività cutanee spesso si accompagnano con eccesso di produzione sebacea e, a volte, con vere e proprie malattie, spesso dovute ad infezioni micotiche, quali psoriasi, pitiriasi, onicomicosi, eccetera.

Attualmente, le persone affette da tali problemi devono utilizzare una serie di prodotti, alcuni

PLEBANI Rinaldo
(iscrizione Albo nr. 358)

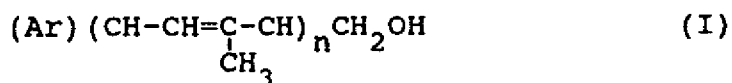
medicinali, altri cosmetici, ciascuno avente un'area di intervento limitata (antimicotici, prodotti antirughe, eccetera). Nei casi più gravi, per esempio di acne, occorre poi addirittura effettuare interventi chirurgici per asportare le parti cutanee colpite.

Scopo del trovato è quello di fornire una composizione cosmetica e, al tempo stesso dotata di capacità antimicotiche, capace di favorire la rigenerazione delle zone cutanee colpite da antiestetività del tipo suddetto, in modo da ridurre con il tempo queste ultime fino ad attenuarle e/o a provocarne una progressiva tendenza alla scomparsa.

In base all'invenzione viene pertanto fornita una composizione cosmetica ed antimicotica, in particolare per il trattamento di antiestetività cutanee quali acne, smagliature, cicatrici e macchie scure, caratterizzata dal fatto di comprendere una soluzione glico-alcolica di un idrochinone di formula generale $HO(Ar)OH$ ove Ar è un gruppo arilico sostituito o non.

Secondo la preferita forma di attuazione dell'invenzione, il detto idrochinone è associato, nella detta soluzione glico-alcolica, con un terpene aromatico di formula generale

PLEBANI Rinaldo
(iscrizione Albo nr. 358)



ove n è un intero compreso tra 1 e 3 e Ar è come sopra.

In particolare, la soluzione glico-alcolica comprende glicole propilenico e, in proporzioni minori, alcool etilico e contiene dall'1,35% al 23,9% in peso di idrochinone e dallo 0,023% allo 0,66% in peso di acido retinoico.

L'acido retinoico è noto quale prodotto anti-acne. Tuttavia, la sua associazione con idrochinone, in una soluzione glico-alcolica, ha sorprendentemente permesso di ottenere un prodotto che è parimenti attivo contro qualsiasi altra antiestetività cutanea e che produce un forte effetto di "peeling" (desquamazione degli strati superficiali di epidermide) con miglioramento visibile del tono, della compattezza e della luminosità dell'epidermide, e con eliminazione delle piccole rughe ed un sensibile miglioramento di quelle più profonde, accompagnato da una riduzione dell'eccesso di sebo.

Nel caso di acne, poi, l'uso ripetuto della composizione secondo l'invenzione comporta sensibili miglioramenti già dopo alcune applicazioni (cinque in media), fino ad una totale scomparsa. La composizione dell'invenzione possiede inoltre una spiccata azione antimicotica, che comporta la guarigione di infezioni quali

PLEBANI Rinaldo
(iscrizione Albo nr. 358)

pitiriasi, versicolor e onicomicosi già dopo due/quattro applicazioni (con una applicazione settimanale). Essa permette infine di ottenere netti miglioramenti anche in caso di psoriasi.

Le prove cliniche condotte non hanno infine evidenziato effetti collaterali apprezzabili, salvo ipersensibilità individuale accertata verso uno dei componenti e cefalea accompagnata o meno da prurito sulle parti trattate, in caso di abuso del prodotto.

La composizione secondo l'invenzione può essere commercializzata ed usata sotto forma di soluzione, utilizzando per l'applicazione cotone, ovatta salviettine o spugnette imbevute, oppure può comprendere eccipienti solidi o semisolidi nei quali la detta soluzione glicol-alcolica è dispersa, in modo da presentarsi in forma di crema, nel qual caso, però, l'effetto di peeling si attenua o scompare del tutto.

