



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

239 217

(11)

(B1)

(61)

(23) Výstavní priorita
(22) Přihlášeno 19 03 84
(21) PV 1925-84

(51) Int. Cl.⁴

A 61 K 9/06

(40) Zveřejněno 15 05 85
(45) Vydáno 01 08 87

(75)
Autor vynálezu

NOVÁK VLADIMÍR ing.;
MAIRYCH MICHAL ing.;
VLTAVSKÝ ZDENĚK RNDr. PhMr., PRAHA

(54)

Mastový základ typu emulze voda/olej

Mastový základ typu emulze voda/olej, který je určen pro léčebné a/nebo kosmetické účely. Kromě běžných tukových a hydrofilních složek obsahuje stearan hlinitý a zinečnatý; změnou jejich množství lze v širokých mezích měnit vlastnosti základu, zejména konzistenci, od mlékovité až do pastovité. Dalšími podstatnými složkami jsou včelí vosk, tetraboritan sodný a emulgátor s hodnotou hydrofilně-lipofilní rovnováhy 4 až 5, zejména typu esterů mastných kyselin s glycerolem a sorbitolem.

Vynález se týká masťového základu typu emulze voda/olej, určeného pro léčebné a/nebo kosmetické účely; podle potřeby může být konzistence tohoto základu upravována například od formy krému /pasty/ až do formy tekutého mléka. Sortiment dosud vyráběných mastných emulzních dermálních přípravků farmaceutických a/nebo kosmetických je poměrně omezený. Jetě výraznější je tento nedostatek u preparátů typu pleťového mléka. Vyskytuje se značné množství pacientů, kteří pro reparaci suché pokožky potřebují právě mastný emulzní základ, který dodává pokožce chybějící tuk.

Při vývoji optimálního složení masťového základu typu emulze voda/olej je nutno vybírat takovou recepturu, která zajišťuje požadované fyzikální, chemické i farmakologické vlastnosti. Je to zejména požadavek stability emulzního systému, jeho reologické parametry, roztíratelnost, vstřebatelnost a dermální nedráždivost.

Problémem sestavení kvalitního mastného emulzního základu typu voda/olej se zabývají odborníci již dlouhou dobu. Tento typ základu je totiž technologicky náročnější než emulze opačného typu, tj. olej/voda. Je to dáno především tím, že vhodné emulgátory s nízkou hodnotou hydrofilně-lipofilní rovnováhy nejsou k dispozici v příliš velkém výběru, takže volba vhodné suroviny je obtížnější, má-li se dosáhnout daný účinek. V některých případech jsou proto mastné emulzní krémy typu voda/olej nahražovány přípravky na bázi ambifilní emulze typu voda/olej/-voda, jež obsahují zvýšené množství tukové fáze.

Výrobky na bázi emulze voda/olej jsou vhodné pro lehkost aplikace, vyhovující vzhled, konzistenci, balení a cenu.

Vlastnosti základů uvedeného typu jsou závislé na vlastnostech všech složek a na technologickém postupu. Tak například byla sledována smývatelnost emulzí s použitím různých základů a nového přístroje /B.Fečák, J.Kučera, Průmysl potravin 9, 283, 1970/. Dále byly studovány metody stanovení typu emulze /G.A.Nowak, Seifen, Öle, Fette, Wachse 92, 65, 67, 1966/, pojednávána problematika mastných emulzí /E.S.Lower, Seifen, Öle, Fette, Wachse 99, 16, 1973/ a rozebírány teorie tohoto typu emulzí a emulgátorů se zvláštním zřetelem k sorbitanmonostearátu. Rovněž bylo popsáno použití emulzí voda/olej včetně receptur /W.Heers, Seifen, Öle, Fette, Wachse 101 /3/, 71, 1975/. Britský patent č. 1 128 170 chrání přípravu netoxických a nedráždivých emulzí voda/olej s obsahem monoglyceridu kyseliny olejové a 30 až 70 % vodného roztoku sorbitu, s případnou přísadou až 16 % propylenglykolu. Čs.autorské osvědčení č. 173 983 řeší recepturu a technologii směsného typu emulze, do které je možno inkorporovat značné množství vodné a tukové fáze. Emulze má mastný charakter, i když její vnější fáze je vodná.

