

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 523 668**

51 Int. Cl.:

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 7/00 (2006.01)

A01N 59/04 (2006.01)

A01N 25/04 (2006.01)

A01N 59/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **13.10.2006 E 06807232 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.08.2014 EP 1940233**

54 Título: **Proceso y composición pediculicidas**

30 Prioridad:

17.10.2005 FR 0510553

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

28.11.2014

73 Titular/es:

**SOLVAY SA (100.0%)
Rue de Ransbeek, 310
1120 Bruxelles , BE**

72 Inventor/es:

**PALANGIE, NICOLAS y
PASCAL, JEAN-PHILIPPE**

74 Agente/Representante:

LINAGE GONZÁLEZ, Rafael

ES 2 523 668 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

Proceso y composición pediculicidas

- 5 La invención se refiere a un proceso pediculicidal y a una composición pediculicidal, es decir, a un proceso y una composición que son eficaces para combatir el artrópodo *Pediculus humanus* y/o sus liendres. Se refiere también a un método para destruir el artrópodo *Pediculus humanus* que crecen en el cabello de la cabeza de seres humanos usando esta composición.
- 10 Los piojos que crecen en el cuerpo humano (*Pediculus humanus*) presentan un problema de salud pública conocido. Estos piojos comprenden de una forma conocida, *Pediculus humanus capitis* (piojo de la cabeza), de hecho incluso el *Pediculus humanus corporis* (piojo del cuerpo) y el *Phthirus pubis* (piojo público). Aunque la infestación de niños por piojos ha disminuido en las últimas décadas, solo en Francia más de dos millones de niños todavía tienen que ser tratados cada año, lo que es una preocupación para familias y responsables de escuelas de primaria implicados.
- 15 La lucha contra los piojos se ha hecho particularmente compleja en cuanto que los huevos de los piojos están protegidos por una envoltura extremadamente hermética al agua y están firmemente unidos al cabello humano. Esta envoltura exhibe solamente unas pocas aberturas muy pequeñas, conocidas como aeropilos, que están situados en el opérculo en la parte superior de la liendre, permitiendo que la liendre respire, constituyendo estos aeropilos los únicos pasos que permiten que un pediculicida penetre en la liendre. Durante la eclosión de las liendres, el opérculo que comprende los aeropilos se abre para permitir que pase la ninfa, que escolda fuera de la envoltura protectora hermética al agua.
- Es conocido combatir piojos y sus liendres usando sustancias neurotóxicas, como piretrinas o piretroides sintéticos (permetrina, aletrina, bioaletrina, D-fenotrina y similares), compuestos de organofósforo como malatión, carbamatos (carbarilo y similares) o butóxido de piperonilo. Sin embargo, parece que estas sustancias están perdiendo gradualmente su eficacia tras la aparición de cepas de *Pediculus humanus* que son resistentes a las mimas. Además, su uso en las proximidades del cuerpo humano puede dar lugar a irritación de la piel y a riesgos debidos a su neurotoxicidad cuando se usan repetidamente. Esto es porque estas sustancias neurotóxicas actúan sobre el sistema nervioso del piojo y son también tóxicas para el hombre. Algunos de estos productos se sospecha incluso
- 25 que son carcinógenos, de hecho incluso teratógenos. Esta toxicidad es una preocupación particular en el caso de niños, para los cuales las infestaciones repetidas por piojos requieren a menudo tratamientos repetidos.
- El documento WO 05/025317 describe una suspensión parasitocida acuosa que comprende sílice y bicarbonato de sodio y un método para reprimir parásitos en animales, en particular animales de granja. Entre los parásitos citados que pueden ser reprimidos por dicha suspensión, se citan ácaros como el piojo rojo de las plumas. Sin embargo, no se describe un proceso o una composición que comprenda más de 60% de bicarbonato para combatir el piojo específico *Pediculus humanus* (que es un insecto). Además, la composición descrita no está en forma de un gel. El documento describe un resultado a corto plazo contra parásitos ácaros (*Dermansyssus gallinae*) en el ejemplo 3, tabla 1, página 7, con una suspensión acuosa (no un gel) preparada a partir de 20 kg de una mezcla seca de 85%
- 35 de bicarbonato de sodio y 15% de diferentes sílices; y 25 kg de agua (es decir, 37% de bicarbonato de sodio, 7% de sílice y 56% de agua), dicha suspensión acuosa es aplicada sobre una palca y seguidamente se deja secar 24 h antes de ser puesta en contacto con parásitos, mostrando 0 a 5% (columna 2) de mortalidad de parásitos después de 1 hora de contacto.
- 45 Una composición basada en sacárido y en sílice, que es eficaz para combatir piojos, se describe en el documento WO 03/045152. Sin embargo, esta composición es relativamente cara y su acción pediculicida es bastante lenta.
- El documento WO 04/056184 describe el uso de un polvo que comprende más de 40% p de bicarbonato de sodio y sílice para reprimir parásitos, en particular ácaros, insectos y hongos, en el almacenamiento de cereales.
- 50 El documento WO 04/028250 describe el uso de una composición que comprende partículas que contiene silicio específicas para combatir o repeler diversos tipos de plagas, entre las que se citan *Pediculus* spp. (piojos). Dicha composición puede estar en forma de un gel y puede ser usada en productos cosméticos, como champús o geles de ducha. Sin embargo, no contiene ningún bicarbonato de metal alcalino.
- 55 La invención se dirige a proporcionar un nuevo proceso pediculicida al que no son resistentes los piojos y que es económico y una composición inofensiva para el hombre.
- Consecuentemente, la invención se refiere a una composición pediculicida que comprende al menos 60% en peso de un bicarbonato de metal alcalino para ser usado en la eliminación del piojo *Pediculus humanus* del cuero cabelludo humano.
- 60 El la composición pediculicida según la invención, el bicarbonato de metal alcalino puede ser, por ejemplo, bicarbonato en sentido estricto, como bicarbonato de potasio o bicarbonato de sodio. Teniendo en cuenta esto, sin embargo, también abarca sales de compuestos, como sesquicarbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, trona), que comprenden bicarbonato. El bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio o trona son especialmente bien
- 65

