



MINISTERO DELLO SVILUPPO ECONOMICO
DIREZIONE GENERALE PER LA LOTTA ALLA CONTRAFFAZIONE
UFFICIO ITALIANO BREVETTI E MARCHI

DOMANDA NUMERO	101999900771511
Data Deposito	02/07/1999
Data Pubblicazione	02/01/2001

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K		

Titolo

SOLUZIONE VEICOLANTE PER L'ASSORBIMENTO TRANSDERMICO DI PRINCIPI ATTIVI FARMACOLOGICI

MIONI Enrico - TORREGLIA (PD)

TITOLO

SOLUZIONE PER APPLICAZIONE TRANSDERMICA E
RELATIVO STOCCAGGIO NEL DERMA

5 DESCRIZIONE

Il presente brevetto è attinente al settore medico e curativo ed in particolare concerne una soluzione per l'applicazione globale e/o topica di principi funzionali nutrizionali con peculiari caratteristiche farmacologiche ed una forma tecnica per
10 l'attuazione del trovato stesso.

Specificatamente riguarda una nuova soluzione veicolante per l'assorbimento transdermico di principi nutritivi e/o medicali.

I principi attivi farmacologici sono attualmente somministrati in varie forme: per via orale, parenterale, topica (pomate, creme,
15 ecc), transdermica a lento rilascio.

Attualmente la ricerca è sempre più orientata verso l'affrancamento dagli usuali sistemi di somministrazione farmacologica. Poichè è noto che la somministrazione di sostanze chimiche per via sistemica in farmacologia comporta la parziale
20 inattivazione dei principi attivi utilizzati, con una metabolizzazione antecedente al raggiungimento dell'organo bersaglio, con potenziali effetti collaterali in termini di gastrolesività, epatotossicità e nefrotossicità.

Finora si aumentava la dose di principio attivo per unità di
25 somministrazione, onde assicurare che una quantità sufficiente di



principio attivo raggiungesse l'organo bersaglio, oppure si schermava perchè non venisse metabolizzato rapidamente o per tamponarne gli effetti collaterali su organi non interessati dalla cura. (gastrolesività, epatotossicità, nefrotossicità).

- 5 I sistemi transdermici attualmente utilizzati prevedono l'inserimento del principio attivo in un supporto adesivo, tipo cerotto, da applicare sulla pelle del paziente.

Tali sistemi transdermici permettono un graduale rilascio dei principi attivi che vengono assorbiti dalla pelle e messi in
10 circolazione nell'organismo.

- Anche la somministrazione di principi farmacologici per via transdermica, attualmente realizzata, non è scevra da effetti irritativi in loco legati al rischio di perturbare il circuito corneo extracellulare con conseguente alterazione della sua architettura e
15 perdita di selettività. In più alcune persone soffrono di allergia alle sostanze collanti del cerotto o hanno disagio ad indossare e mantenere un cerotto per svariate ore. A seguito di ciò vengono ricercate nuove soluzioni tecniche nella realizzazione di prodotti farmacologici e nutritivi in grado di conservare il principio attivo
20 sino al momento della sua destinazione finale, garantendo altresì l'integrità morfologico-funzionale dei tessuti interessati.

- Va considerato che il corpo umano è costituito da gran parte di acqua, che l'acqua viene assorbita dalla cute e che la maggior parte dei principi attivi sono solubili o producibili in sospensioni
25 acquose e che l'attività ionica favorisce la migrazione dei principi



attivi attraverso la cute.

Oggetto del presente brevetto è una nuova soluzione per applicazione transdermica per trattamenti curativo-nutritivo, ed inoltre il brevetto comprende anche i dispositivi necessari per tali applicazioni.

La nuova soluzione viene utilizzata principalmente per una particolare docciatura pulsata sul corpo del paziente o sulla zona del corpo del paziente interessata. La soluzione può anche essere ionizzata e/o additivata di opportuni gas al fine di modificare e potenziare le caratteristiche peculiari della soluzione.

I principi attivi da somministrare vengono addizionati in detta soluzione in modo da ottenere un prodotto contenente una sufficiente percentuale di principi attivi.

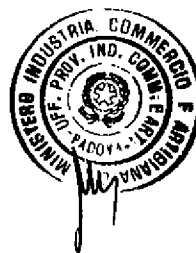
Sostanzialmente la soluzione viene utilizzata come veicolo per l'applicazione e l'immagazzinamento nella cute dei principi attivi da somministrare.

Strutturalmente, la presenza nell'acqua di elettroliti e metaboliti, cambia l'entalpia della soluzione. Infatti l'acqua presenta la struttura di base di un reticolo cristallino in costante aggregazione e disaggregazione che si modifica in relazione alla natura ed all'intensità delle cariche elettriche presenti.

La soluzione è composta da acqua trattata con l'aggiunta dei vari elementi ioni di seguito elencati nelle percentuali preferite:

PO a 37° C 120/172 mmHg

25 PCO a 37° C 4,3/14,3 mmHg



Na+ 19/49 mmol/L

K+ 0,6/1,6 mmol/l

Cl- 18/52 mmol/L

HCO₃- 3,4/7,7 mmol/L

5 Ca++ 16,83/30,56 mg/dL

Mg++ 3,80/7,11 mg/dL

oltre a glucosio da 0 a 13 mg/dL ed Urea da 4,0 a 5,0 mg/dL.

La soluzione deve avere una temperatura di 39/40° C nella fase di trattamento, un pH in miscelazione di 2,8/3,5 ed un pH in uscita a

10 37° C di 7,33/7,45.