Další pokrok v uvedené oblasti představuje masťový základ typu emulze voda/olej, na bázi mastné složky s obsahem vazelíny a/nebo včelího vosku a hydrofilní složky s obsahem vody a/nebo propylenglykolu a/nebo ethanolu, s přísadou emulgátoru, stabilizátoru a/nebo konzervační látky podle vynálezu. Jeho podstata spočívá v tom, že obsahuje 0,2 až 1,0, s výhodou 0,4 až 0,7 % hmot. stearanu hlinitého, 0,05 až 0,90, s výhodou 0,10 až 0,40 % hmot. stearanu zinečnatého, 2,0 až 5,0, s výhodou 3,0 až 4,0 hmot. včelího vosku, 0,5 až 1,0, s výhodou 0,6 až 0,8 % hmot. tetraboritanu sodného a 3,0 až 6,0, s výhodou 4,0 až 5,0 % hmot. fyziologicky neškodného emulgátoru s hodnotou hydrofilně-lipofilní rovnováhy 4 až 5, zejména typu esterů mastných kyselin s glycerolem a sorbitolem.

Mašťový základ podle vynálezu byl sestaven na základě dlouhodobého výzkumu vhodné receptury a technologie. Představuje mastný emulzní základ vyhraněného typu voda/olej, s příznivými vlastnostmi reologickými, s optimální stabilitou a dermální

snášenlivostí. Součástí tohoto základu tvoří osvědčené, ve farmacii i v kosmetice již dlouho používané suroviny, dobře tolerované.

Základními složkami, které mají vliv na konzistenci připravované emulze, jsou stearan zinečnatý a hlinitý a jejich poměr. Vyšší obsah stearanu hlinitého zajišťuje řidkou /mlékovitou/ konzistenci a její stabilitu. Zvýšený obsah stearanu zinečnatého dodává naproti tomu emulzi hustší, až pastovitou konzistenci. Změnou vzájemného poměru těchto složek lze snadno měnit v širokých mezích vlastnosti konečného výrobku, což značně rozšiřuje aplikační možnosti.

Tetraboritan sodný plní v masťovém základu podle vynálezu funkci pufru, stabilizátoru, fyziologicky přijatelného alkalizujícího činidla, určeného k neutralizaci volných mastných kyselin, popřípadě obsažených v tukové složce /včelí vosk, lanolin apod./.

Vhodný fyziologicky neškodný emulgátor s nízkou hodnotou hydrofilně lipofilní rovnováhy, nejlépe 4 až 5, například na bázi esterů mastných kyselin s glycerolem a sorbitolem, usnadňuje dokonalou disperzi obou fází a umožňuje, aby do vytvořené emulze mohly být podle potřeby inkorporovány další hydrofilní a/nebo lipofilní složky, zejména účinné. Masťový základ podle vynálezu, již sám o sobě, bez přísad jakýchkoliv účinných látek, slouží jako inertní dermatologikum, určené zejména pro pediatrickou praxi.

Velká variabilita fyzikálně-chemických vlastností, bez jakéhokoliv omezení nebo zhoršení aplikace, snášenlivosti, resorpce, smývatelnosti či subjektivních pocitů u uživatele, představuje nejvýznamnější přínos oboru externích přípravků.

Masťový základ podle vynálezu vyhovuje předepsaným zkouškám jak podle lékopisu tak i podle platných norem. Klinické zkoušení na reprezentativním souboru osob potvrdilo dobrou snášenlivost, nedráždivost a předpokládanou účinnost.

Následující příklady provedení ilustrují několik aplikačních možností masťového základu podle vynálezu, aniž by tím ovšem byly všechny možnosti vyčerpány.

Příklad 1

Dětský krém I

Parafinový olej	20,00
Parafin pevný	5,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,30
Stearan hlinitý	0,30
Tetraboritan sodný	0,60
Kysličník zinečnatý	8,00
Emulgátor	4,00
Parfém	0,50
Konzervans	0,20
Voda	58,10

Příklad 2

Dětský krém II

Parafinový olej	20,00
Parafin pevný	6,00
Vaselina bílá	6,95
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,05
Stearan hlinitý	0,60
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	4,00
Parfém	0,50
Konzervans	0,20
Voda	58,10

Příklad 3

Mastný kortikosteroidní krém

Parafinový olej	20,00
Parafin pevný	5,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,60
Stearan hlinitý	0,40
Tetraboritan sodný	0,60

Emulgátor	4,00
Hydrokortison-acetát	0,10
Konzervans	0,20
Voda	66,10

Příklad 4 Krém proti akne

Vaselina bílá	25,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,40
Stearan hlinitý	0,40
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	4,00
Kyselina salicylová	0,50
Koloidní síra	2,00
Konzervans	0,20
Voda	63,90