adecuados. Se recomiendan bicarbonatos en sentido estricto. Se previere el bicarbonato de potasio o bicarbonato de sodio, más particularmente bicarbonato de sodio. La composición comprende al menos 60%, ventajosamente 70%, preferentemente 80%, todavía más preferentemente 85% en peso de bicarbonato de metal alcalino.

- 5 El bicarbonato comprende ventajosamente partículas que tienen una distribución del tamaño de partícula tal que al menos un 50%, ventajosamente 75%, preferentemente 90% de las partículas tienen un diámetro medio de menos de 100 μm , preferentemente 70 μm . El diámetro medio es ventajosamente de menos de 50 μm , preferentemente 40 μm . Los diámetros se miden según la norma Standard ASTM C - 690 - 1992. El resto del bicarbonato, que no está en la forma de partículas, puede estar, por ejemplo, en forma disuelta. Además de su acción química contra
- 10 *Pediculus humanus*, los inventores consideran que el bicarbonato de metal alcalino tiene una acción mecánica que es más eficaz cuando tiene estos tamaños de partículas.

- En una realización preferida de la composición pediculicida según la invención, la composición comprende adicionalmente al menos 1%, preferentemente 5% de sílice. Se recomienda que no debe comprender más de 20%, preferentemente 15% de la misma. Se ha observado que la presencia de sílice en el polvo aumenta sinérgicamente los efectos pediculicidas del bicarbonato de metal alcalino. Además, como el polvo comprende concentraciones elevadas de bicarbonato, la presencia de sílice mejora el flujo de la suspensión y favorece así su aplicación homogénea. Se recomienda que la sílice debe estar en la forma amorfa (y no cristalina) con el fin de que sea tolerada por el cuerpo humano, en particular en el caso de inhalación.

- 20 Es preferible que la sílice esté en la forma de partículas muy finas que tengan una elevada superficie específica, por ejemplo, de más de 200 m^2/g , preferentemente 400 m^2/g , medida según la norma Standard ISO 5794-1, anexo D. En una realización ventajosa de la invención, la sílice está en la forma de partículas que tienen un diámetro medio de menos de 10 μm . El diámetro medio se mide según la norma Standard ASTM C - 690 - 1992.

