



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENÍU

230874
(11) (B1)

(22) Prihlásené 02 08 82
(21) (FV 5758-82)

(40) Zverejnené 13 01 84

(45) Vydané 15 11 86

(51) Int. Cl.³
A 61 K 31/69
A 61 K 33/38

[75]

Autor vynálezu

LEŽOVIČ JÁN prof. MUDr. DrSc., MEDVEĎ JÁN RNDr. CSc.,
KOPŘIVOVÁ SERAFÍNA RNDr PhMr., FILAK MIREK ing.,
KOUDÉLKOVÁ LÝDIA MUDr., KÁŠA JOZEF MUDr.,
HUDAČ ALEXANDER RNDr. CSc., BRATISLAVA

(54) Farmaceutický alebo kozmetický prípravok obsahujúci antibakteriálnu zložku

1

2

Farmaceutický alebo kozmetický prípravok obsahujúci antibakteriálnu zložku, nosič a pomocné látky vyznačuje sa tým, že ako antibakteriálnu zložku obsahuje 10^{-5} až 10^{-1} hmot. % amokomplexných zlúčenín kyseliny hydroboritej a jej derivátov vo vodnom alebo vodnoetanolickom roztoku, ktorý obsahuje 0,01 až 40 hmot. % alkyldiolov alebo alkyltriolov a 0,01 až 5 hmot. % nízkomolekulárnych karboxylových kyselín.

Antibakteriálna zložka prítomnými alkyl-diolmi a alkyltriolmi vytvára hydratované komplexy, čím stabilizuje účinnosť amokomplexných strieborných zlúčenín kyseliny hydroboritej a jej derivátov.

V oblasti pH od 5—8,5 čo sa dosahuje karboxylovými kyselinami, zvyšuje sa adhezivita farmaceutických a kozmetických prípravkov na pokožku a sliznicu a je ďalej zvýšená ich difúzna účinnosť do tkáni a tým i ich preventívne a liečivé účinky.

Vynález sa týka farmaceutického alebo kozmetického prípravku obsahujúceho antibakteriálnu zložku na prevenciu a liečenie zápalistých procesov kože a sliznice.

V súčasnosti sa vo farmácii, v stomatológii a kozmetike používa celý rad preventívnych a liečivých prostriedkov na zápaly sliznice a kože, avšak nie s uspokojivo očakávanými výsledkami. Napr. na zabránenie kazivosti zubov sa používajú rôzne druhy lakov, tzv. pečatenie zubov. Nevýhodou tohto spôsobu je veľká pracnosť. Medzi najrozšírenejšie preventívne prostriedky a metódy v súčasnosti používané proti vzniku zubného kazu sú rôzne spôsoby fluoridácie pitnej vody, kuchynskej soli, mlieka a pod. Vyrába sa tiež široká škála zubných pást s obsahom fluorových zlúčenín.

Súčasný stav liečenia zápalu kože a slizníc sa robí pomocou amokomplexných strieborných zlúčenín kyseliny hydroboritej a jej derivátov (Čs AO č. 209 390 a Čs AO číslo 212 431), ďalej rôznymi dezinfekčnými prostriedkami — propolisom (L. Adamčík et al.), preparáty, ktoré obsahujú rastlinné trieslivá (allantoin, azulen a pod.), koncentrát E-vitamínu a pod. Prevažná väčšina dezinfekčných prostriedkov má však kontaminujúce účinky na sliznicu a krátkodobý účinok.

Vyššie uvedené nedostatky sú odstránené podľa vynálezu využitím synergizmu trojboritanu tridiamostrieborného alebo štvorboritanu diamostrieborného v kombinácii s alkyldiolmi, resp. alkyltriolmi. Spolupôsobenie zvyšuje difúziu účinnosť do tkáni. Prejavujú zlepšené účinky pri liečení kožných a slizničných (vaginárnych) ochorení. Majú zvýšenu bakterioaglutinačnú schopnosť, schopnosť usmrcovať baktérie, preto výrobky s ich obsahom majú zlepšené účinky pri liečení kožných a slizničných ochorení.

Uvedená účinnosť antibakteriálnej zložky je závislá na pH, ktoré sa pohybuje od 5 do 8,5. Táto oblasť sa dosiahne pridaním nízkomolekulárnych karbonových kyselín.

