

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 615 383**

51 Int. Cl.:

A61K 8/34 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/67 (2006.01)
A61Q 17/00 (2006.01)
A61Q 15/00 (2006.01)
A61Q 5/00 (2006.01)
A61Q 19/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.02.2009** **E 13151581 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **14.12.2016** **EP 2594248**

54 Título: **Combinación de principios activos y su uso**

30 Prioridad:

28.02.2008 DE 102008011692

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

06.06.2017

73 Titular/es:

AIR LIQUIDE SANTÉ (INTERNATIONAL) (100.0%)
75, quai d'Orsay
75007 Paris, FR

72 Inventor/es:

BEILFUSS, WOLFGANG;
WEBER, KLAUS;
GRADTKE, RALF y
HERWEG, SABINE

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 615 383 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

Combinación de principios activos y su uso

La presente invención se refiere a una combinación de principios activos y a su uso para producir una preparación, en particular para el tratamiento del olor corporal no deseado. Además, la invención se refiere a preparaciones con un contenido de la combinación.

El olor corporal es el término usado para referirse a emanaciones corporales humanas que pueden oler, de la piel y en el sentido más amplio también de las aberturas corporales tales como, p. ej., olor bucal. El más claramente perceptible es el olor de la transpiración donde solo huelen las secreciones de las glándulas sudoríparas apocrinas, que están situadas principalmente en las axilas. La transpiración reciente es completamente inodora. Solo la degradación de los ácidos grasos de cadena larga a cadenas más cortas tales como ácido fórmico o ácido butírico producen el típico olor de transpiración. Están implicadas en esto una variedad de bacterias; estas se encuentran en la piel de forma natural.

Para tratar el olor corporal no deseado, en particular el olor corporal de la transpiración no deseado, se pueden seguir los siguientes métodos fundamentales:

1. El olor no deseado se puede ocultar mediante el uso de productos olorosos (fragancias, perfumes).
2. Los absorbentes de olor pueden absorber productos olorosos.
3. Se pueden usar agentes antimicrobianos para controlar las bacterias responsables de la descomposición de la transpiración.
4. Los inhibidores de la transpiración (antitranspirantes) son sustancias que influyen directamente en la secreción de la transpiración y por lo tanto están dirigidos a prevenir el olor de la transpiración.

Se conoce el uso del 5-cloro-2-(2,4-diclorofenoxi)-fenol (nombre internacional no registrado: triclosán) como un inhibidor bacteriano. Sin embargo, el Instituto Federal Alemán de Evaluación de Riesgos advierte contra el uso doméstico del triclosán puesto que se sospecha resistencia bacteriana. Además, se pueden formar dibenzodioxinas y dibenzofuranos policlorados a partir del triclosán por irradiación solar.

Se sabe del documento DE 4240674 C1 que los éteres monoalquílicos del glicerol de fórmula $ROCH_2CHOHCH_2OH$ tienen un buen efecto desodorizante. Se da preferencia al uso del éter 1-(2-etilhexílico) del glicerol (producto comercial Sensiva[®] SC 50, Schülke & Mayr GmbH). La memoria descriptiva de la patente describe, entre otros, una formulación desodorante que comprende 58% en peso de agua, 40% en peso de etanol y 1,0% en peso de 1,2-propilenglicol, 0,9% en peso de éter 2-etilhexílico del glicerol y 0,1% en peso de alcano de bispiridinio (dihidrocloruro de octenidina). Esta formulación no es suficientemente estable en el almacenamiento. El resultado es la formación de peróxidos y por consiguiente la formación de productos de degradación, tales como sustancias volátiles con un peso molecular bajo y alcoholes de olor desagradable, tales como 2-etilhexanol.

Además, el contenido de sustancias volátiles (COV, tales como etanol) y el contenido de principio activo en la preparación terminada son comparativamente altos.

Además, el documento DE 10 2005 002 644 A1 describe preparaciones para la aplicación en la desinfección higiénica de manos y el lavado de manos desinfectante. Las preparaciones comprenden éter monoalquílico del glicerol, alcano de bispiridinio y poliol.

