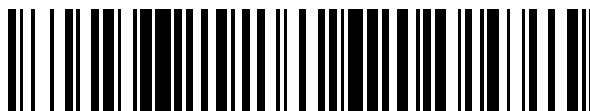


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 440 322**

51 Int. Cl.:

A01N 43/40 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

A01N 25/10 (2006.01)

A01N 25/24 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **11.03.2010 E 10710677 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **02.10.2013 EP 2405753**

54 Título: **Composición repulsiva anti-insectos**

30 Prioridad:

13.03.2009 FR 0951590

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

28.01.2014

73 Titular/es:

**DAKEM (100.0%)
4 rue de l'Abreuvoir
92400 Courbevoie, FR**

72 Inventor/es:

ESCULIER, MARC

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 440 322 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).

DESCRIPCIÓN

Composición repulsiva anti-insectos

La presente invención tiene por objeto una composición repulsiva anti-insectos picadores, en particular los mosquitos.

5 Es conocido protegerse de los insectos aplicando sobre la piel unos principios activos repulsivos. Sin embargo, la mayor parte de las soluciones de protección corporal contra los insectos picadores tienen una duración de eficacia limitada, en la medida en la que esta se ve frecuentemente afectada por la humedad del medio ambiente. Por ejemplo, el alto nivel de humedad de las zonas tropicales conlleva en los individuos un aumento importante de la sudoración, que tiene el efecto de provocar una eliminación prematura de la composición anti-insectos aplicada en la superficie de su piel. Asimismo, el contacto directo con el agua, por ejemplo durante un baño, con tal composición aplicada en la superficie de la piel, es igualmente por supuesto perjudicial.

Esta falta de resistencia al agua, manifestada por un gran número de composiciones anti-insectos, requiere por lo tanto una vigilancia del sujeto tratado, que se debe aplicar una nueva capa de composición después de cualquier contacto prolongado con el agua o una sudoración significativa.

15 Para paliar esta deficiencia, se ha propuesto el uso de agentes filmógenos, como por ejemplo los copolímeros de vinilpirrolidona, para aumentar la resistencia a la humedad de estas composiciones anti-insectos.

La presente invención pretende, por su parte, proponer una nueva composición anti-insectos que acumulan buenas propiedades repulsivas frente a los insectos y una resistencia particularmente incrementada frente a la humedad.

20 Más precisamente, la presente invención propone una composición que aporta una protección repulsiva anti-insectos de larga duración, incluso en condiciones climáticas extremas y/o después de baños de corta duración.

Los inventores han descubierto así de manera sorprendente que la asociación de un agente filmógeno particular y de una materia activa repulsiva de última generación, tal como el (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo, permite obtener tal composición.

25 El agente filmógeno considerado según la invención asegura en efecto eficazmente la fijación de la materia activa repulsiva e impide su eliminación al contacto con el agua.

Un primer objeto de la invención es por lo tanto una composición repulsiva anti-insectos que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, a título de materia activa repulsiva frente a los insectos, al menos el (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo, siendo dicho activo utilizado con al menos un copolímero de vinilpirrolidona y de un alquilo lineal que comprende al menos 16 átomos de carbono.

30 Un segundo objeto de la invención es un método para repeler los insectos frente a un soporte y más particularmente la piel, que comprende la aplicación sobre dicho soporte de una cantidad eficaz de al menos una composición tal como la definida en la presente invención.

Este soporte es ventajosamente la piel, sin embargo, puede tratarse también de la ropa o de otro material textil destinado a asegurar la protección de la piel contra los insectos.

35 Como se resalta en los ejemplos siguientes, el copolímero considerado según la invención a título de agente filmógeno es ventajoso por varias razones.

