PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

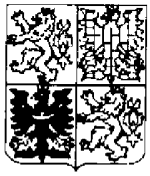
zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(21) Číslo dokumentu:

3723-98

(19)

ČESKÁ REPUBLIKA



ÚŘAD PRŮMYSLOVÉHO VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **19. 05. 97**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **22.05.96**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **96/100168**

(33) Země priority: **GR**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **17. 02. 99 (Věstník č. 2/99)**

(86) PCT číslo: **PCT/GR97/00015**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO 97/44005**

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl.[6]:

A 61 K 7/155

(71) Přihlašovatel:

PROTOPAPA Evangelia, Anixis Attikis, GR;
XENAKIS Aristotelis, Nea Spyrmi Attikis, GR;
AVRAMIOTIS Spyridon, Kalithea Attikis, GR;
SEKERIS Konstantinos, Athens, GR;

(72) Původce:

Protopapa Evangelia, Anixis Attikis, GR;
Xenakis Aristotelis, Nea Spyrmi Attikis, GR;
Avramiotis Spyridon, Kalithea Attikis, GR;
Sekeris Konstantinos, Athens, GR;

(74) Zástupce:

Kendereški Dušan Ing., Lidická 51, Brno, 60300;

(54) Název přihlášky vynálezu:

Mikroemulse na bázi lecitinu obsahující proteolytické enzymy a způsob enzymatické depilace pomocí této mikroemulse

(57) Anotace:

Řešení se týká depilačních přípravků obsahujících proteolytické enzymy rozpuštěné v mikroemulzi, tvořené lecitinem, alifatickým uhlovodíkem, alifatickým alkoholem a ústojným roztokem o pH 7 až 9, kterážto hodnota odpovídá rozsahu pH blízkému optimální hodnotě pH pro katalytickou aktivitu proteolytických enzymů, které jsou aplikovány pro trvalou enzymatickou depilaci. Aplikace těchto přípravků zajišťuje, jak prokázaly zkoušky, mnohem trvalejší depilační účinky, než jaké skýtají jiné depilační metody. Aplikace těchto přípravků vyhovuje pro každý typ pokožky /silně mastné i citlivé, suché/. Vynález přináší použití mikroemulzí jako média usnadňujícího pronikání enzymatické aktivity do epitelových buněk pokožky.

CZ 3723-98 A3

MIKROEMULZE NA BÁZI LECITINU OBSAHUJÍCÍ PROTEOLYTICKÉ ENZYMY A ZPŮSOB DEPILACE POMOCÍ TÉTO MIKROEMULZE.

Oblast techniky

Vynález se týká depilačních přípravků tvořených mikroemulzí na bázi lecitinu obsahující proteolytické enzymy a způsob užití mikroemulzí jako média pro rozpustitelnost proteolytických enzymatických systémů, která napomáhá pronikání aktivních molekul fosfolipidickými membránami. Dále se vynález týká způsobu depilace při němž jsou použity mikroemulzní přípravky obsahující enzym alfa-chymotrypsin nebo enzym trypsin pro depilaci jakéhokoliv typu kůže případně způsobu depilace založeného na postupné aplikaci mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu alfa-chymotrypsin a mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu trypsin, podle zvláštností každého typu kůže. Způsob depilace, při němž jsou použity mikroemulzní přípravky obsahující enzym alfa-chymotrypsin nebo enzym trypsin pro depilaci jakéhokoliv typu kůže i způsob depilace založený na postupné aplikaci mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu alfa-chymotrypsin a mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu trypsin, je prováděn jednoduchým nanášením ve vhodných intervalech.

Dosavadní stav techniky

Experimentální studie, které přihlašovatel zveřejnil jako první v mezinárodní literatuře ukazují, že působení enzymu alfa-chymotrypsin vyvolává destrukci kmenových buněk a vlasových váčků, což vede ke kladným výsledkům depilace. Podobně úspěšné výsledky vlasové depilace vykazuje trypsin, ale s mírnějším účinkem.

Mikroemulze jsou systémy obsahující trvale inertní organické médium, v němž jsou vodní kapičky dispergovány pomocí lecitinu působícího jako přírodní povrchově aktivní činidlo. Disperze vodní fáze s molekulami enzymu alfa-chymotrypsinu nebo trypsinu je dosaženo jednoduchým a jemným protřepáním.

Účelem tohoto vynálezu je zlepšit depilační účinek alfa-chymotrypsinu a trypsinu a dosáhnout jejich použití pro všechny druhy pokožky..

Podstata vynálezu

Předmětný vynález zlepšuje depilační účinky enzymů alfa-chymotrypsin a trypsin jejich aplikací pomocí mikroemulze. Svým charakterem mikroemulze dovoluje jednoduché nanesení na celý povrch kůže, kde má dojít k depilaci. Navíc, použití mikroemulze dovoluje aplikaci prostředku na každý typ pokožky, jako jsou citlivě suché pokožky nebo stále mastné pokožky.

