

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENÍU

264 721

(11) (B1)

(13)

(51) Int. Cl.⁴

A 61 K 7/48

(22) Prihlášené 26 03 87

(21) PV 2085-87.B

(40) Zverejnené 15 11 88

(45) Vydané 15 12 89

(75)

Autor vynálezu

MINCZINGER ŠTEFAN RNDr., SENEC, RÁZUS ĽUBOSLAV PharmDr.,
BARÁNKOVÁ EDITA abs. farm., NEVYDAL JOZEF ing., HLOHOVEC

(54) **Hydrofilný emulzný krém**

(57) Riešenie sa týka hydrofilného emulzného krému, obsahujúceho v hydrofóbnej i hydrofilnej zložke zlúčeniny 2-aminotridekanu pôsobiace dezinfekčne, antimikrobiálne a antimykoticky, čím je zabezpečený povrchový i hĺbkový účinok.

CS 264 721 B1

Vynález sa týka hydrofilného emulzného krému určeného najmä k mikrobiálnej ochrane pokožky pracujúcich v poľnohospodárstve, ťažkom priemysle, chemickom priemysle, zdravotníctve a pod.

Hydrofilné emulzné krémy patria medzi disperzné systémy emulzného typu, kde vodná fáza tvorí vonkajšiu kontinuálnu časť a hydrofóbnu fázu, ktorá je v nej rovnomerne dispergovaná. Nazývajú sa emulzie olej vo vode O/V.

Dezinfekčné krémy typu O/V obsahujú väčšinou účinnú látku vo vodnej, to znamená vonkajšej fáze, ktorá je v nej rozpustná, t. j. aktívna látka je neprešupná lipofilnou bariérou kože a je účinná len povrchovo.

Príkladom sú ochranné pracovné emulzné krémy, ktoré obsahujú 2-aminotridekan kyslý adipát.

Ďalšími účinnými látkami, ktoré sa používajú v tejto terapeutickú oblasti sú napr. mucidín (Masák, Antimykotika, študijná správa č. 2 075, 1983, VÚFB). Nevýhodou tejto látky je nízka rozpustnosť vo vode a tým aj obmedzenie terapeutickú použiteľnosti.

Iným liečivom, ktoré sa používa externe je bifonazol (Plempel, M. Antimycotic efficacy of bifonazole in vitro and in vivo., *Arzneim. Forsch.* 33, 1983, 517-524). Jeho veľkou nevýhodou je nízky účinok proti kvasinkám.

Podobne nízky antibakteriálny účinok sa našiel u imazalilu (Thienpont, D., The biological and toxicological properties of imazalil. *Arzneim. Forsch.*, 31, 1981, 309-315).

Hydrofilný emulzný krém podľa predmetného vynálezu rieši tieto nedostatky tým, že v hydrofóbnú časť emulzie je rozpustený 2-aminotridekan undecylenát, ktorý je schopný penetrácie cez lipofilnú bariéru kože a hydrofilná časť emulzného krému obsahuje 2-aminotridekan kyslý adipát.

Prítomnosť účinných látok v oboch fázach zaisťuje komplexný dezinfekčný, antimikrobiálny a antimykotický účinok pracovného ochranného emulzného krému.

Výhodou riešenia podľa vynálezu je kombinovaný povrchový i hĺbkový dezinfekčný, antimikrobiálny a antimykotický účinok zabezpečujúci ochranu narušenej pokožky.

Podstatou vynálezu je hydrofilný pracovný ochranný krém vyznačujúci sa tým, že v hydrofóbnú časť obsahuje 2-aminotridekan undecylát v množstve od 0,25 do 0,50 % hmotnostných s výhodou 0,25 % hmotnostných a v hydrofilnej časti emulzie 0,10 % hmotnostných až 0,50 % hmotnostných s výhodou 0,10 % hmotnostných 2-aminotridekan kyslý adipát.

Pracovný ochranný hydrofilný emulzný krém podľa vynálezu bol klinicky odskúšaný a vykazuje výrazné dezinfekčné, antimikrobiálne a antimykotické účinky.