- 25 La mezcla de bicarbonato/sílice debe ser tan homogénea como sea posible. Sin embargo, se ha observado que, en ciertas circunstancias, en particular cuando la mezcla se lleva a cabo en mezcladores de reja de arado, lo que es ventajoso, un tiempo de mezcladura excesivamente largo puede dar lugar a una pérdida de eficacia de la suspensión acuosa subsiguiente. Generalmente, se recomienda manejar la mezcla de bicarbonato de metal alcalino/sílice con el fin de fluidizarla. Esta fluidización tiene lugar en un mezclador de reja de arado cuando la mezcla vuelve a caer en el mezclador a continuación de la rotación de la reja de arado.

- 30 En particular, cuando está en la forma de partículas que tienen los tamaños de partículas más ventajosos, el bicarbonato tiene su propia acción parasitica y su presencia en la composición no tiene ninguna función de diluir o portar la sílice.

- Los bicarbonatos de metales alcalinos y la sílice son sustancias inofensivas para el hombre y animales. En el caso de bicarbonato de sodio y bicarbonato de potasio, incluso están permitidos por diversas entidades (Como la Administración para alimentos y fármacos en los Estados Unidos y la CEE) en los alimentos para seres humanos.
- 40 En la composición pediculicida según la invención, el polvo no requiere ninguna otra sustancia activa contra el *Pediculus humanus*, como pediculicidas neurotóxicos. Se recomienda que se debe evitar cualquier sustancia neurotóxica. Incluso es preferible que no esté completamente desprovista de cualquier otra sustancia pediculicida activa.

- 45 En la composición pediculicida según la invención, la composición puede estar en diversas formas de formulación, como polvo, crema, gel, suspensión acuosa o solución acuosa.

- En una primera forma alternativa de la composición pediculicida según la invención, la composición está en la forma de una suspensión acuosa. Esta forma de formulación es ventajosa para la formulación de champús. En esta forma alternativa, se recomienda que la suspensión acuosa, que no debe ser confundida con una solución acuosa, para que comprenda una cantidad de bicarbonato de metal alcalino que sobrepase su límite de solubilidad a temperatura ambiente. Se ha observado que, en este caso, el tamaño de partícula de las partículas de bicarbonato en la suspensión es más estable a lo largo del tiempo.

- 55 En una segunda forma alternativa de la composición pediculicida según la invención, que es preferida, la composición está en la forma de gel. Los geles son composiciones que comprenden al menos dos componentes, generalmente un sólido dispersado en la forma coloidal en una fase líquida. Las partículas dispersadas forman redes espaciales estabilizadas por medio de fuerzas de Van der Waals. En hidrogeles, la fase líquida es agua. Pueden comprender también polímeros gelificantes, como polisacáridos, pectina, xantano y similares. En esta forma alternativa, es preferible que la composición comprenda sílice. Cuando la composición comprende sílice, es particularmente fácil producir un gel mediante la simple adición de agua a la mezcla de bicarbonato/sílice. Entonces es preferible que la composición esté desprovista de polímeros gelificantes. Esta forma alternativa puede ser fácilmente empleada, en particular, en el cabello de la cabeza humana ya que el contacto prolongado entre el *Pediculus humanus* y la composición es proporcionado por la consistencia del gel, que hace posible evitar el recurso a recubrimientos, como tapaderas. Finalmente, esta composición es completamente inofensiva, lo que es ventajoso
- 65 en el tratamiento de los piojos presentes en niños jóvenes ya que éstos últimos frecuentemente tocan su cabello en

la cabeza y pueden llevar posteriormente su mano a la boca.

Por tanto, la invención se refiere también a una composición en la forma de gel que comprende de 35 a 55%, preferentemente de 40 a 50% en peso de partículas de bicarbonato de metal alcalino, de 10 a 30%, preferentemente de 15 a 25% de sílice y de 30 a 50%, preferentemente de 35 a 45% de agua.