Bylo rovněž zjištěno, že postupná aplikace, kdy je nejprve aplikován mikroemulzní přípravek s obsahem enzymu alfa-chymotrypsinu a poté je aplikován mikroemulzní přípravek s obsahem enzymu trypsin, vyvolává důležitou degradaci vlasových váčků, a že tato postupná aplikace mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu alfa-chymotrypsinu a mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu trypsin má mnohem lepší depilační účinky než lze dosáhnout aplikací pouze jednoho depilačního přípravku obsahujícího jeden z obou enzymů. Dále bylo zjištěno, že postupná aplikace, kdy je nejprve aplikován mikroemulzní přípravek s obsahem enzymu alfa-chymotrypsinu a poté je aplikován mikroemulzní přípravek s obsahem enzymu trypsin, má i při nízkých koncentracích 0,05 mg/ml degradační účinky na vlasové váčky, což dovoluje aplikovat přípravky o nízké koncentraci enzymů na suchá, citlivá místa pokožky. Na druhé straně bylo zjištěno, že užití vysokých enzymových koncentraci na suchou, citlivou pokožku sice způsobuje výraznou depilaci, ale s intenzivním podrážděním pokožky. Proto se doporučuje na takovouto pokožku aplikovat přípravky o nízké koncentraci enzymů. Navíc, užití mikroemulzí jako nosiče pro přenos aktivních makromolekul, jako jsou navrhované enzymy, na pokožku, přináší výrazné zlepšení enzymové depilační metodologie, neboť lecitin, obsažený v mikroemulzi, narušuje fosfolipidické membrány výstelkových buněk a umožňuje tak pronikání enzymů do buněk.

Navrhované enzymy alfa-chymotrypsin a trypsin jsou použity v absolutně čistém stavu. Enzymy jsou skladovány v lyofilizovaném stavu, mrazově sublimované, v mrazícím boxu při teplotě -18 °C, takže zůstávají beze změn,

s vyloučením denaturace. Pro výrobu přípravků jsou enzymy rozpuštěny v roztoku 0,001 M kyseliny chlorovodíkové ve dvojitě destilované vodě o pH 3. Získané koncentrace 1 až 5 mg/ml jsou uchovávány ve sterilním prostředí v mrazícím boxu při teplotě -18 °C. Tímto postupem je aktivita enzymů udržována neměnná po dobu alespoň osmi měsíců.

Současně jsou následujícím postupem připraveny mikroemulze na bázi lecitinu. Pro každý ml konečného roztoku je 0,75 až 1,00 ml alifatického uhlovodíku mixována s 20 až 75 mg lecitinu, 0 až 0,25 ml alifatického alkoholu a 0,005 až 0,05 ml ústojného roztoku, o pH 7 až 9. Smícháním výše uvedených složek, po jemném protřepání je získán čistý roztok - mikroemulze. tento roztok je termodynamicky stálý a má proto neomezenou životnost. Aby se vyloučilo narušení stability možným částečným odpařením organických složek a tím změna složení mikroemulze, je roztok skladován v uzavřené nádobě.

Volba ústojného roztoku k přípravě mikroemulzí s obsahem proteolytických enzymy alfa-chymotrypsin a trypsin je založena na optimální hodnotě pH pro aktivity uvedených enzymů, která ze pohybuje v rozmezí 7,8 až 8,8. jedním z možných ústojných roztoků pro přípravu mikroemulzí na bázi lecitinu je 0,1 M roztok kyseliny tri-hydroxymetylamino-metan-chlorovodíkové pro pH v rozmezí 7,7 až 9,0, může však být použito mnoho dalších ústojných roztoků, vyhovujících uvedenému rozmezí hodnot pH.

Těsně před aplikací přípravků je enzymový roztok smíchán s mikroemulzí na bázi lecitinu pro přípravu konečného produktu, který při uskladnění při teplotě asi 2 až 6 °C, si ponechává své depilační schopnosti nejméně po dobu tří dnů.

Podle navrhovaného provedení tohoto vynálezu, jsou ve sterilních lahvičkách o obsahu 2,5 ml uloženy 2 ml isooktanové mikroemulze na bázi lecitinu, připravené smícháním 1,8 ml isooktanu, 64 mg lecitinu ze sojových bobů, 0,2 ml propanol-1 a buď 0,03 ml ústojného roztoku 0,1 M kyseliny tri-hydroxymetylamino-metan-chlorovodíkové o pH 7,5 až 8 pro přípravu alfa-chymotrypsinu nebo 0,03 ml ústojného roztoku 0,1 M kyseliny tri-hydroxymetylamino-metan-chlorovodíkové o pH 8,5 až 9 pro přípravu trypsinu. V malých sterilních kapsulích, uložených ve zvláštních víčkách výše uvedených lahviček, jsou uchovávány 0,03 ml roztoku obsahujícího buď enzym alfa-chymotrypsin nebo trypsin o koncentraci 3,4 mg/ml. Lahvičky s obsahem

mikroemulze a kapsule jsou ukládány při teplotě 2 až 6 °C. Před použitím přípravků a otevřením lahvičky jsou malým tlakem na víčko kapsule rozlomeny a v nich obsažený enzymatický roztok je smíchán s mikroemulzí obsaženou v lahvičce. Opakovaným protřepáním lahvičky je připravena konečná mikroemulze obsahující enzym alfa-chymotrypsin nebo enzym trypsin o konečné koncentraci 0,05 mg/ml, připravená k použití. Alternativně k malé kapsuli, může být enzymatický roztok před použitím uchováván v samostatné lahvičce obdobně jako roztok mikroemulze. Aplikace finálního přípravku na depilovanou pokožku je provedena ihned poté a opakovaně po následující tři dny. Mezitím jsou přípravky uchovávány v mrazícím boxu při teplotě -18 °C..