La composizione secondo l'invenzione può infine includere un cortisonico od una sostanza anti-infiammatoria e, opzionalmente, una o più vitamine liposolubili, anche se le prove cliniche non hanno dimostrato in questo caso sensibili miglioramenti dell'effetto clinico od estetico.

La composizione secondo l'invenzione si prepara mediante un metodo caratterizzato dal fatto di

PLEBANI Rinaldo
(iscrizione Albo nr. 358)

comprendere le seguenti fasi:

- preparazione di una prima soluzione comprendente come solventi alcool etilico e glicole propilenico in proporzioni uguali in volume e, come soluti, dall'1% al 15% in peso, sul peso totale della soluzione, di un idrochinone di formula generale $\text{HO}(\text{Ar})\text{OH}$ ove Ar è un gruppo arilico sostituito o non, e dallo 0,01% allo 0,13% in peso, sul peso totale della soluzione, di un terpene aromatico di formula generale (I);
- invecchiamento della detta prima soluzione, condotto in aria libera ed a temperatura ambiente per un periodo di almeno 3 giorni, con riduzione del volume totale della soluzione;
- preparazione di una seconda soluzione comprendente come solvente glicole propilenico e, come soluti, dallo 0% all'8,5% in peso, sul peso totale della soluzione, del medesimo idrochinone della prima soluzione, e dallo 0,01% allo 0,4% in peso, sul peso totale della soluzione, del medesimo terpene aromatico della prima soluzione; e
- miscelazione delle due soluzioni in proporzione variabile da 1:1 a 1:1,5.

In particolare, vengono utilizzati come soluti acido retinoico e idrochinone.

~~E' infine uno scopo del trovato quello di fornire~~

POSTILLA 2)

dei metodi cosmetici per il trattamento di antiestetici cutanee, quali acne, cicatrici, smagliature, macchie scure, che permettano di ottenere diversi livelli di risultati, dalla semplice ritonificazione cutanea nei casi di pelli "sane", alla progressiva attenuazione (fino alla scomparsa o quasi) dei difetti.

In base all'invenzione viene pertanto fornito un primo metodo cosmetico, caratterizzato dal fatto che:

- viene preparata una soluzione comprendente come solventi alcool etilico e glicole propilenico in proporzioni uguali in volume e, come soluti, dall'1% al 13% in peso, sul peso totale della soluzione, di idrochinone e dallo 0,01% allo 0,13% in peso, sul peso totale della soluzione, di acido retinoico;
- la detta soluzione viene invecchiata in contatto dell'aria ed a temperatura ambiente per un periodo di tempo di almeno 3 giorni;
- la detta soluzione, dopo l'invecchiamento, viene applicata su una parte cutanea da trattare per produrre un peeling superficiale della parte medesima.

In questo modo, tuttavia, l'azione del cosmetico si limita all'effetto di peeling.

Viene inoltre fornito un secondo metodo cosmetico, caratterizzato dal fatto che:

- viene preparata una soluzione comprendente come unico

solvente glicole propilenico e, come soluti, dallo 0% all'8,5% in peso, sul peso totale della soluzione, di idrochinone e dallo 0,01% allo 0,4% in peso, sul peso totale della soluzione, di acido retinoico;

- la detta soluzione, previo eventuale invecchiamento, viene applicata su una parte cutanea da trattare.

In questo modo si ottiene solamente una limitata azione migliorativa, sufficiente nel caso di pelli "sane", soggette solamente ad eccesso sebaceo o ad altri simili problemi, senza nessun effetto di peeling, che potrebbe essere indesiderato da parte di alcune persone.

Le applicazioni si possono effettuare anche tutti i giorni, una volta al giorno, per un periodo compreso tra 6 e 10 giorni; il detto ciclo di applicazione essendo ripetibile dopo un periodo di sospensione di 4-6 mesi.

