



(12)

BREVET DE INVENȚIE

(21) Nr. cerere: **a 2009 00352**

(22) Data de depozit: **05.05.2009**

(45) Data publicării mențiunii acordării brevetului: **30.03.2012** BOPI nr. 3/2012

(41) Data publicării cererii:
30.11.2010 BOPI nr. 11/2010

(73) Titular:
• **ZANOSCHI I. CHRISTACHE, STR.PINULUI
NR.9, IAȘI, IS, RO**

(72) Inventatori:
• **ZANOSCHI I. CHRISTACHE, STR.PINULUI
NR.9, IAȘI, IS, RO**

(56) Documente din stadiul tehnicii:
**AGENDA MEDICALĂ, P.1114, 2003;
JP 2001048759 (A)**

(54) **ȘAMPON ANTISEBOREIC**



RO 125821 B1

1 Invenția se referă la realizarea unui șampon pentru tratamentul seboreei pielii capului
și pentru oprirea căderii părului de la nivelul pielii capului.

3 **Agenda Medicală 2003, pag. 1114 (D1)** descrie spironolactona ca având acțiuni de
diuretic antialdosterenic (prin antagonism competitiv), crește eliminarea urinară a sării și
5 apei, scade eliminarea potasiului, a ionilor de hidrogen și a amoniului.

7 **JP 2001048759 (A) (D2)** descrie obținerea unei compoziții pentru curățarea părului
scalpului și tratament antiseboreic prezentând un efect antiseboreic îmbunătățit. Această
9 compoziție pentru curățarea părului și a scalpului și tratamentul antiseboreic conține cel puțin
un agent antiseboreic selectat dintre săruri de piridintionină, cel puțin 1% în greutate, din cel
puțin un amid hidroxilic și cel puțin un agent tensioactiv selectat dintr-un agent neionic de tip
11 alchil(poli)glicozida și un agent tensioactiv într-un mediu apos.

13 Problema pe care o rezolvă invenția este realizarea unui șampon antiseboreic pentru
tratamentul seboreei pielii capului și pentru oprirea căderii părului de la nivelul pielii capului.

15 Șamponul antiseboreic este constituit din: 20...45 apă, 3...12 părți laureat sulfat de
sodiu, 0,5...1,2 părți cocamid DEA, 0,8...1,8 părți *Calendula officinalis*, 1...1,18 părți *Aloe*
17 *barbadensis*, 1...3 părți clorură de sodiu, 0,002...0,009 părți spironolactonă, 0,3...0,9 părți
alcool etilic, 0,50...1,50 părți imidazolidinil uree, 0,20...0,75 părți poliquaterium, 0,20...90 părți
perition zinc, părțile fiind exprimate în greutate.

19 Prin aplicarea invenției, se obține avantajul obținerii unui beneficiu local maxim, cu
absența efectelor secundare sistemice.

21 Sindromul seboreic are la bază o disfuncție a foliculului pilosebaceu, produsă de
intervenția unor factori care determină creșterea secreției sebacee. Acest sindrom este
23 determinat de tulburări hormonale, particularități morfologice ale foliculului pilosebaceu și
factori secundari ai secreției sebacee crescute, și anume: dezvoltarea florei microbiene
25 saprofite și lipoliza secundară.

1 .Tulburările hormonale și particularitățile morfologice ale foliculului pilosebaceu.

27 a) Tulburările hormonale. La pubertate are loc o creștere a sintezei de hormoni
androgeni, datorită activării testiculului, ovarului și suprarenalei de către hipofiză și de către
29 hipotalamus, ca urmare a unor factori genetici prestabiliți. Glandele sebacee fiind un veritabil
receptor al hormonilor androgeni reacționează prin producerea de sebum. Importanța
31 factorului endocrin a fost sugerată de o serie de aspecte clinice, ca: absența seboreei înainte
de pubertate, absența ei la castrați sau la bolnavi cu hipogonadism, asocierea seboreei cu
33 o serie de sindroame virilizante la femeie. Hipersecreția androgenică determină o creștere
a secreției sebacee și o hipercheratoză a ostiumului folicular care constituie factorul principal
35 în apariția sindromului seboreic.

37 b) Particularitățile funcționale și morfologice ale foliculului pilosebaceu. Se consideră
că la baza apariției seboreei există o predispoziție ereditară morbidă; disfuncția foliculului
pilosebaceu implicând atât formarea locală de hormoni androgeni chiar la nivelul celulelor
39 sale, cât și o receptivitate mai mare față de acești hormoni, fapt care explică apariția sindro-
mului seboreic și în prezența unor niveluri normale de hormoni androgeni circulanți. Hiper-
41 sensibilitatea celulelor foliculare explică și de ce glandele sebacee sunt foarte dezvoltate,
având o capacitate secretorie de peste 20 de ori mai mare decât în condiții normale. For-
43 marea hormonilor androgeni de către foliculul pilosebaceu este argumentată de activitatea
enzimatică crescută a 3-beta-hidroxisteroid-dehidrogenază, care intervine în reacțiile de
45 oxidoreducere a hormonilor androgeni, reacții care transformă delta-4-andro-stendionul
produs de suprarenală în dehidrotosteron, care se consideră că este de aproape 20 de
47 ori mai activ decât testosteronul. De asemenea, tot în foliculul pilosebaceu s-a pus în
evidență 5-alfa-reductaza, enzimă care transformă testosteronul liber în metabolitul său