Príklady použitia:

1. Prípravky na prevenciu, hygienu a liečenie dutiny ústnej (zubné pasty, ústné vody a pod.)

Ústna voda s antibakteriálnou zložkou:	
lieh rafinovaný jemný 96,4 %-ný	57,540
štvorboritan diamostrieborný 5 %-ný	
etanolický roztok	0,060
glycerín podľa ČSN	20,000
kyselina mliečna	0,010
sacharín	0,040
vonná a chuťová kompozícia	6,500
menthol	0,030
voda destilovaná	15,820

100,000 %

2. Čípky, masti, obklady, roztoky a pod.

trojboritan tridiamostrieborný	0,060	%
propylenglykol	28,000	
kyselina propionová	0,010	
základná čípková masa (alebo masťový základ	ad	
	100,000	
(poťazne na obklady a roztoky 30 %-ný lieh rafinovaný jemný)		

3. Pleťové vody, vody pred a po holení

lieh rafinovaný jemný 96,4 %-ný	68,640	%
5 %-ný alkoholický roztok		
štvorboritanu diamostrieborného	0,060	
glycerín	18,000	
vonná kompozícia	2,200	
destilovaná voda	11,090	
kyselina mliečna	0,010	
	100,000	%

4. Pleťové krémy, emulzie, krémy na ruky, pleťové masky — obklady a pod.

kakaové maslo	10,000	%
včelí vosk	4,000	
slnečnicový olej	20,000	
vaselína biela	25,640	
eucerín	10,000	
lanolín	3,000	
5 %-ný roztok alkoholický trojboritanu tridiamostrieborného	0,060	
glycerín farmaceutický	3,000	
kyselina mliečna	0,020	
vonná kompozícia	0,250	
konzervans	0,100	
voda destilovaná	32,930	
	100,000	%

5. Teloové dezodoranty a pod.

5 %-ný alkoholický roztok štvorboritanu diamostrieborného	0,060	%
propylenglykol	0,250	
kyselina propionová	0,010	
vonná kompozícia	0,250	
lieh dehydrovaný	99,430	
	100,000	%

teloové dezodoranty možno prakticky aplikovať s mechanickým rozprašovačom, alebo plniť ako aerosol (s freonmi) v pomere

teloový dezodor (roztok)	50	%
freon 12	50	%
	100	%

Pri výrobnom postupe kozmetických a farmaceutických emulzných prípravkov je potrebné komponenty tukového základu po zohriatí na teplotu cca 80 °C zhomogenizovať s vodnými zložkami, čo s výhodou umožňuje prítomnosť alkyldiolov a alkyltriolov. Tieto vytvárajú hydratované komplexy, čím stabilizujú účinnosť antibakteriálnej zložky. Synergizmus antibakteriálnej zložky sa prejaví zvýšením adhezivít týchto prípravkov na sliznicu a pokožku.

Antibakteriálny účinok bol testovaný na širokú škálu anaerobných a aerobných bakteriálnych plakov, uhynutie baktérií nastalo za 20 sekúnd. Ku kontaminácii tkáni ústnej dutiny nedošlo.

Baktericídny účinok na širokú škálu anaerobných a aerobných baktérií plaku aplikáciou 10^{-4} — 10^{-2} %-ného samotného roztoku trojboritanu tridiamostrieborného v 15 až 40 %-nom liehu, podľa AO č. 209 390 a Čs. AO 212 431, nastal za 30 sekúnd.

Využitie tejto baktericídnej zložky se neobmedzuje len na príklady tu uvedené, ale má širšie uplatnenie vo farmaceutických výrobkoch pri liečení kožných a slizničných zápaloch (akne a pod.), kde môže byť aplikovaný priamo na postihnuté miesta, prípadne po pridaní k doplnkovým zložkám tekutých, masťových, suspenzných, práškových alebo tabletkových. Teda využitie vynálezu je dôležité z hľadiska hygienického a preventívneho.

PREDMET VYNÁLEZU

1. Farmaceutický alebo kozmetický prípravok obsahujúci antibakteriálnu zložku, nosič a pomocné látky, vyznačujúci sa tým, že ako antibakteriálnu zložku obsahuje 10^{-5} až 10^{-1} hmot. % štvorboritanu diamostrieborného alebo trojboritanu tridiamostrieborného, 0,01 až 40 hmot. % alkyldiolov alebo alkyltriolov s počtom uhlíkov 2 až 5 a 0,01 až 5 hmot. % slabých karboxylových kyselín, vzťahnuté na hmotnosť prípravku.

2. Farmaceutický alebo kozmetický prípravok podľa bodu 1, vyznačujúci sa tým, že alkyldiolom alebo alkyltriolom je propylen-glykol alebo glycerín.

3. Farmaceutický alebo kozmetický prípravok podľa bodu 1, vyznačujúci sa tým, že slabou karboxylovou kyselinou je s výhodou kyselina propionová, kyselina mliečna alebo kyselina citrónová.