Infine, secondo un ulteriore metodo cosmetico più completo, le soluzioni ottenute secondo i metodi cosmetici precedenti, vengono miscelate insieme in un rapporto prefissato; la soluzione risultante venendo conservata in frigorifero e venendo applicata su una parte cutanea da trattare in una quantità prefissata mediante spugnatura con cotone, ovatta, o altro mezzo idoneo imbevuto della soluzione.

Secondo questo metodo cosmetico, la soluzione risultante può essere anche trasformata in una crema

mediante addizione di opportuni eccipienti ed applicata come tale, senza però effetto di peeling apprezzabile, con un'unica applicazione quotidiana, per un ciclo di 15-30 giorni.

Secondo una possibile variante a questo ultimo metodo cosmetico, sulle parti cutanee da trattare viene applicata una soluzione glico-alcolica ottenuta dalla miscelazione delle due diverse soluzioni di cui ai metodi precedenti, dalle quali è stato però eliminato, in tutto o in parte, l'acido retinoico.

In questo caso si ha una diminuzione degli effetti clinici, ma la composizione secondo l'invenzione mantiene comunque una notevole efficacia.

Infine, la detta soluzione risultante può venire diluita in glicole propilenico fino a 30 volte ed utilizzata per trattare zone cutanee particolarmente delicate, quali le labbra e le zone genitali.

Ulteriori caratteristiche e vantaggi del trovato appariranno chiari dai seguenti specifici esempi di attuazione non limitativi.

ESEMPIO 1

Viene preparata una prima soluzione, denominata "soluzione A", avente la seguente composizione:

- acido retinoico 0,8 gr;
- idrochinone 50 gr;

- alcool etilico 400 ml;
- glicolpropilenico 400 ml;

La soluzione, conservata in una bottiglia di vetro scuro è lasciata per 40 giorni esposta all'aria, senza tappo. Alla fine, il prodotto risulta diminuito nel volume di 150 ml, di maggiore densità e quindi con una maggior concentrazione dei componenti e un colore più scuro.

Viene inoltre preparata una seconda soluzione, denominata "soluzione B", avente la seguente composizione:

- acido retinoico 1 gr;
- idrochinone 28 gr;
- glicolpropilenico 530 ml;

Viene infine preparata una terza soluzione, denominata "soluzione C" ottenuta per miscelazione delle soluzioni A e B nel rapporto 1:1,325, che viene poi conservata in frigorifero e che si mantiene stabile ed attiva per 1-5 anni.

ESEMPIO 2

Utilizzando le soluzioni dell'esempio 1 vengono effettuati dei test clinici su un campione di 30 pazienti affette da inestetismi e/o malattie cutanei di varia natura; in particolare, una minima quantità delle soluzioni A e C (0,2 ml per il viso) viene applicata sulla pelle con un batuffolo di cotone e provoca a distanza di 2-3 giorni un peeling (desquamazione degli strati

superficiali dell'epidermide) che dura circa 48 ore. Questo è preceduto da un arrossamento della pelle e un lieve senso di calore, che cessa con la desquamazione superficiale della cute. E' possibile ripetere il peeling a distanza di una settimana.

La soluzione B è applicata su un campione di 30 pazienti nel medesimo modo, quotidianamente per 6-10 giorni, senza produrre alcun peeling.

Le operazioni effettuate evidenziano in tutti i casi un miglioramento visibile del tono, della compattezza e della luminosità dell'epidermide, con progressiva riduzione dell'eccesso di sebo.

Nel caso della soluzione C, inoltre, si evidenzia una eliminazione delle piccole rughe ed un sensibile miglioramento di quelle più profonde, come pure una progressiva riduzione delle macchie scure e, nelle pazienti affette, dell'acne.

