



Patent dodatkowy
do patentu

Kl. 30 h, 13/06

Zgłoszono: 30.X.1964 (P 106 110)

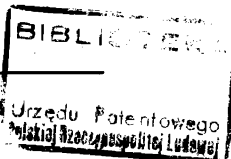
Pierwszeństwo: 4.XI.1963 Stany
Zjednoczone
Ameryki

MKP A 61 k

7/00

Opublikowano: 6.II.1967

UKD



Twórca wynalazku: Paul Finkelstein

Właściciel patentu: The Gillette Company, Boston (Stany Zjednoczone
Ameryki)

Środek do pielęgnacji skóry i włosów

1

Wynalazek dotyczy środka służącego do pielęgnacji skóry, włącznie ze skórą owłosioną głowy, który ma za zadanie zmniejszać lub hamować wydzielanie się substancji tłuszczowych i zapobiegać gromadzeniu się warstwy tłuszczu na powierzchni skóry lub włosów.

Obecność na skórze nadmiernie gromadzących się substancji tłuszczowych, które pochodzą z gruczołów łojowych, potowych i rogowacenia skóry, jest niepożądana przede wszystkim z kosmetycznego punktu widzenia, ponieważ ich obecność wywołuje tak zwany „błyszczący nos” i zły wygląd cery. Nadmiernie tłusta cera towarzyszy niektórym schorzeniom skóry, szczególnie trądzikowi pospolitemu. Choć istnieją znaczne różnice poglądów odnośnie tego, czy istnieje związek przyczynowy między nadmiernym wydzielaniem się tłuszczów i trądzikiem pospolitym, jest rzeczą stwierdzoną, że niektóre z bardziej skutecznych sposobów leczenia trądzika powodują również zmniejszenie wydzielania się tłuszczów. Ponadto, u wielu ludzi włosy szybko przetłuszczają się z powodu nadmiernego wytwarzania się substancji tłuszczowych.

W celu usuwania nadmiaru tłuszczu, od dawna istniała potrzeba wynalezienia preparatu szampowego zdolnego do pozostawiania na skórze owłosionej głowy pozostałości posiadającej własność zmniejszania lub hamowania wydzielania się substancji tłuszczowych.

2

Zagadnienie to rozwiązuje środek według wynalazku. Środek ten składa się z aminy alifatycznej jako substancji czynnej, rozprowadzonej we właściwym podłożu. Stosowane w środku według wynalazku aminy alifatyczne mają wzór ogólny RNH_2 , w którym R oznacza nasyconą grupę węglowodorową o łańcuchu prostym, zawierającą od 12 do 20 atomów węgla. W szczególności stosuje się palmityloaminę, stearyloaminę, lauryloaminę lub ich mieszaniny. Szczególnie przydatną jest stearyloamina.

Podłoża dermatologiczne, które można użyć w środku, według wynalazku zawierają takie nośniki i rozpuszczalniki, które są dozwolone pod względem farmaceutycznym do zewnętrznego stosowania.

Sporządzanie podłoży dermatologicznych i wprowadzanie aminy alifatycznej do nich lub do roztworów odbywa się za pomocą konwencjonalnych sposobów, dobrze znanych w tej dziedzinie. Zawartość aminy alifatycznej w środku może wahać się w granicach 0,5–15% wagowych w odniesieniu do podłoża lub rozpuszczalnika, najkorzystniejsze ilości leżą w granicach 1 do 8% wagowych. Preparat może być wytwarzany w postaci maści, płynu do zmywania, szamponu, pasty, żelu, proszku.

Szczególnie przydatne są maście, płyny do zmywania, i szampony. Maście zawierają podłoża typu emulsyjnego, adsorpcyjnego, rozpuszczalnego w

wodzie, oleistego, opisane w dziele Remingtona *Pracice of Pharmacy*, 11 wydanie (1956 r.), strona 336 (Mack Publishing Company). Szczególnie korzystne są podłoża typu emulsyjnego jak kremy przeznaczone do użytku zewnętrznego, które są stałymi emulsjami. Jako płyny do zmywania można zastosować ciekłe zawiesiny albo dyspersje stabilizowane substancjami powierzchniowo-czynnymi, najlepiej niejonowymi.