40 En primer lugar, unos ensayos biológicos de eficacia en condiciones tropicales han confirmado una eficacia de 8 horas sin ninguna picadura, en una composición que lo asocia con el activo anti-insectos aceptado según la invención. Estos resultados muestran por lo tanto que la utilización de este copolímero específico permite garantizar una resistencia a la humedad incrementada de la formulación anti-insectos y por lo tanto confiere a esta formulación un carácter "waterproof". Demuestran también que este filmógeno específico no afecta, por otra parte, a la reactividad del (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo frente a los insectos. Este último continúa eficaz a dosis convencionales de uso.

45 Además, el copolímero considerado según la invención se muestra fácil de formular. Así, no requiere una cantidad excesiva de aceite para su realización. En consecuencia, puede ser formulado en una emulsión acuosa no grasa (sin efecto graso, sin efecto pegajoso o desecante, sin manchas). Además, su eliminación se puede obtener fácilmente con agua jabonosa.

Finalmente, este copolímero es particularmente interesante en el plano de la inocuidad y, para ello, es compatible con una aplicación sobre la piel, incluso los párpados y los labios.

50 Ventajosamente, la composición según la invención se presenta en forma de una emulsión aceite en agua.

Más particularmente, esta composición manifiesta una resistencia al agua ("waterproof").

Materia activa repulsiva

La composición repulsiva según la presente invención contiene, a título de materia activa repulsiva frente a los insectos, al menos el (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo o una de sus sales.

5 El (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo se conoce también bajo el nombre de ICA-RIDIN. Está actualmente comercializado bajo el nombre de SALTIDIN por la compañía Saltego.

Una composición según la invención puede contener del 10 al 25% y preferentemente del 15 al 22% en peso de (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo con respecto a su peso total.

10 Por supuesto, una composición según la invención puede comprender además otra materia activa adicional, en particular con efecto repulsivo. Esta se puede seleccionar en particular entre el N,N-dietil-3-metilbenzamida (DEET), el butilacetilaminopropionato de etilo (IR3535), la citronela o también el geraniol.

Agente filmógeno

La composición repulsiva según la presente invención contiene también al menos un copolímero de vinil-pirrolidona y un alqueno lineal que comprende al menos 16 átomos de carbono, como polímero filmógeno.

15 Más precisamente, el copolímero considerado según la invención es un copolímero de vinil-pirrolidona y de hexadeceno.

Puede particularmente tratarse del Antaron V-216 comercializado por ISP (International Speciality, Products).

La composición puede ventajosamente contener del 0,1 al 15% y preferentemente del 1 a 10% en peso de copolímeros de vinilpirrolidona y de un alqueno lineal de C₁₆ con respecto a su peso total.

20 Por razones evidentes, el Icaridin y el agente filmógeno requeridos según la invención son formulados dentro de un medio fisiológicamente aceptable.

Así, una composición según la invención comprende ventajosamente a título de medio fisiológicamente aceptable, un medio acuoso, y en particular agua, preferentemente desmineralizada.

La composición según la invención comprende el 2% de dimeticona.

25 Este aceite es interesante en el plano de la formulación. Confiere asimismo un carácter resbaladizo apreciable para la aplicación de las fórmulas que lo comprenden.

La composición se presenta ventajosamente en forma de una emulsión, en particular aceite en agua.

Frente a su formulación de tipo emulsión, una composición según la invención comprende generalmente de manera ventajosa uno o varios agentes emulsionantes. Este agente se puede seleccionar entre los ésteres de sacarosa, los ésteres grasos de glicerol, los ácidos grasos, los alcoholes grasos etoxilados y sus mezclas.

30 La composición según la invención comprende un humectante, la glicerina.

Asimismo, una composición según la invención comprende un emoliente, el benzoato de alquilo de C₁₂ a C₁₅.

La composición según la invención puede comprender además uno o varios agentes gelificantes seleccionados entre el palmitato de sacarosa, el estearato de glicerilo, el citrato de estearato de glicerilo, y sus mezclas.

35 Según una variante de realización, una composición según la invención puede comprender además un activo anti-UV apto para conferirle unas propiedades protectoras frente a una exposición a los UV.