Příklad 5 Glycerinový krém na ruce

Parafinový olej	15,00
Parafin pevný	5,00
Včelí vosk	4,00
Lanolin	5,00
Glycerin	10,00
Stearan zinečnatý	0,30
Stearan hlinitý	0,50
Tetraboritan sodný	0,80
Emulgátor	5,00
Konzervans	0,15
Voda	54,25

Příklad 6

Opalovací krém

239 217

Parafinový olej	23,00
Parafin pevný	5,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,40
Stearan hlinitý	0,40
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	5,00
alfa-naftylcetylether	5,00
Theofylin	2,00
Propylenglykol	5,00
Parfém	0,60
Konzervans	0,22
Voda	50,78

Příklad 7

Krém s azulenem

Vaselina bílá	23,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,50
Stearan hlinitý	0,30
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	4,00
Azulen	0,20
Konzervans	0,20
Voda	68,20

Příklad 8

Mastné pleťové mléko

Parafinový olej	24,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,05
Stearan hlinitý	0,60
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	4,00

Ethanol	5,00
Parfém	0,40
Konzervans	0,20
Voda	62,15

Příklad 9 Mléko proti svrabu

Parafinový olej	26,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,10
Stearan hlinitý	0,60
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	4,00
gama-Isomer hexachlor- cyklohexanu	1,00
Konzervans	0,10
Voda	64,60

Příklad 10 Masážní mléko

Parafinový olej	22,00
Včelí vosk	3,00
Stearan zinečnatý	0,05
Stearan hlinitý	0,60
Tetraboritan sodný	0,60
Emulgátor	4,00
Ethanol	5,00
Menthol	0,50
Salicylan methylnatý	0,30
Hořčičný olej	0,001
Kafr	1,00
Konzervans	0,20
Voda	62,749

Při výrobě přípravků, jejichž složení je uvedeno v předcházejících příkladech provedení, se obecně postupuje tak, že se nejprve složky tukové fáze /parafinový olej, parafin pevný, včelí vosk, vaselina, lanolin apod./ roztaví a sterilizují při 130 °C po dobu 30 min. Při teplotě 110 °C se rozpustí stearan zinečnatý a stearan hlinitý a při teplotě 90 °C se do směsi přidá emulgátor, který se rovněž rozpustí. Při teplotě 65 až 75 °C se přidává vodná fáze, tvořená sterilizovanou destilovanou nebo demineralizovanou vodou, ve které je rozpuštěn tetra-boritan sodný, konzervans apod. Po provedené emulgaci, která probíhá ve vhodném homogenizačním kotli, se za stálého míchání emulze ochladí na teplotu 40 °C. Při této teplotě se do emulze přidají účinné látky a parfém a získaná směs se za mírného míchání ochladí na teplotu místnosti /okolo 20 °C/ a plní.

Klinickému zkoušení byly podrobeny dětské krémy připravené podle příkladů 1 a 2 /Neridetta/. Testování krémů bylo provedeno na 63 pacientech kožní kliniky s diagnosou ekzém-dermatitis. Krémy velmi dobře vyhovovaly indikovanému účelu, nevyvolávaly žádné projevy nesnášenlivosti ani na zvláště disponovaném terénu.

1. Masťový základ typu emulze voda/olej, na bázi mastné složky s obsahem tekutého a/nebo pevného parafinu a/nebo vaseliny a/nebo včelího vosku a hydrofilní složky s obsahem vody a/nebo propylenglykolu a/nebo ethanolu, s přísadou emulgátoru, stabilizátoru a/nebo konzervační látky, vyznačující se tím, že obsahuje 0,2 až 1,0 % hmot. stearanu hlinitého, 0,05 až 0,90 % hmot. stearanu zinečnatého, 2,0 až 5,0 % hmot. včelího vosku, 0,5 až 1,0 % hmot. tetraboritanu sodného a 3,0 až 6,0 % hmot. fyziologicky neškodného emulgátoru s hodnotou hydrofilnělipofilní rovnováhy 4 až 5, zejména typu esterů mastných kyselin s glycerolem a sorbitolem.
2. Masťový základ podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje s výhodou 0,4 až 0,7 % hmot. stearanu hlinitého.
3. Masťový základ podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje s výhodou 0,1 až 0,4 % hmot. stearanu zinečnatého.
4. Masťový základ podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje s výhodou 3,0 až 4,0 % hmot. včelího vosku.
5. Masťový základ podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje s výhodou 0,6 až 0,8 % hmot. tetraboritanu sodného.
6. Masťový základ podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje s výhodou 4,0 až 5,0 % hmot. fyziologicky neškodného emulgátoru.