Można również wytwarzać preparat w postaci preparatu szamponowego z tym, że należy wykluczyć w preparacie anionowe, powierzchniowo-czynne substancje lub detergenty, jak również inne składniki zawierające wielkocząsteczkowy anion, gdyż związki te reagują z alifatyczną aminą. Mogą być natomiast stosowane kationowe i niejonowe substancje powierzchniowoczynne. Szczególnie dobre są preparaty szamponowe zawierające detergenty niejonowe, takie jak izo-oktylofenylopolietoksyetanol (nazwa handlowa Triton x—100), eter nonylofenylopolietylenoglikolowy (15 moli tlenku etylenu — nazwa handlowa Tergitol MP — 35), jak również produkt kondensacji tlenku etylenu z hydrofilową zasadą powstałą w wyniku kondensacji tlenku propylenu z glikolem propylenowym (nazwa handlowa Pluronic F — 68). Preparaty szamponowe mogą również zawierać jakiegokolwiek nieanionowe dodatkowe składniki, konwencjonalnie używane w preparatach szamponowych, takie jak substancje pianotwórcze, utrwalacze, środki zapachowe itp.

Stwierdzono również, że można wytwarzać proste preparaty w postaci roztworów wodno-alkoholowych amin alifatycznych. W tym przypadku jest wskazane, aby w preparacie był zawarty, jako jego składnik, dermatologiczny środek bakteriobójczy. Roztworem tym nasycą się poduszczeni (tampony), na przykład z gazy, albo roztwór ten ładuje się do pojemników ciśnieniowych razem ze środkiem wytwarzającym ciśnienie w celu otrzymania preparatu aerozolowego.

Można stosować jako środki bakteriobójcze heksachlorofen, fenol, nitrofurazon i antybiotyki takie jak bacytracyna, polimiksyna, neomycyna. Środek bakteriobójczy wprowadza się w ilości 0,05—2,0% wagowych w stosunku do podłoża lub rozpuszczalnika, zależnej od właściwości wprowadzonego środka.

Ponadto, prócz aminy alifatycznej, środka bakteriobójczego i składników podłoża lub rozpuszczalnika, mogą być zawarte w preparacie jakiegokolwiek addytywne substancje używane zwyczajowo do preparatów do pielęgnacji skóry, takie jak środki miejscowo znieczulające jak alkohol benzylowy lub mentol; środki osuszające; środki złuszczące; olejki eteryczne; kamfora; olejek goździkowy; olejek eukaliptusowy; allantoina; przeciwutleniacze; środki konserwujące; środki buforowe; środki zapachowe; środki zagęszczające.

Można również wytwarzać preparaty aerozolowe. W tym celu roztwory aminy alifatycznej w odpowiednim rozpuszczalniku, takim jak alkohol etylowy lub mieszanina alkoholu etylowego i wody, mogą być mieszane ze środkiem rozpylającym,

którym może być albo gaz, albo skroplony gaz, a mieszaninę taką ładuje się do zamkniętego pojemnika ciśnieniowego posiadającego wylot regulowany zaworem. Można tu użyć jakiegokolwiek ze zwykle używanych środków ciśnieniotwórczych jak azot, podtlenek azotu, propan, izobutan lub najkorzystniej chlorowcowane, nasycone węglowodory, znane pod nazwą handlową „Freon”, i takie jak 1,1-dwufluoroetan; 1,2-dwuchloro-1,1,2,2-tetrafluoroetan; tróchlorotrójfluoroetan; dwuchlorodwufluorometan; jednocchlorodwufluorometan; jednofluotrójchlorometan; 1-jednochloro-1,1-dwufluoroetan; lub ich mieszaniny.

Niżej podane przykłady objaśniają istotę wynalazku, ale nie ograniczają jego zakresu.