La composición según la invención puede además comprender los aditivos clásicos en el campo, como por ejemplo los seleccionados entre la lista no exhaustiva tales como los agentes quelantes, los conservantes, los reguladores de pH, los perfumes.

40 Como se ha precisado anteriormente, la composición se presenta ventajosamente en forma de una emulsión, en particular aceite en agua. Esta composición puede presentarse en forma de una crema, de una leche o de un gel, aplicable, llegado el caso, por pulverización.

45 La presente invención pretende además la utilización de una composición según la invención, repulsiva frente a los insectos. Más precisamente, pretende un método para repelar los insectos de una piel que comprende la aplicación, en cantidad suficiente sobre un soporte, tal como la piel, o destinado a ser puesto en contacto con esta, de una composición tal como se define según la presente invención.

ES 2 440 322 T3

Ejemplo 1:

Formulación tópica según la invención

NOMBRE COMERCIAL	Nombre INCI	Función	% PONDERAL
Saltidin (Icaridin) comercializado por Saltigo	Carboxilato de hidroxietil-isobutil-piperidina	Activo anti-mosquito	20
Antaron V 216 comercializado por ISP (International Specialty Products)	VP/Hexadeceno copolímero	Filmógeno	5
DC 200 Fluid 100 CST	Dimeticona	Silicona	2
Tegosoft TN	Benzoato de alquilo de C ₁₂₋₁₅	Emoliente	2
Agua desmineralizada	Agua	Disolvente	csp
Glicerina	Glicerina	Emoliente	5
Arlatone V 175	Palmitato de sacarosa, estearato de glicerilo, citratoestearato de glicerilo, sacarosa Mannan, goma Xanthan	Emulsionante	1,10
Carbopol EDT 2050	Carbomero	Agente gelificante	0,10
Disodium EDTA	EDTA disódica	Agente quelante	0,10
Euxyl PE9010	Fenoxietanol, Etilhexilglicerina	Conservante	0,80
Trietanolamina	Trietanolamina	Regulador de pH	0,10
Perfume Yakusa	Perfume	Perfume	1,50

Ejemplo 2

La eficacia de la formulación del ejemplo 1 se ha apreciado frente a mosquitos *Anopheles stephensi*.

5 En ausencia de norma francesa, el método sigue las líneas directrices siguientes:

Recomendaciones generales de la OMS: WHO/CDS/WHOPES/2001.2

ASTM (American Society for Testing and Materials): ASTM E951-94 (labo)

Los ensayos son efectuados con hembras de mosquito criadas en laboratorio: *Anopheles stephensi* (cepa ORSTOM).

10 Las hembras utilizadas para los ensayos tienen de 6 a 10 días de edad y han sufrido un ayuno previo de 24 horas (sin ingesta de sangre) a fin de aumentar su agresividad.

El objetivo de la ingesta de sangre es un ratón de tipo "hairless" (sin pelo) mantenido en una jaula de contención (ojos protegidos) que está impregnado del producto a ensayar (0,1 g/60 cm²). Aplicación por pipeta.

15 30 minutos después de la aplicación del producto, el ratón se introduce a continuación en una jaula que contiene aproximadamente 200 hembras (eliminación previa de los machos por gradiente de alimento).

El ensayo dura 5 minutos y durante este tiempo, se registra el número de mosquitos que se han posado sobre el ratón (efecto "landing"), y después el número de picaduras efectivas (salvo si se manifiesta ineficacia).

El ensayo se detiene a partir de 5 picaduras efectivas.

20 El ensayo se reinicia con nuevos lotes de mosquitos, después de 2, 4, 6, 7, 8 y 9 horas después de la aplicación según el límite de persistencia del producto (mientras tanto, el ratón es liberado).

El mismo ensayo se realiza con ratones que no han recibido ningún tratamiento, a fin de verificar la tendencia natural de los mosquitos para picar. Se verifica que haya al menos 10 "landing" y más de 5 picaduras en 30 segundos para validar el ensayo.