Uvedená kombinácia antimikrobiálnych látok bola odskúšaná podľa britského liekopisu (B. P. Presservative Effectiveness Test 1980) s použitými kmeňmi:

S. aureus ATCC 6 538

Ps. aeruginosa NTCC 675

C. albicans ATCC 10 231

A. niger ATCC 16 404.

Výsledky ukazujú vo všetkých prípadoch zvolených mikroorganizmov výrazný pokles počtu jednotiek mikroorganizmov vo formulácii.

Stabilita hydrofilného krému bola skúšaná štandardným postupom pri obyčajnej teplote, +5 °C, +40 °C a piatich cykloch tuhnutia (topenia, ktoré simulujú kolísanie teploty počas skladovania).

Výsledky hodnotenia stálosti emulzie ukázali, že pri zachovaní bežných skladovacích podmienok a spôsoboch použitia vyhovuje prípravok obvyklým kvalitatívnym požiadavkám.

Dermálna dráždivosť bola odskúšaná na autorizovanom pracovisku podľa platných noriem (ČsL-4) s vyhovujúcim výsledkom.

Širší klinický test bol prevedený na 498 probantoch taktiež s vyhovujúcim výsledkom.

V ďalšom je predmet vynálezu objasnený na dvoch príkladoch bez toho, že by sa na tieto výlučne obmedzoval.

Príklad 1

1. Ester mastnej kyseliny s polyoxietylénom	6,00 dielov váhov.
2. Cetylalkohol	1,00 dielov váhov.
3. Stearin	5,00 dielov váhov.
4. Minerálny olej	7,00 dielov váhov.
5. 2-oktyldodekanol	3,00 dielov váhov.
6. 2-aminotridekan undecylenát	0,25 dielov váhov.
7. Glycerin	3,80 dielov váhov.
8. Voda destilovaná	72,75 dielov váhov.
9. 2-aminotridekan kyslý adipát	0,10 dielov váhov.
10. Hydratačný faktor (napr. Lactil)	1,00 dielov váhov.
11. Vôňu korigujúca látka	0,10 dielov váhov.

Popis výroby

Olejové komponenty sa rozpustia pri teplote 55 °C a do zmesi sa pridá účinná látka 2-aminotridekan undecylát, ktorá sa nechá v uvedenej zmesi rozpustiť.

Súčasť vodnej fázy sa rozpustia v destilovanej vode pri teplote 60 °C.

Olejová fáza sa emulguje vodnou fázou pri teplote 55 °C a sústavným homogenizovaním sa vzniknutá emulzia chladí. Pri teplote emulzie 35 °C sa pridá vôňu korigujúca látka.

P r í k l a d 2

1. Ester mastnej kyseliny s polyoxietylénom	6,00 dielov váhov.
2. Cetylalkohol	1,00 dielov váhov.
3. Stearin	5,00 dielov váhov.
4. Minerálny olej	6,75 dielov váhov.
5. 2-oktyldodekanol	3,00 dielov váhov.
6. 2-aminotridekan undecylenát	0,50 dielov váhov.
7. Glycerin	3,80 dielov váhov.
8. Voda destilovaná	72,35 dielov váhov.
9. 2-aminotridekan kyslý adipát	0,50 dielov váhov.
10. Hydratačný faktor	1,00 dielov váhov.
11. Vôňu korigujúca látka	0,10 dielov váhov.

P R E D M E T V Y N Á L E Z U

1. Hydrofilný emulzný krém vyznačujúci sa tým, že v hydrofóbnej časti obsahuje 2-aminotridekan undecylát v množstve od 0,25 do 0,50 % hmotnostných a v hydrofilnej časti emulzie 0,10 % hmotnostných až 0,50 % hmotnostných 2-aminotridekan kyslý adipát.

2. Hydrofilný emulzný krém podľa bodu 1 vyznačujúci sa tým, že pomer medzi hydrofilnou a hydrofóbnou fázou je 77,65:22,35.