Przykład I. Sporządzono roztwór, w którym wagowy udział składników jest następujący:

Etanol	10,0
Mentol	0,075
Kamfora	0,2
Heksachlorofen	0,1
Chlorek N-alkilodwumetylo-benzyloaminy	0,25
Etoksylogany alkohol cetylowy	2,0
Stearioamina	2,0
Woda	do 100
Środek zapachowy	q.e.

Tak przygotowany płyn do zmywania używano do nasycania absorpcyjnych płatków z gazy o przybliżonej średnicy około 5 cm. Nasycone poduszczeni pakuje się w odpowiednie hermetyczne (gazoszczelne) pojemniki. Płatków używa się do przecierania lub nacierania skóry, przy czym pozostaje na niej cienka warstwa płynu do zmywania.

Efektywność płynu do zmywania oznaczano za pomocą testu po uprzednim oznaczeniu ilości substancji tłuszczowej normalnie obecnej na czole. Oznaczenia normalnej ilości tłuszczów na skórze czoła dokonywano za pomocą oczyszczania skóry mieszaniną wody z rozpuszczalnikami organicznymi lub za pomocą mechanicznego wycierania. Stosowano tu dla każdej strony czoła krawki z flaneli bawełnianej o średnicy około 3—5 cm, które uprzednio wyekstrahowano eterem dwuetylowym. Krawki przylegały do skóry przez 5 godzin przyciśnięte bandażem elastycznym.

Zawartość substancji tłuszczowej była następnie oznaczana za pomocą ekstrakcji rozpuszczalnikiem i przeliczana na zawartość pochłoniętą przez jednostkę powierzchni krawka flanelowego. Ilość tłuszczu na prawej stronie czoła nie zawsze była identyczna z ilością na lewej stronie, jednak, co jest charakterystyczne, stosunek pomiędzy dwoma stronami był stały. Po zastosowaniu do jednej części czoła środka według wynalazku, gromadzenie się substancji tłuszczowej zostało na tej części czoła zmniejszone o 15—20%.

Przykład II. Sporządzono środek o następującym składzie wagowym:

Stearioamina	2,0
monolaurinian sorbitowy	0,5
monolaurinian polioksyetyleno-sorbitowy	0,5
Woda	do 100
Środek zapachowy	q.s.

Powstała dyspersję wodną używano jako kąpiel płuczając po myciu włosów szamponem.

Przykład III. Sporządzono środek o następującym składzie wagowym:

Siarka koloidalna	1,0
Polioksyetylenowy alkohol cetylowy	11,0
Trójetanolamina	10,0
Glikol propylenowy	56,0
Palmitoamina	5,0
Woda	do 100
Środek zapachowy	q.s.

Uzyskany płyn do zmywania używano do wcierania w skórę.

Przykład IV. Sporządzono środek o składzie wagowym:

Dwutlenek tytanu	40,0
Kaolin	5,0
Stearynian izopropylu	30,0
Lauryloamina	0,5
Lecytyna	1,0
Lanolina	3,0
Alkohol cetylowy	2,0
Cerezyina	4,0
Rezorcyina	2,9
Siarka koloidalna	8,0

Uzyskane ciasto lecznicze używano wcierając je w skórę za pomocą kawałka materiału lub poduszeczki. Po zabiegu pozostawała na skórze cienka warstwa preparatu.

Przykład V. Sporządzono środek o składzie wagowym:

Stearynian polioksyetylenowy	24,0
Wyciąg ze smoły pogazowej	2,5
Siarka koloidalna	0,5
Arachidyloamina	3,0
Etanol	5,0
Gliceryna	5,0
Woda	do 100
Środek zapachowy	q.s.

Uzyskany środek stosowano wcierając w skórę.

Przykład VI. Sporządzono maść o składzie wagowym:

Siarczan neomycyny	0,5
Alkohol oleinowy	25,0
Sorbitol	4,0
Lanolina kosmetyczna	65,0
Palmitoamina	3,5
Środek zapachowy	q.s.

Maści używano do wcierania w skórę za pomocą palców lub za pomocą poduszeczki.