ES 2 440 322 T3

El ensayo se detiene después de 5 picaduras ("stop") en la tabla de los datos que figura a continuación.

Los datos de "landing" corresponden al número de mosquitos que se posan sobre la zona tratada, pero que se marchan sin haber picado. Este dato puede informar sobre el límite de persistencia de los productos ya que los mosquitos se acercan cada vez más a la zona tratada hasta que el efecto repulsivo sea insuficiente y que haya picadura efectiva.

5

Durante y entre los plazos, los ratones son mantenidos en una atmósfera de tipo "tropical" en condiciones controladas a $27 \pm 1^\circ\text{C}$ y $70 \pm 5\%$ de humedad relativa.

Las jaulas se cambian en cada ensayo unitario y están espaciadas en tres metros.

Se realizan tres repeticiones por fórmula a ensayar, y esto sobre tres ratones diferentes, es decir nueve ensayos unitarios por fórmula.

10

Los resultados son presentados en la tabla I siguiente.

ANOPHELES STEPHENSII	Ratón	rep.	T0+2H		T0+4H		T0+6H		T0+7H		T0+8H		T0+SH	
			P	L	P	L	P	L	P	L	P	L	P	L
Formulación ejemplo 1	1	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	5	stop	stop
		2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	stop	stop
		3	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	stop	stop
	2	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	stop	stop
		2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	stop	stop
		3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	stop	stop
	3	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	stop	stop
		2	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	stop	stop
		3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	stop	stop
Ensayo sin producto	1	1	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		2	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		3	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
	2	1	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		2	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		3	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
	3	1	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		2	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		3	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop

P: número de picaduras
 rep.: repetición
 L: "landing": número de mosquitos que se posan sin picar sobre la zona tratada
 stop ∞ el ensayo se detiene cuando se observan más de 5 picaduras

Se puede señalar que en las condiciones de estos ensayos, con las muestras proporcionadas, cepas de insectos y método considerado, la fórmula ha mostrado un efecto repulsivo altamente significativo frente a *Anopheles stephensi*. La persistencia de la acción es de 8 horas.

15

REIVINDICACIONES

- 5 1. Composición repulsiva anti-insectos que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, a título de materia activa repulsiva frente a los insectos, al menos el (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo, siendo dicho activo aplicado en un medio acuoso con al menos un copolímero de vinilpirrolidona y de un alqueno lineal que comprende al menos 16 átomos de carbono, y al menos un aceite de silicona, caracterizado por que contiene:
- el 20% en peso de dicho (2-(2-hidroxietil)piperidin-1-carboxilato de 1-metilpropilo,
 - el 5% en peso de un copolímero de vinilpirrolidona y de hexadeceno a título de copolímero de vinilpirrolidona y de un alqueno lineal que comprende al menos 16 átomos de carbono,
 - el 2% en peso de dimeticona a título de aceite de silicona,
- 10 - el 2% en peso de benzoato de alquilo de C₁₂-C₁₅,
- el 5% en peso de glicerina,
 - el 1,1% en peso de emulsionante,
 - el 0,1% en peso de carbomero,
 - el 0,1% en peso de agente quelante,
- 15 - el 0,8% en peso de conservante,
- el 0,1% en peso de regulador de pH,
 - el 1,5% en peso de perfume, y
 - el 62,3% en peso de agua.
- 20 2. Composición repulsiva según la reivindicación 1, caracterizada por que se presenta en forma de una emulsión aceite en agua.
3. Composición repulsiva según la reivindicación 1 ó 2, caracterizada por que presenta una resistencia al agua.
4. Composición repulsiva según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que se presenta en forma de una crema, de una leche o de un gel, aplicable, llegado el caso, por pulverización.
- 25 5. Método para repeler los insectos de la piel que comprende la aplicación en cantidad suficiente sobre un soporte, tal como la piel, o destinado a ser puesto al contacto con esta, de una composición tal como se define según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.