Por consiguiente, un objeto de la presente invención era proporcionar una combinación de principios activos para preparaciones que sean eficaces contra estos microorganismos que afectan de forma adversa, incluso en casos leves, al bienestar del usuario (p. ej., olor corporal desagradable, manchas, piel grasa, comedones, caspa, olor de los pies). La combinación debe ser también estable en el almacenamiento en una concentración comparativamente alta, incluso a temperatura elevada, sin la formación de productos de descomposición o reducción en el contenido de principio activo. Las preparaciones proporcionadas con la combinación de principios activos deben tener el menor contenido posible de COV y ser suficientemente eficaces con un contenido bajo de principio activo y estables durante tanto tiempo como sea posible sin descomponerse.

Sorprendentemente, ahora se ha encontrado que este objeto se logra mediante una combinación de principios activos según la reivindicación 1. Los principios activos individuales a) éter de glicerol y b) alcano de bispiridinio, están en cada caso en preparación acuosa o son claramente solubles y/o solubles o estables en el almacenamiento a bajas temperaturas solo en un grado limitado. En cambio, las combinaciones según la invención son (incluso a bajas temperaturas) significativamente más estables (en el almacenamiento) y/o comprenden concentraciones de principios activos que están significativamente por encima de la solubilidad de los principios activos individuales (mejora mutua de la solubilidad de los componentes, estabilidad concentrada mejorada).

De acuerdo con la invención, se prefieren combinaciones (las combinaciones típicas son concentrados) y preparaciones (típicamente diluidas, p. ej., soluciones acuosas, listas para usar) que carecen de alcoholes

aromáticos tales como 2-fenoxietanol, alcohol bencílico, alcohol fenetílico, 1-fenoxipropan-2-ol, 3-(4-clorofenoxi)-1,2-propanodiol, clorobutanol, alcohol 2,4-diclorobencílico o mezclas de los mismos. Además, se da preferencia a combinaciones y preparaciones que no comprenden sales de ácido benzoico, ácido propiónico, ácido salicílico, ácido sórbico, ácido 4-hidroxibenzoico, ácido dehidroacético y ácido 10-undecilénico.

- 5 Además, en el caso de combinaciones y preparaciones de acuerdo con la invención, se da preferencia a una realización en la que no está presente alcohol alifático (no hay alcohol monohídrico alifático) ni óxido de amina, como es obligatorio según el documento DE 10 2005 002 645 A1 y DE 10 2005 002 643 A1. Un contenido de alcohol alifático aumenta la cantidad de sustancias volátiles y por lo tanto contribuye a un contenido alto de COV, lo cual no se desea. En el caso de la presencia de óxidos de amina, hay el riesgo potencial de la formación de nitrosaminas, lo cual igualmente no se desea.

El contenido del componente a) en general está en el intervalo de 14 a 18% en peso, por ejemplo aproximadamente 16% en peso, del componente a), basado en la combinación de principios activos.

En una realización preferida, el contenido del componente b) está en el intervalo de 1,4 a 1,8% en peso, tal como por ejemplo, aproximadamente 1,6% en peso, del componente b) basado en la combinación de principios activos.

- 15 La mejora de la solubilidad de los éteres de glicerol en sistemas acuosos en presencia de alcanos de bispiridinio es importante en particular para éteres de glicerol de cadena relativamente larga, muy poco solubles en agua (p. ej., para alcohol de batilo, alcohol de quimilo, alcohol de selaquilo, éter dodecílico del glicerol, éter mentílico del glicerol, puesto que como resultado de esto, su uso en preparaciones cosméticas (basadas en agua) se hace considerablemente más fácil, p. ej., sin la ayuda de cantidades relativamente grandes de promotores de la solubilidad.

Según la invención, como un componente c) que se puede usar, se prefiere en particular el 1,2-propilenglicol.

- 25 Los polioles actúan como vehículos (líquidos) estabilizantes a baja temperatura, disolventes, promotores de la solubilidad, inhibidores de la cristalización, humectantes (donde el efecto de humectante de la piel se potencia adicionalmente por la presencia de éteres de glicerol). Aquí, los polioles, éteres de glicerol y/o alcanos de bispiridinio son capaces de potenciar mutuamente sus efectos (p. ej., eficacia desodorante, eficacia contra gérmenes que causan problemas, efecto de cuidado de la piel).