Przykład VII. Sporządzono puder o następującym składzie wagowym:

Tlenek cynku	3,0
Siarczek potasu	5,0
Mirystoamina	7,0
Talk	do 100

Puder stosowano do pielęgnacji skóry w zwykły sposób.

Przykład VIII. Sporządzono środek o składzie wagowym:

Bentonit	15,0
Dwutlenek tytanu	2,0
Gliceryna	4,0
Siarka	3,0
Heksachlorofen	0,5

Stearyloamina	4,0
Woda	do 100
Środek zapachowy	q.s.
Środkiem nasycano tampony do zmywania twarzy.	

Przykład IX. Sporządzono środek o składzie wagowym:

Stearyloamina	4,5
Palmitoamina	4,5
Glikol 1,3 — butylenowy	5,0
Alkohol heksadecylowy	5,0
Etanol	30,0
Środek zapachowy	q.s.

Roztwór ładowano do pojemnika ciśnieniowego w zwykły sposób razem z 35 częściami wagowymi dwufluoro-dwuchlorometanu i 20 częściami wagowymi 1,2-dwuchloro-1,1,2,2-czterofluoroetanu. Otrzymano aerozolowy preparat stosowany do spryskiwania skóry.

Przykład X. Sporządzono preparat o następującym składzie wagowym:

Stearyloamina	4,0
Heksachlorofen	1,0
Etanol	10,0
Woda	do 100

Roztworem nasycano materiał absorpcyjny, którym przecierano skórę.

Przykład XI. Sporządzono preparat szamponowy o składzie wagowym:

Eter nonylofenylopolietylenoglikolu (15 moli tlenu etylenu)	8,0
Produkt kondensacji tlenu etylenu z zasadą hydrofilową, utworzoną przez kondensację tlenu propylenu z glikolem propylenowym	8,0
Dwuetyloamid kwasu laurynowego	2,5
Tlenek laurylodwumetyloaminy	5,0
Stearyloamina	5,0
Kwas octowy	do pH 8,0
Woda	do 100

Wartość preparatu szamponowego została stwierdzona przez zastosowanie go do mycia jednej połowy głowy, porównując wyniki z wynikami mycia drugiej połowy głowy znanymi anionowymi szamponami. Preparat szamponowy pienił się prawie tak samo dobrze jak konwencjonalny preparat anionowy i nadawał włosom miękkość i połysk. Subiektywna ocena szybkości tworzenia się substancji tłuszczowych na skórze owłosionej głowy wskazywała, że tworzenie się tej substancji uległo daleko idącemu zmniejszeniu po stronie głowy, która została umyta środkiem według wynalazku.

Przykład XII. Sporządzono środek o następującym składzie wagowym:

Izooktylofenylopolietoksyetanol	8,0
Produkt kondensacji tlenu etylenu z hydrofilową zasadą wytworzoną przez kondensację tlenu propylenu z glikolem propylenowym	8,0
Dwuetyloamid kwasu laurynowego	2,5
Tlenek laurylodwumetyloaminy	5,0
Stearyloamina	5,0
Kwas octowy	do pH 8,2
Woda	do 100

Preparat szamponowy zastosowano do pielęgnacji głowy w sposób opisany w przykładzie XI z podobnymi wynikami.

Zastrzeżenia patentowe

1. Środek do pielęgnacji skóry i włosów, **znamienny tym**, że zawiera znane podłoże dermatologiczne i aminę o wzorze ogólnym $R-NH_2$, w którym R oznacza nasyconą grupę węgl-

5

10

wodorową o łańcuchu prostym, zawierającą 12—20 atomów węgla, w ilości 0,5 do 15% w stosunku do podłoża.

2. Środek według zastrz. 1, **znamienny tym**, że jako aminę o wzorze $R-NH_2$ zawiera stearyloaminę.
3. Środek według zastrz. 1 i 2, **znamienny tym**, że jako podłoże dermatologiczne zawiera wodno-alkoholowy roztwór z dodatkiem substancji bakteriobójczej.