Es ventajoso que la composición no comprenda más de 10%, preferentemente 5%, en particular 1% de material orgánica, como un polímero gelificante, por ejemplo goma de xantano. Aunque en algunos casos se recomienda que comprenda al menos 0,1% en peso de un agente gelificante (por ejemplo, goma de xantano) con el fin de mejorar las propiedades reológicas del gel, y es particularmente ventajoso que la composición sea completamente inorgánica.

La composición en forma de gel según la invención puede ser obtenida de forma muy sencilla mediante simple mezcla de los constituyentes.

Este gel, debido a su simplicidad de uso y su consistencia, tiene numerosas aplicaciones. Ha demostrado ser particularmente útil para combatir parásitos en general (como, por ejemplo, garrapatas, piojos, ácaros) como composición parasitocida. Sin embargo, es particularmente adecuado para combatir el *Pediculus humanus* como composición pediculicida debido a su inocuidad para el hombre y su excelente eficacia contra las liendres de este parásito. La composición pediculicida está así ventajosamente desprovista de cualquier otra sustancia pediculicida. Aunque no se desean vinculaciones a una explicación teórica, los inventores suponen que la composición según la invención da lugar al bloqueo de los aeropilos, lo que previene la eclosión de las ninfas.

Los ingredientes de la composición según la invención son preferentemente, en la medida de lo posible, de acuerdo con los de la composición usada en las formas y realizaciones alternativas específicas del proceso según la invención. Por ejemplo, el bicarbonato en forma de partículas, que es ventajosamente bicarbonato de sodio, está preferentemente en la forma de partículas que tienen un tamaño de partícula tal que al menos un 50%, ventajosamente 75%, preferentemente 90% de las partículas que tienen un diámetro medio de menos de 100 μm , preferentemente 70 μm . El gel tiene así una consistencia muy suave que es particularmente agradable al tacto y su eficacia parasitocida en general, pero en particular su eficacia pediculicida, es así mejorada.

La composición y el proceso según la invención son particularmente eficaces para combatir el *Pediculus humanus* que infesta sustratos como mantas corporales, accesorios de cama como almohadas, materiales de limpieza como toallas, el cabello humano en general y en particular el cabello de la cabeza humana. En particular, la invención se refiere a un proceso para combatir el piojo *Pediculus humanus* que infesta mantas corporales, accesorios de cama y en particular almohadas y materiales de limpieza como toallas, según el cual el piojo se pone en contacto con una composición según la invención. Como la composición y el proceso según la invención emplean sustancias no tóxicas con una acción bastante, suave, están ventajosamente destinados a combatir infestaciones desde el comienzo de su desarrollo, en particular en el cabello de la cabeza humana.

Ventajosamente, el cabello humano se pone en contacto con la composición pediculicida durante al menos 1 hora, preferentemente 4 horas, más preferentemente 8 horas, en que la operación de poner en contacto durante al menos 1 hora, preferentemente 4 horas, más preferentemente 8 horas, se repite con posterioridad ventajosamente en los 2 primeros días posteriores. Sin embargo, se recomienda que la segunda operación de poner en contacto tenga lugar menos de 10 días, preferentemente una semana después de la primera. Se pueden proporcionar operaciones adicionales de poner en contacto, si es necesario. Se debe tener particular cuidado de que la composición se aplique homogéneamente al cabello mientras se alcanza definitivamente la base del cabello de la cabeza, estando generalmente unidas las liendres a la parte del cabello de la cabeza individual más próxima al cuero cabelludo.

Consecuentemente, la invención se refiere también a una composición según la invención para eliminar el piojo *Pediculus humanus* del cabello de la cabeza humana, poniendo la composición en contacto con el cabello de la cabeza durante al menos 1 hora, siendo posteriormente repetida la operación de poner en contacto durante al menos 1 hora en los dos primeros días posteriores.

Los siguientes ejemplos sirven para ilustrar la invención.