En una realización preferida, el contenido del componente c) está en el intervalo de 70 a 85% en peso, de 80 a 84% en peso, por ejemplo aproximadamente de 82 a 83% en peso, del componente c), basado en la combinación de principios activos.

- 30 Como componente d), se prefieren la vitamina E y el 3-terc-butil-4-hidroxianisol, y se prefieren en particular la vitamina E y sus derivados.

- 35 Las formas adecuadas de la vitamina E (tocoferoles) son, por ejemplo, vitamina E natural, vitamina E sintética, formas enantioméricamente puras de la vitamina E (p. ej., (+)-alfa-tocoferol), derivados de la vitamina E tales como acetatos, succinatos, linoleato, formas más solubles en agua de la vitamina E tales como tocophereth-5, tocophereth-10, tocophereth-12, tocophereth-18, tocophereth-50, succinato de D-alfa-tocoferol-polietilenglicol 1000. Se da preferencia particular a la vitamina E sintética y vitamina E natural.

Aquí, una cantidad particularmente preferida de antioxidante es de 0,004 a 0,015% en peso o de 0,005 a 0,01% en peso, tal como aproximadamente 0,008% en peso, basado en la combinación de principios activos según la invención.

- 40 Según la invención, se da preferencia particular a una combinación según la reivindicación 4. Las combinaciones según la invención pueden contener agua, comprendiendo las combinaciones preferidas menos de 55% en peso de agua, tal como menos de 50% en peso, menos de 40% en peso, menos de 30% en peso, menos de 20% en peso, menos de 10% en peso, menos de 5% en peso, donde una combinación particularmente preferida comprende menos de 5% en peso de agua, tal como menos de 1% en peso de agua, por ejemplo menos de 0,5% en peso de agua, donde una combinación particularmente preferida según la invención está exenta de agua.

La combinación según la invención consiste en los componentes a) a d).

En una realización preferida de la combinación según la invención, la relación en peso de la suma de los componentes a), b) y d) al componente c) es de 1:3 a 1:6. En una realización particularmente preferida, la relación en peso es de aproximadamente 1:4 a 1:5.

- 50 En el caso de combinaciones preferidas, la relación en peso del componente d) al componente a) es de 10:1 a 1:100.000, de 1:1 a 1:50.000, de 1:10 a 1:20.000, de 1:100 a 1:10.000, de 1:500 a 1:6000, de 1:1000 a 1:4000, donde en el caso de combinaciones particularmente preferidas la relación en peso del componente d) al componente a) es aproximadamente 1:2000.

La relación en peso del componente a) al componente b) es preferiblemente de 1:10 a 100:1, tal como de 1:1 a 50:1,

de 2:1 a 50:1 o de 5:1 a 20:1, dando preferencia particular a una combinación en la que la relación en peso del componente a) al componente b) es aproximadamente 10:1.

Las combinaciones según la invención típicamente son soluciones incoloras, transparentes, con un olor intrínseco débil. Las soluciones son estables en el almacenamiento.

5 En un aspecto adicional de la invención, las combinaciones descritas se usan como concentrados para producir preparaciones. Este uso permite que las preparaciones estén equipadas con buena eficacia contra los gérmenes que producen olor. Se logran los siguientes efectos y/o los siguientes gérmenes que producen olor son controlados eficazmente según la invención:

10 1. Gérmenes que producen olor bucal. El olor bucal está formado por compuestos de azufre volátiles, p. ej., por descomposición bacteriana de restos de comida o tejido muerto, producido, p. ej., por anaerobios Gram negativos tales como especies *Fusobacterium*.