Dopo alcune applicazioni (5 in media) l'acne tende a scomparire: il numero totale di applicazioni richieste è in relazione alla maggiore o minore gravità dell'acne.

Sempre con la soluzione C si manifesta, con applicazioni giornaliere localizzate per 3-8 giorni, un miglioramento delle vecchie e nuove cicatrici.

Infine, si evidenzia una spiccata azione anti-micotica, ottenendo guarigioni complete in pazienti affette da

pitiriasi, versicolor e onicomicosi in 2/4 applicazioni, a seconda dei casi, operando 1 applicazione la settimana.

La soluzione C è inoltre sperimentata sul campione suddetto con applicazioni su addome, seno e glutei, una volta alla settimana per 6-10 settimane, ottenendo una sensibile attenuazione delle smagliature.

In tutti i casi di psoriasi è infine stato osservato un sensibile miglioramento a seguito dell'applicazione della soluzione C.

ESEMPIO 3

La soluzione C dell'esempio 1 è stata sperimentata su un gatto affetto da tricofito. Con una sola applicazione si è registrata una perdita temporanea del pelo nella zona trattata, con necrosi degli strati superficiali cutanei. In 20 giorni si è ottenuta, comunque, la guarigione. Si ritiene che in questo caso la concentrazione del prodotto andrebbe diminuita per evitare gli effetti collaterali evidenziati. L'azione antimicotica risulta comunque ampiamente confermata.

ESEMPIO 4

Operando come nell'esempio 1 vengono preparate diverse soluzioni tipo A, B e C, variando la quantità dei componenti nei limiti seguenti:

Soluzione A:

- acido retinoico 0,1 - 1 gr;
- idrochinone 10 - 100 gr;
- alcool etilico 100 - 600 ml;
- glicolpropilenico 100 - 600 ml;

Soluzione B:

- acido retinoico 0,1 - 2 gr;
- idrochinone 0 - 50 gr;
- glicolpropilenico 300 - 800 ml;

Soluzione C: ottenuta per miscelazione delle varie combinazioni A e B in rapporti in volume variabili tra 1:1 e 1:1,5.

L'invecchiamento della soluzione A viene inoltre variato tra 3 e 120 giorni.

Test clinici del tipo di quelli dell'esempio 2 vengono condotti su un campione più esteso di 300 pazienti, impiegando le soluzioni come tali e la soluzione C anche incorporata in una crema.

Si evidenziano i medesimi risultati riportati nell'esempio 2, senza osservare mai effetti collaterali. Non sono stati eseguiti test su donne in gravidanza, né in presenza di neoplasie cutanee o stati allergici.

L'effetto terapeutico migliora con l'invecchiamento della soluzione, fino ad un limite massimo, individuabili in un tempo dell'ordine degli anni. Il cambiamento della concentrazione incide sulla intensità della risposta

terapeutica.

Trasformando la soluzione in crema si ha un effetto qualitativo sulla cute senza però effetto di peeling apprezzabile. La crema può essere utilizzata con applicazioni quotidiane, per cicli di 15-30 giorni.

La sospensione del trattamento non pregiudica gli effetti ottenuti.

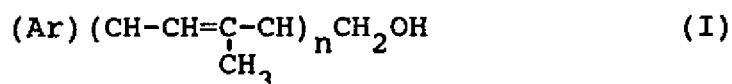
Infine, si è sperimentata la Soluzione C, diluita fino a 30 volte in glicol propilenico, su zone delicate quali labbra e genitali, oppure quando la risposta appare molto intensa, ottenendo la conferma dei risultati precedentemente descritti. L'eliminazione dell'acido retinoico dalla composizione determina una diminuzione apprezzabile degli effetti clinici, ma non la loro scomparsa.