L'acqua viene così additivata, prima o dopo la miscelazione con i principi attivi, di gas inerti o attivi in modo da permettere una migliore solubilizzazione (sospensione dei principi attivi), una stabilizzazione degli stessi principi attivi e favorire una migliore

15 permeazione della soluzione nella cute.

Oltre all'addizione di gas è dunque possibile prevedere una ionizzazione della soluzione prima della sua applicazione sulla cute.

La soluzione così ottenuta additivata di gas e/o ionizzata viene

20 spruzzata mediante getto pulsato in pressione sulla cute del paziente, sull'intero corpo o sulla zona di interesse.

La modalità particolare di applicazione docciata favorisce una potente attività riflessogena antidromica sensitiva principalmente sui barocettori periferici cutanei, con secondaria induzione

25 indiretta dell'attività vagotropa e dei suoi effetti neuromodulatori



interagenti sull'asse diencefalo-ipofisiario e corticosurrenalico. Tale stimolazione sensitiva periferica non avviene con i noti metodi di somministrazione farmacologica e fisica transdermica (gel, creme, pomate, cerotti, ultrasonoterapia). Il getto pulsato
5 della soluzione rappresenta un induttore indiretto per un'intensa migrazione delle cellule epidermiche, e una loro proliferazione cellulare mitotica nello strato basale e soprabasale con una persistenza della forma batiprismatica delle cellule degli strati superficiali e di quelli basali. Tali caratteristiche istologiche,
10 associate ad un aumento dello strato malpighiano, testimoniano una vivace induzione proliferativa epidermica. In particolare si ha un effetto biomimetico prolungato nel tempo da parte dell'acqua doccia a carico dello strato corneo dell'epidermide che funge da riserva biologica del principio attivo impiegato favorendone una
15 cessione lenta, graduale e prolungata nel tempo.

Il procedimento di somministrazione a doccia migliora anche l'approccio e la resistenza individuale all'assunzione del farmaco o dell'alimento stesso perché non invasiva ed associata ad una diffusa sensazione di benessere.

20 I dispositivi di espulsione della soluzione possono essere vari ed in particolare si prevede un miscelatore composto da un condotto entro il quale viene immessa la soluzione in pressione e dove all'altro estremo è posto un diffusore. Un serbatoio contenente il prodotto integratore (alimento o medicamento) è posto in
25 collegamento con detto condotto e dove, per effetto Venturi, o



tramite pompa, detto prodotto viene aspirato e miscelato con la soluzione.

L'emmissione della soluzione non in continuo ma a pulsazioni serve a garantire lo scontro fra gli ioni della soluzione con la pelle
5 ed il relativo coinvolgimento atomico fra cariche elettriche.

Dette emissioni a getto a pulsazioni può essere sia a cicli costanti che irregolari.

Queste sono le modalità schematiche sufficienti alla persona esperta per realizzare il trovato, di conseguenza, in concreta
10 applicazione potranno esservi delle varianti senza pregiudizio alla sostanza del concetto innovativo.

Pertanto con riferimento alla descrizione che precede e alla tavola acclusa si esprimono le seguenti rivendicazioni.



RIVENDICAZIONI

1. Soluzione veicolante per l'assorbimento transdermico
caratterizzata dal fatto di essere composta da acqua trattata con
l'aggiunta di elementi di seguito elencati nelle percentuali
5 preferite:
__PO a 37° C 120/172 mmHg
__PCO a 37° C 4,3/14,3 mmHg
__Na+ 19/49 mmol/L
__0,6/1,6 mmol/l
10 __Cl- 18/52 mmol/L
__HCO₃- 3,4/7,7 mmol/L
__Ca++ 16,83/30,56 mg/dL
__Mg++ 3,80/7,11 mg/dL
__oltre a glucosio da 0 a 13 mg/dL ed Urea da 4,0 a 5,0 mg/dL.
- 15 2. Soluzione veicolante per l'assorbimento transdermico, come
da rivendicazione 1, caratterizzata dal fatto di essere ionizzata
prima della sua applicazione sulla cute.
3. Sistema di trattamento con soluzione veicolante per
l'assorbimento transdermico, come da rivendicazione 1, 2,
20 caratterizzato dal fatto di comprendere la spruzzata di detta
soluzione mediante getto non costante, cioè pulsato in pressione
sulla cute del paziente.
4. Dispositivo di espulsione della soluzione come da
rivendicazioni 1,2,3, caratterizzato dal fatto di comprendere un
25 miscelatore composto da un condotto entro il quale viene

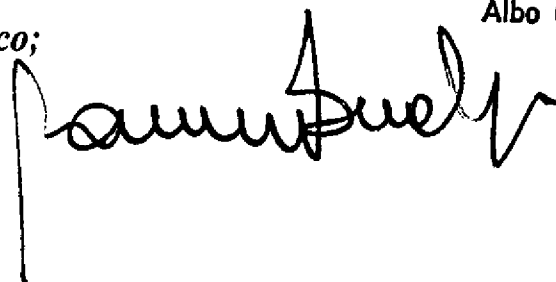


- immessa la soluzione in pressione e dove un serbatoio contenente il prodotto integratore (alimento o medicamento) è posto in collegamento con detto condotto e dove, per effetto Venturi, o tramite pompa, detto prodotto viene aspirato e
- 5 miscelato con la soluzione.

Padova, 2 luglio 1999

MIONI Enrico;

per incarico,



Ing. MAURIZIO BENETTON
Albo Consulenti Propr. Ind.
n. 477