15 2. Gérmenes que producen olor de transpiración. Este es causado, p. ej., por los siguientes gérmenes de la piel, que son eficaces como gérmenes de olor: *Staphylococci spp.* (p. ej., *epidermidis*, *aureus*, *hominis*), *Corynebacteria spp.* (p. ej., *xerosis*, CDC G2), *Micrococcus spp.* (p. ej., *Micrococcus luteus* = *Kokuria rhizophila*), *Anaerococcus spp.* (p. ej., *octavius*). Según la invención, preferiblemente se controlan los gérmenes que son responsables en especial del desarrollo de olor de la transpiración, por ejemplo, *S. aureus*, *S. epidermis*, *M. luteus*, *P. mirabilis*, *K. pneumoniae* y *E. gergoviae*.

3. Gérmenes que producen olor corporal. El olor corporal es producido, en particular, por *Staph. hominis*, *Anaerococcus octavius* y *Corynebacterium spp.* (p. ej., *xerosis*, CDC G2).

20 4. Gérmenes que producen olor de los pies. El olor de los pies es producido, por ejemplo, por microorganismos (bacterias, levaduras, hongos) tales como *Brevibacteria spp.*, *Trichophyton spp.*, e.g. *T. rubrum*, *T. mentagrophytes*, *Epidermophyton floccosum* etc.

Las preparaciones se usan preferiblemente para el tratamiento (control, supresión) del olor corporal no deseado. Típicamente, las preparaciones son preparaciones cosméticas desodorantes.

25 Además de la excelente eficacia de las preparaciones proporcionadas con la combinación contra gérmenes como desodorantes, también debe destacarse la buena eficacia contra gérmenes que causan problemas tales como *propionibacterium acnes* (adecuada para preparaciones para el tratamiento de piel con manchas, acné), *Malassezia furfur* (adecuada para preparaciones para combatir la caspa) y *Trichophyton rubrum* y *Trichophyton mentagrophytes* (adecuada para preparaciones para combatir hongos de los pies y la piel). Los hongos de los pies son una de las dermatomicosis mejor conocidas y es una infección fúngica contagiosa causada por dermatofitos y se produce en zonas donde se acumulan calor y humedad. Un trastorno de hongos en los pies se pone de manifiesto por picor, ligero enrojecimiento y zonas de piel escamosa y también formación de ampollas que supuran. Por consiguiente, la invención se refiere también al uso de la combinación para producir una preparación (cosmética o farmacéutica) para el tratamiento de piel con manchas, acné, caspa y/o hongos en los pies y la piel.

35 Las preparaciones comprenden típicamente de 0,01 a 5% en peso, preferiblemente de 0,05 a 1% en peso y por ejemplo, aproximadamente 0,1% en peso, de la presente combinación como concentrado, así como opcionalmente uno o más principios activos, auxiliares y/o aditivos.

40 El o los principios activos, auxiliares y/o aditivos opcionales posibles son preferiblemente: principios activos anticaspa tales como Octopirox™, Climbazol™ etc., principios activos desodorantes tales como fenoxietanol, sales de polihexametilenguanida, sales de clorhexidina, triclosán, principios activos conservantes, bactericidas, acil-aminoácidos tales como Lipacida C8G, fragancias, aceites perfumantes, colorantes, pigmentos, espesantes, sustancias tensioactivas, tensioactivos aniónicos, anfóteros, catiónicos o no iónicos, emulsionantes, emolientes, sustancias humectantes, agentes fotoprotectores (filtros UVA, filtros UVB, pigmentos inorgánicos tales como ZnO), lípidos, aceites, aceites esenciales (p. ej., aceite de árbol de té), extractos de plantas, polímeros tales como derivados de celulosa, poliácridatos, polímeros catiónicos tales como chitosán o derivados de chitosán, electrolitos, vitaminas, biotina, pantenol, agentes de crecimiento del cabello, disolventes tales como (preferiblemente) agua, alcoholes, éteres glicólicos, reguladores del pH, tampones, estabilizantes de espuma, ácidos carboxílicos y sus sales, ácidos hidroxi-carboxílicos y sus sales, agentes de complejación, sustancias naturales, espesantes, aminoácidos, proteínas, hidrolizados de proteínas, hidratos de carbono y derivados de hidratos de carbono, polisacáridos, sustancias para el cuidado u otros constituyentes habituales de una formulación cosmética.