RO 125821 B1

activ, dehidrotosteronul (D.H.T.). Acesta se cuplează cu o proteină citoplasmatică care îl transportă în nucleu, unde intervine în procesele complexe de biosinteză ale glandelor sebacee. 1
3

2. Factorii secundari secreției sebacee crescute. Hipersecreția de androgeni și hipersensibilitatea foliculului pilosebaceu determină dezvoltarea exagerată a glandelor sebacee și o hipertrofie a acestora, urmată de blocarea fluxului sebumului din folicul. Retenția de sebum determină apariția unor condiții de anaerobioză care favorizează dezvoltarea florei microbiene (*Propio bacterium acnes* și *Stafilococcus epidermitis*). Acești germeni sintetizează enzime lipolitice care produc liza sebumului cu eliberare de acizi grași liberi (C8-C14) care sunt deosebit de iritanți și inițiază procesul inflamator în seboree și în acnee. Acizii grași liberi în exces produc iritația pielii și reacții inflamatorii locale, care cresc secreția glandelor sebacee, o întrețin și o agravează. Ulterior, prin distensia duetelor și a foliculilor, se ajunge la alterarea și distrugerea peretelui lor și scurgerea conținutului foliculilor în derm, ceea ce are drept consecință producerea unui infiltrat inflamator similar reacției de corp străin, keratină și sebum, comportându-se ca atare. Pe de altă parte, germenii pot ei însăși să genereze reacții inflamatorii prin secreția de enzime producătoare de inflamații (proteaze și amilaze), care activează complementul și macrofagele și mai ales exercită un chimiotactism pentru leucocitele neutrofile. Aportul crescut de neutrofile în jurul foliculului afectat este urmat de eliberarea de collagenaze și elastaze, ceea ce are drept rezultat creșterea reacției inflamatorii. Vindecarea acestei reacții inflamatorii este cicatriceală cu distrugerea foliculului pilosebaceu, fapt care explică de ce odată instalată alopecia, rămâne definitivă. În agravarea seboreei mai intervin o serie de alți factori, ca: suprainfecția cu germeni piogeni, aplicații de preparate grase, preparate cortizonice, detergenți, medicamente pe bază de iod, brom, barbiturice, alimente condimentate. 5
7
9
11
13
15
17
19
21
23

Șamponul pentru tratamentul seboreei și pentru oprirea căderii părului de la nivelul pielii capului pe care și-a propus să-l dezvolte invenția este constituit pentru o porție din: apă 20...45 părți, de preferință 34,68 părți, sulfat laureat de sodiu 3...12 părți, de preferință 8,4 părți, cocamide DEA 0,5...1,2 părți, de preferință 0,7 părți, *Calendula officinalis* 0,8...1,8 părți, de preferință 1,12 părți, *Aloe barbadensis* 1...1,8 părți, de preferință 1,4 părți, clorură de sodiu de 1...3 părți, de preferință 2,1 părți, spironolactonă 0,002...0,009 părți, de preferință 0,007 părți, alcool etilic 0,3...0,9 părți, de preferință 0,7 părți, imidazolidinil uree 0,50...1,50 părți, de preferință 0,105 părți, poliquaterium 0,20...0,75 părți, de preferință 0,35 părți, zinc perition 0,20...90 părți, de preferință 0,35 părți, părțile fiind exprimate în greutate. 25
27
29
31
33

Prin folosirea șamponului pentru tratamentul seboreei pielii capului și pentru oprirea căderii părului de la nivelul pielii capului conform invenției se realizează: 35

- Interceptarea acțiunii hormonilor androgeni și a metaboliților lor la nivelul receptorilor hormonal și androgeni ai foliculului pilosebaceu. În acest scop s-a folosit spironolactonă cunoscută în practica farmaceutică prin acțiunea sa antidiuretică; spironolactonă are o structură chimică asemănătoare hormonilor steroizi, nucleul de bază fiind ciclopentano-perhidrofenantrenic. Așadar, spironolactona este un steroid sintetic care în afară de acțiunea sa diuretică este folosită și ca agent antiandrogen în tratamentul sindromului adrenogenital și a virilismului pilulos. În calitatea sa de substanță antiandrogenă, spironolactona acționează atât în administrări generale, dar și administrare locală, mecanismul său de acțiune fiind blocarea receptorilor androgeni de la nivelul foliculului pilosebaceu, care sunt puși în incapacitatea de a acționa. 37
39
41
43
45

RO 125821 B1

1 - Tratamentul proceselor inflamatorii locale subclinice, stimularea vascularizației
locale și a regenerării foliculului pilosebaceu.

