



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11) Número de publicación: 2 375 350

51 Int. Cl.:		
A01N 31/16	(2006.01) D06M 13/144	(2006.01)
A61K 8/33	(2006.01) D06M 13/148	(2006.01)
A61K 8/34	(2006.01) D06M 13/152	(2006.01)
A61Q 19/00	(2006.01) D06M 13/165	(2006.01)
C11D 3/20	(2006.01) D06M 13/188	(2006.01)
C11D 3/24	(2006.01) D06M 13/192	(2006.01)
C11D 3/34	(2006.01) D06M 13/203	(2006.01)
C11D 7/26	(2006.01) D06M 13/207	(2006.01)
C11D 7/28	(2006.01) D06M 13/256	(2006.01)
C11D 7/34	(2006.01) A61Q 17/00	(2006.01)

$\widehat{}$,	
12)	TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA	Δ

T3

- (96) Número de solicitud europea: 02002043 .4
- 96) Fecha de presentación: **22.05.1997**
- (97) Número de publicación de la solicitud: **1201229** (97) Fecha de publicación de la solicitud: 02.05.2002
- (54) Título: FORMULACIONES LÍQUIDAS CONCENTRADAS QUE COMPRENDEN UN INGREDIENTE MICROBICIDAMENTE ACTIVO.
- (30) Prioridad: 04.06.1996 CH 140396

(73) Titular/es: **BASF SE**

67056 LUDWIGSHAFEN, DE

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI: 29.02.2012

(72) Inventor/es:

Ochs, Dietmar y Schnyder, Marcel

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente: 29.02.2012

(74) Agente: Carvajal y Urquijo, Isabel

ES 2 375 350 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCION

Formulaciones líquidas concentradas que comprenden un ingrediente microbicidamente activo

La presente invención se refiere a formulaciones líquidas que comprenden ingredientes microbicidamente activos, al uso de estas formulaciones como ingrediente farmacológicamente activo en productos cosméticos, artículos de uso doméstico o desinfectantes para las manos, y al uso como conservantes en artículos de uso doméstico y productos cosméticos.

La US-A-5.403.864 describe una composición antimicrobiana que comprende de 0,5 a 3,0% en peso aproximadamente de triclosan, de 0,5 a 2,0% en peso aproximadamente de cloroxifenol y de 40 a 70% en peso aproximadamente de un alcohol.

La EP-A-0.259.249 describe preparados y usos de los mismos para la desinfección de piel y manos. La referencia describe que los hidroxibifeniléteres halogenados con considerados como no solubles en cantidades proporcionalmente pequeñas de etanol, propanol, isopropanol o propilenglicol.

La WO 93/07250 describe una composición de limpieza antiséptica que comprende un alcanol y un concentrado acuoso de un surfactante. La composición puede también comprender un biocida. El surfactante es un componente esencial en esta composición.

La WO 96/06152 describe formulaciones de jabón surfactantes que comprenden (a) 0,01 a 0,2% en peso de una sustancia activa microbicida, (b) 0,1 a 7,5% en peso de uno o más de un agente hidrotrópico, (c) 0 a 2% en peso de uno o más de una sustancia surfactante sintética o de un jabón o de una combinación de dichas sustancias y/o una sal de un ácido graso C₈-C₂₂ saturado y/o insaturado; (d) 0 a 10% en peso de un alcohol dihídrico; (e) 0 a 70% en peso de un alcohol monohídrico; y (f) agua de la red o agua desionizada para completar el 100%.

La CH 604523 describe una formulación antimicrobiana sinérgica que comprende o-hidroxidifeniléter, un surfactante solubilizante y opcionalmente un disolvente tal como agua.

La presente invención se refiere a formulaciones líquidas concentradas (b) que comprenden

(b₁) 10 a 25% en peso de un ingrediente microbicidamente activo de fórmula (1)

25

35

5

15

20

en donde

Y es cloro o bromo,

Z es SO₂H, NO₂ o alquilo C₁-C₄,

r es 0 a 3,

30 o es 0 a 3,

p es 0 o 1,

m es 0 o 1 y

n es 0 o 1,

- (b₂) 10 a 70% en peso de cumenosulfonato,
- (b₃) 10 a 50% en peso de ácido láctico,

(b₄) 5 a 75% en peso de 1,2-propanodiol y

agua hasta completar el 100%.