Ejemplo 1

Se seleccionaron cepas del piojo *Pediculus humanus* adecuadas para el conejo. Justo desde su nacimiento, los piojos jóvenes eclosionados se colocaron en trozos de material que simula el cabello, se asentaron una vez al día en el estómago afeitado de un conejo con el fin de saciarlos de sangre. Justo después de que terminaron de alimentarse, fueron colocados en una estufa mantenida a 29°C y 70-80% de humedad relativa. Cuatro tandas de 25 piojos con un tiempo entre 3 y 7 días después de eclosionar (ninfas), por una parte, y con un tiempo entre 15 y 16 días después de eclosionar (adultos), por otra parte, se pusieron en contacto durante 1 hora con un polvo que comprendía 85% en peso de bicarbonato de sodio Bicar® 0/4, compuesto por partículas que tenían un tamaño de partícula tal que un 75% de las partículas tenían un diámetro medio de menos de 65 μm , y un 15% en peso de sílice

Sipernat® 50S fabricada por la empresa Degussa. Después del tratamiento, los piojos se lavaron. 16 horas después del tratamiento, todos los piojos alimentados y almacenados normalmente estaban muertos, ya fueran ninfas o adultos. En comparación, los piojos solamente lavados, que no habían sido puestos en contacto con el polvo, mostraron una mortalidad de aproximadamente 9%.

5

Ejemplo 2

En el ejemplo 2, dos tandas de 50 piojos, tratados de la misma forma que en el ejemplo 1, se pusieron en contacto durante 3 h con un gel que consistía en 43% de bicarbonato (compuesto por partículas que tenían un tamaño de partícula tal que un 75% de las partículas tenían un diámetro medio de menos de 65 µm), 19% de sílice Sipernat® 50S y 38% de agua. Ya 1 h después del tratamiento, un 89% de los piojos estaban muertos. Cuando el tiempo de contacto se aumentó de 3 h a 6 h, 1 h después del tratamiento, el 100% de los piojos estaban muertos.

10

Ejemplo 3

En el ejemplo 3, se tomaron liendres de piojos, dejados entre 1 y 4 días previamente. Las liendres se pusieron en contacto durante 8 horas con un polvo análogo al del ejemplo 1. Las liendres se lavaron posteriormente y se colocaron en la estufa (29°C, 70).

15

REIVINDICACIONES

1. Composición pediculicida que comprende al menos 60% en peso de bicarbonato de metal alcalino, para uso en la eliminación del piojo *Pediculus humanus* del cabello de la cabeza humana.
- 5 2. Composición pediculicida según la reivindicación anterior, en la que el bicarbonato es bicarbonato de sodio.
3. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que el bicarbonato en forma de partículas está en la forma de partículas que tienen un tamaño de partícula tal que al menos un 90% de dichas partículas tienen un diámetro medio de menos de 100 μm .
- 10 4. Composición pediculicida según la reivindicación anterior, en la que el diámetro es de menos de 70 μm .
5. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que la composición comprende adicionalmente al menos 1% de sílice.
- 15 6. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que la composición comprende adicionalmente de 5 a 20% de sílice.
- 20 7. Composición pediculicida según las reivindicaciones 5 ó 6, en la que la sílice está en la forma de partículas que tienen un diámetro medio de menos de 10 μm .
8. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones 5 a 7, en la que la sílice está en una forma amorfa (y no cristalina).
- 25 9. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, desprovista de cualquier sustancia neurotóxica.
10. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la forma de un polvo, una crema, un gel, una suspensión acuosa o una solución acuosa.
- 30 11. Composición pediculicida según la reivindicación 10, en forma de gel y que comprende polímeros gelificantes.
12. Composición pediculicida según la reivindicación 11, en la que los polímeros gelificantes son polisacáridos, pectina o xantano.
- 35 13. Composición pediculicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, para eliminar el piojo *Pediculus humanus* del cabello de la cabeza humana, poniendo en contacto la composición con el cabello de la cabeza durante al menos 1 hora, siendo posteriormente repetida la operación de poner en contacto durante al menos 1 hora en los dos primeros días posteriores.
- 40 14. Proceso para combatir el piojo *Pediculus humanus* que infesta mantas corporales, artículos de cama y en particular almohadas, y materiales de limpieza como toallas, según el cual el piojo es puesto en contacto con una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13.