3 - Oprirea căderii părului.

- Acțiune bacteriostatică, degresantă și cheratolitică.

5 Se realizează un beneficiu local maxim cu efecte secundare sistemice absente.

Șamponul antiboreic pe care îl propune invenția împiedică astfel acțiunea hormonilor
7 androgeni sau a metaboliților acestora, asupra glandelor sebacee de la nivelul pielii capului.

Efectul clinic este important și eficient: după o lună sau o lună jumătate de aplicare a
9 șamponului. După folosirea șamponului antiboreic, se observă absența mătreații și oprirea
totală a căderii părului. Cum secreția glandelor sebacee și sudoripare este oprită doar prin
11 acțiunea locală a șamponului, fără a influența efectele sistemice fiziopatologice care
cauzează sindromul acneic, se înțelege că în absența administrării acestuia, după un timp
13 variabil, manifestările locale specifice sindromului seboreic reapar.

În continuare, se dă un exemplu de realizare a șamponului.

15 Într-un reactor se pune laureat sulfat de sodiu 3...12 părți, de preferință 8,4 părți,
clorură de sodiu 1...3 părți, de preferință 2,1 părți, apă 20...45 părți, de preferință 34,68 părți,
17 care se încălzesc, se amestecă până la omogenizare completă. În alt vas se prepară
spironolactonă 0,002...0,009 părți, de preferință 0,007 părți, cu alcoolul etilic 0,35...0,95 părți,
19 de preferință 0,7 părți, care apoi se aduc în reactor sub agitare continuă; în alt vas se iau și
se dizolvă cocamide DEA 0,5...1,2 părți, de preferință 0,7 părți, care apoi se aduc în reactor.
21 *Calendula officinalis* 0,8...1,8 părți, de preferință 1,12 părți, *Aloe barbadensis* 1...1,8 părți,
de preferință 1,4 părți, spironolactonă 0,002...0,009 părți, de preferință 0,007 părți, alcool
23 etilic 0,3...0,9 părți, de preferință 0,7 părți, imidazolidinil uree 0,50...1,50 părți de preferință
0,105 părți, poliquateriu 0,20...0,75 părți, de preferință 0,35 părți, peritionină de zinc
25 0,20...90 părți, de preferință 0,35 părți, se aduc în porții mici în vasul reactor sub agitare
continuă. Se agită amestecul în continuare încă o oră, după care șamponul astfel pregătit
27 se îmbuteliază în flacoane din plastic.

Efectele șamponului conform invenției sunt următoarele:

29 - este un produs care are ca substanță activă spironolactona care acționează ca
substanță antiandrogenă locală. Având în vedere că absorbția sistemică este infinitesimală,
31 efectele la distanță sistemică sunt absente;

- are acțiune degresantă, keratolitică și bacteriostatică prin imidazolizidin urea și zinc
33 perition;

- stimulează pilogeneza prin extractele de *Alloe barbadensis* și *Callendula officinalis*;

35 - imidalozidin urea are și un larg efect antimicrobian, antimicotic și antiparazitar fapt
care conferă noi posibilități terapeutice șamponului mai sus menționat;

37 - zinc perition-ul are acțiune stimulantă asupra foliculului pilosebaceu, fapt ce explică
oprirea completă a căderii părului sub acțiunea șamponului realizat conform invenției.

RO 125821 B1

Revendicări

1. Șampon antiseboreic, **caracterizat prin aceea că** este constituit din: 20...45 apă, 3...12 părți laureat sulfat de sodiu, 0,5...1,2 părți cocamid DEA, 0,8...1,8 părți *Calendula officinalis*, 1...1,8 părți *Aloe barbadensis*, 1...3 părți clorură de sodiu, 0,002...0,009 părți spironolactonă, 0,3...0,9 părți alcool etilic, 0,50...1,50 părți imidazolidinil uree, 0,20...0,75 părți poliquaterium, 0,20...90 părți perition zinc, părțile fiind exprimate în greutate. 1
2. Șampon antiseboreic, conform revendicării 1, **caracterizat prin aceea că** este constituit din: 34,68 părți apă, 8,4 părți laureat sulfat de sodiu, 0,7 părți cocamid DEA, 1,12 părți *Calendula officinalis*, 1,4 părți *Aloe barbadensis*, 2,1 părți clorură de sodiu, 0,007 părți spironolactonă, 0,7 părți alcool etilic, 0,105 părți imidazolidinil uree, 0,35 părți poliquaterium, 0,35 părți zinc peritionă, părțile fiind exprimate în greutate. 3 5 7 9 11



Editare și tehnoredactare computerizată - OSIM
Tipărit la: Oficiul de Stat pentru Invenții și Mărci
sub comanda nr. 154/2012