Předmětem navrhovaného použití jsou :

a) Přípravky z mikroemulze na bázi lecitinu obsahující enzym alfa-chymotrypsin o koncentraci 0,05 mg/ml a pH 7,5 až 8 a vzhledem k navrhované aplikaci vynálezu o pH 7,8.

b) Přípravky z mikroemulze na bázi lecitinu obsahující enzym trypsin o koncentraci 0,05 mg/ml a pH 8,5 až 9 a vzhledem k navrhované aplikaci vynálezu o pH 8,8.

Pro pokožku silně mastnou se navrhuje postupná aplikace, nejprve mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu alfa-chymotrypsinu a poté mikroemulzního přípravku s obsahem enzymu trypsin, přičemž na oblasti citlivé suché pokožky je navrhována aplikace přípravků s obsahem trypsinu. Je na úvaze specialisty, aby navrhnul použití mikroemulzního přípravku obsahujícího buď alfa-chymotrypsin nebo trypsin pro postupnou aplikaci, případně zvýšení celkového množství některého z obou enzymů v závislosti na typu pokožky.

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Depilační přípravek v tekuté formě, založený na působení proteolytických enzymů rozpuštěných v mikroemulzi a aplikovaných jednoduchým nanášením. Koncentrace enzymů se pohybuje v rozmezí 0,01 až 0,10 mg/ml a mikroemulze sestává ze 40 až 150 ml lecitinu, 1,5 až 2,0 ml alifatického uhlovodíku, 0 až 0,5 ml alifatického alkoholu a 0,01 až 0,10 ml ústojného roztoku o pH 7 až 9, kterýžto rozsah pH je optimální pro aktivitu enzymů.

2. Depilační přípravek v tekuté formě podle nároku 1, vyznačující se tím, že proteolytickým enzymem je alfa-chymotrypsin rozpuštěny v mikroemulzi a aplikovaný jednoduchým nanášením. Koncentrace enzymu je 0,05 mg/ml a mikroemulze obsahuje 64 mg lecitinu, 1,8 ml isooktanu, 0,2 ml propanol-1 a 0,06 ml ústojného roztoku kyseliny tri-hydroxymetylamino-metan-chlorovodíkové o pH 7,5 až 8 kterýžto rozsah pH je optimální pro aktivitu enzymu alfa-chymotrypsin.

3. Depilační přípravek v tekuté formě podle nároku 1, vyznačující se tím, že proteolytickým enzymem je trypsin rozpuštěny v mikroemulzi a aplikovaný jednoduchým nanášením. Koncentrace enzymu je 0,05 mg/ml a mikroemulze obsahuje 64 mg lecitinu, 1,8 ml isooktanu, 0,2 ml propanol-1 a 0,06 ml ústojného roztoku kyseliny tri-hydroxymetylamino-metan-chlorovodíkové o pH 8,5 až 9, kterýžto rozsah pH je optimální pro aktivitu enzymu trypsin.

4. Způsob přípravy depilačních přípravků podle nároků 1 až 3, vyznačující se tím, že 2 ml mikroemulze obsahující 40 až 150 ml lecitinu, 1,5 až 2,0 ml alifatického uhlovodíku, 0 až 0,5 ml alifatického alkoholu a 0,01 až 0,10 ml ústojného roztoku o pH 7 až 9 se uloží ve sterilních lahvičkách o obsahu 2,5 ml. V malých sterilních kapsulích, uložených ve víčkách zmíněných lahviček, se uchovává 0,01 až 0,05 ml proteolytických enzymů o koncentraci asi 1 až 5 mg/ml. Před použitím přípravků a před otevřením lahviček, se lehkým stlačením víčka kapsule rozlomí a v ní obsažený enzymatický roztok se smíchá s mikroemulzí obsaženou v lahvičce. Opakovaným protřepáním lahvičky se získá finální depilační prostředek připravený k aplikaci. Alternativně k malé kapsuli se

enzymatický roztok může uchovávat v samostatné lahvičce a smíchat s mikroemulzí obdobným způsobem těsně před použitím.

5. Způsob depilace určitého typu pokožky, vyznačující se tím, že se aplikuje depilační přípravek podle nároku 2.

6. Způsob depilace pokožky suchého a citlivého typu, vyznačující se tím, že se aplikuje depilační přípravek podle nároku 3.

7. Způsob depilace pokožky silně mastného typu, vyznačující se tím, že se postupně aplikuje nejprve depilační přípravek podle nároku 2 a poté se následně aplikuje depilační přípravek podle nároku 3.