PLEBANI Rinaldo
(iscrizione Albo nr. 358)

R I V E N D I C A Z I O N I

1. Composizione cosmetica ed antimicotica, in particolare per il trattamento di antiesteticità cutanee quali acne, smagliature, cicatrici e macchie scure, caratterizzata dal fatto di comprendere una soluzione glico-alcolica di un idrochinone di formula generale $\text{HO}(\text{Ar})\text{OH}$ ove Ar è un gruppo arilico sostituito o non.

2. Composizione secondo la rivendicazione 1, caratterizzata dal fatto che il detto idrochinone è associato, nella detta soluzione glico-alcolica, con un terpene aromatico di formula generale



ove n è un intero compreso tra 1 e 3 e Ar è come sopra.

3. Composizione secondo la rivendicazione 1 o 2, caratterizzata dal fatto che la soluzione glico-alcolica comprende glicole propilenico e, in proporzioni minori, alcool etilico.

4. Composizione secondo una delle rivendicazioni precedenti, caratterizzata dal fatto che la detta soluzione glico-alcolica contiene dall'1,35% al 23,9% in peso di idrochinone.

5. Composizione secondo una delle rivendicazioni precedenti, caratterizzata dal fatto che la detta soluzione

PLEBANI Rinaldo
(iscrizione Albo nr. 358)

glico-alcolica contiene dallo 0,023% allo 0,66% in peso di acido retinoico.

6. Composizione secondo una qualsiasi delle rivendicazioni precedenti, caratterizzata dal fatto di comprendere eccipienti solidi o semisolidi nei quali la detta soluzione glico-alcolica è dispersa, in modo da presentarsi in forma di crema.

7. Composizione secondo una qualsiasi delle rivendicazioni precedenti, caratterizzata dal fatto di comprendere inoltre un cortisonico od una sostanza anti-infiammatoria e, opzionalmente, una o più vitamine liposolubili.

8. Metodo per la preparazione di una composizione cosmetica ed antimicotica, in particolare per il trattamento di antiesteticità cutanee quali acne, smagliature, cicatrici e macchie scure, caratterizzato dal fatto di comprendere le seguenti fasi:

- preparazione di una prima soluzione comprendente come solventi alcool etilico e glicole propilenico in proporzioni uguali in volume e, come soluti, dall'1% al 15% in peso, sul peso totale della soluzione, di un idrochinone di formula generale $HO(Ar)OH$ ove Ar è un gruppo arilico sostituito o non, e dallo 0,01% allo 0,13% in peso, sul peso totale della soluzione, di un terpene aromatico di formula generale (I);
- invecchiamento della detta prima soluzione, condotto

PLEBANI Rinaldo
(Iscrizione Albo nr. 358)

in aria libera ed a temperatura ambiente per un periodo di almeno 3 giorni, con riduzione del volume totale della soluzione;

- preparazione di una seconda soluzione comprendente come solvente glicole propilenico e, come soluti, dallo 0% all'8,5% in peso, sul peso totale della soluzione, del medesimo idrochinone della prima soluzione, e dallo 0,01% allo 0,4% in peso, sul peso totale della soluzione, del medesimo terpene aromatico della prima soluzione; e

- miscelazione delle due soluzioni in proporzione variabile da 1:1 a 1:1,5.

9. Metodo secondo la rivendicazione 8, caratterizzato dal fatto che vengono utilizzati come soluti acido retinoico e idrochinone.

10. Composizione cosmetica ed antimicotica, in particolare per il trattamento di antiestetività cutanee quali acne, smagliature, cicatrici e macchie scure, caratterizzata dal fatto di essere stata ottenuta con il metodo secondo la rivendicazione 8 o 9.

~~11. Metodo cosmetico per il trattamento di antiestetività cutanee, quali acne, cicatrici, smagliature, macchie scure, caratterizzato dal fatto che:~~

~~- viene preparata una soluzione comprendente come solventi alcool etilico e glicole propilenico in~~

PLEBANI Rinaldo
(Iscrizione Albo nr. 358)

POSTILLA 3)

PLEBANI Rinaldo