Compuestos especialmente interesantes de fórmula (1) son aquellos en donde

Y es cloro o bromo.

5 m es 0.

n es 0 o 1,

o es 1 o 2.

res 1 o 2 y

p es 0.

10 Compuestos muy especialmente interesantes de fórmula (1) son aquellos en donde

Y es cloro.

m es 0,

n es 0,

o es 1,

15 res 2 y

20

25

p es 0.

Muy especialmente preferido es el compuesto de fórmula

El ácido láctico, que se emplea de acuerdo con la invención, puede también emplearse preferentemente en forma de sus sales de metales alcalinos o sales amónicas solubles en agua.

Las formulaciones líquidas de acuerdo con la invención se emplean como ingrediente activo en productos cosméticos, por ejemplo desodorantes, limpiadores, lociones/cremas, en artículos de uso doméstico, por ejemplo como un aditivo en líquidos de lavado, detergentes líquidos de uso doméstico; como un aditivo en productos para la higiene dental, por ejemplo en colutorios o pastas de dientes, o como un ingrediente antimicrobialmente activo para superficies duras y blandas, por ejemplo polímeros, papel, textiles y, en particular, la piel humana.

Las formulaciones líquidas de acuerdo con la invención son además también adecuadas como conservantes para productos cosméticos y artículos de uso doméstico.

Igualmente, también son útiles como desinfectantes para materiales de fibras textiles.

Las formulaciones líquidas de acuerdo con la invención se preparan disolviendo el componente (b₁) en el componente (b₄), añadiendo los componentes (b₂) y (b₃) a la solución resultante, con agitación, completando la solución resultante con agua desionizada hasta 90-95% del volumen final, si es adecuado ajustando el pH con una base cosméticamente aceptable, por ejemplo mono- o dietanolamina, y completando la mezcla con agua desionizada hasta un volumen final de 100%.

El ingrediente microbicidamente activo disuelto puede ser incorporado en productos cosméticos y artículos de uso

doméstico sin inconveniente alguno. El ingrediente activo, que de por sí es pulverulento, se ofrece al usuario en forma disuelta. De este modo deja de ser ya necesario una predisolución consumidora de tiempo en disolventes adecuados mientras se aporta calor.

Además, las formulaciones líquidas de acuerdo con la invención se distinguen por una acción antimicrobiana sinérgica (véase ejemplo 4) y por una buena estabilidad en almacenamiento.

Los ejemplos, que siguen, ilustran la preparación de las formulaciones líquidas de acuerdo con la invención. Las partes son partes en peso.

Ejemplos de preparación de las formulaciones líquidas concentradas

Ejemplo 1:

5

15

10 10 partes del compuesto de fórmula (101) y

5 partes de 1,2-propanodiol se pesan en un recipiente y se agita a temperatura ambiente.

40 partes de ácido láctico se añaden. El pH se lleva a un valor de 3 a 4 por adición de etanolamina.

30 partes de cumenosulfonato sódico y

10 partes de agua desionizada se añaden en la secuencia anterior y se continúa la agitación hasta que se disuelven todos los constituyentes. La mezcla se completa a 100 partes con agua desionizada.

Ejemplo 2: Detección de la actividad microbicida en el ensayo de suspensión

Microorganismos

Staphylococcus aureus ATCC 9144

de ensayo:

Enterococcus faecium ATCC 10541

Escherichia coli ATCC 10536 Pseudomonas aeruginosa CIP A-22 Candida albicans

ATCC 10231

Medios nutrientes:

Caldo de caseína peptona de harina de soja para el crecimiento del inóculo

Agar de caseína peptona de harina de soja con 3% de monooleato de polioxietileno

(20) sorbitán; 0,3% de lecitina; 0,1% de L-histidina

Medio de dilución:

Caldo de tripticasa peptona de harina de soja con 10% de monooleato de polioxietileno

(20) sorbitán; 3% de lecitina; 0,1% de L-histidina y 0,5% de tiosulfato sódico.

a. Uso de la formulación del ejemplo 1 como desinfectante

Estos ensayos demuestran que las formulaciones líquidas de acuerdo con la invención presentan una actividad microbicida muy potente, incluso a bajas concentraciones. Estas propiedades son importantes para desinfectantes en general, pero en particular para la desinfección de textiles.

Procedimiento:

Se diluyen 0,1 ml de la formulación del ejemplo 1 con 8,9 ml de agua y la dilución se trata posteriormente con 1 ml de una dilución 1:10 de un cultivo de la bacteria de ensayo que se incuba durante 16 a 24 horas a 37° C.

La concentración de los organismos de ensayo en el lote es de 10⁸ microorganismos /ml.

El lote se mezcla a fondo y posteriormente se incuba durante 5 minutos a temperatura ambiente con agitación suave.

Después de 5 minutos, se separa 1 ml del lote y se determina el recuento de bacterias vivas. Para este fin, se llevan a cabo diluciones en el medio de dilución y se efectúan deposiciones de 0,1 ml de cada uno de estas diluciones

sobre los medios de agar.

El recuento de bacterias vivas se determina una vez que las placas han sido incubadas durante 24 a 48 horas a 37º C contando las colonias teniendo en cuenta el factor de dilución.

Los resultados del ensayo se muestran en la tabla 1.

Tabla 1						
Lote	Reducción en el recuento bacterial después de 5 minutos (log)					
	S. aureus ATCC 9144	Ent. faecium ATCC 10541	E. coli ATCC 10536	P. aeruginosa CIP A-22		
Agua	0	0	0	0		
1% formulación 6	> 10 ⁵	> 10 ⁵	> 10 ⁵	> 10 ⁵		

5

La formulación ensayada del ejemplo 41 muestra una reducción de todos los microorganismos del ensayo de al menos 5 potencias de 10 después de un tiempo tan pequeño como 5 minutos en el ensayo de suspensión.

Ejemplo 3: Preparación de un producto lavavajillas

7% de laurilsulfato sódico

10 7% de miret sulfato sódico

4% de laurilglucósido

1% de cocamidopropilbetaína

1% de la formulación del ejemplo 4

1% de cloruro sódico

15 0,02% de dibromodicianobutano

0,08% de fenoxietanol

78,9% de agua

Preparación:

20

Se mezcla laurilsulfato sódico con miret sulfato sódico y laurilglucósido y se disuelve en 30 partes de agua. Se añade la formulación del ejemplo 1 y se homogeniza. Se añaden cocamidopropilbetaína, cloruro sódico, dibromodicianobutano y fenoxietanol.

El pH se ajusta a 6,0 con ácido cítrico. Se añade agua para completar 100 partes.

Ejemplo 4: Preparación de un desinfectante para textiles

50% de las formulaciones del ejemplo 1

25 10% de poliglicoléter de alcohol laurílico

hasta 100% de agua

El pH se lleva a 5 con monoetanolamina.

REIVINDICACIONES

- 1. Una formulación líquida concentrada (b) que comprende
- (b₁) 10 a 25% en peso de un ingrediente microbicidamente activo de fórmula

5 en donde

Y es cloro o bromo,

Z es SO₂H, NO₂ o alquilo C₁-C₄,

r es 0 a 3,

o es 0 a 3,

10 p es 0 o 1,

m es 0 o 1 y

n es 0 o 1,

- (b₂) 10 a 70% en peso de cumenosulfonato,
- (b₃) 10 a 50% en peso de ácido láctico,
- 15 (b₄) 5 a 75% en peso de 1,2-propanodiol y

agua hasta completar el 100%.

2. Una formulación líquida según la reivindicación 1, en donde el componente (b₁) tiene la fórmula