45 Los ejemplos de sustancias tensioactivas que se pueden usar ventajosamente según la invención son jabones convencionales, p. ej., sales sódicas de ácidos grasos, sulfatos de alquilo, éteres de alquil-sulfato, alcano y alquilbencenosulfonatos, sulfoacetatos, sulfobetaínas, sarcosinatos, amidosulfobetaínas, sulfosuccinatos, semiésteres del ácido sulfosuccínico, éteres de alquil-carboxilatos, condensados de proteína-ácido graso, alquilbetaínas y amidobetaínas, alcanolamidas de ácidos grasos, derivados de éteres poliglicólicos.

55 Se da preferencia a las sustancias tensioactivas no iónicas, anfóteras o catiónicas cuya concentración puede estar

entre 0,1 y 40% en peso, preferiblemente entre 0,5 y 20% en peso, más preferiblemente entre 1 y 10% en peso, basado en la preparación.

De acuerdo con la invención, se da preferencia particular a una preparación que comprende

- 5 a) de 0,008 a 0,03% en peso, p. ej., de 0,014 a 0,018% en peso, tal como aproximadamente 0,016% en peso, de éter monoalquílico del glicerol (tal como éter 1-(2-etilhexílico) del glicerol),
- b) de 0,0008 a 0,003% en peso, p. ej., de 0,0014 a 0,0018% en peso, tal como aproximadamente 0,0016% en peso, de alcano de bispiridinio (tal como dihidrocloruro de octenidina),
- c) de 0,04 a 0,15% en peso, p. ej., de 0,07 a 0,085% en peso, tal como aproximadamente 0,0825% en peso, de poliol (tal como 1,2-propilenglicol) y
- 10 d) de 30 a 200 ppb, p. ej., de 60 a 100 ppb, tal como aproximadamente 80 ppb, de antioxidante (tal como vitamina E).

En una realización preferida de la invención, las preparaciones se formulan para aplicación tópica en forma de emulsiones (p. ej., cremas, lociones), geles, soluciones, embrocaciones, pomadas, pulverizadores o polvos.

Preparación desodorante

- 15 Según la invención, se prefieren combinaciones y preparaciones con principios activos desodorantes adicionales y principio activo antitranspirante tal como sales de aluminio. Así se puede lograr, entre otros, mejor eficacia, mejor resistencia al agua, efecto más duradero y mejor aceptación por el consumidor.

20 Las preparaciones en forma de desodorantes son, por ejemplo, pulverizadores de aerosoles, de aplicación con bola, barras desodorantes, polvos, pulverizadores de polvo, composiciones de lavado íntimo etc. Las preparaciones según la invención también se pueden combinar con astringentes tales como, preferiblemente, sales de aluminio, p. ej., oxiclорuro de aluminio. Por lo tanto se puede controlar el olor corporal desagradable sobre una base más amplia (reducción de la transpiración y prevención de la degradación microbiana de la transpiración).

Las preparaciones de acuerdo con la invención también se pueden combinar con fragancias que contribuyen al efecto de desodorización y aumentan la aceptación por el consumidor.

- 25 Preparación para el tratamiento de piel con manchas, acné

Una realización adicional de la invención es el uso de la combinación según la invención para producir una preparación (cosmética o farmacéutica) para el tratamiento de piel con manchas, acné. En relación con esto, las preparaciones típicamente comprenden de 0,05 a 5% en peso, preferiblemente de 0,1 a 2% en peso y en particular preferiblemente de 0,2 a 1% en peso, de la combinación, en cada caso basado en el peso total de las preparaciones, y también opcionalmente uno o más principios activos, auxiliares y/o aditivos.

30 Los principios activos, auxiliares y/o aditivos opcionales de este tipo se seleccionan preferiblemente de principios activos tales como ácidos alfa-hidroxicarboxílicos, peróxido de benzoilo, ácido linoleico, retinoides (tretinoína, isotretinoína), ácido salicílico, compuestos de cinc, etc., sustancias vehículo tales como agua, alcoholes inferiores (tales como etanol, isopropanol), polioles tales como propilenglicol, glicerol, sustancias grasas o de tipo grasa para el cuidado de la piel tales como ésteres de ácido oleico, alcoholes grasos, espesantes tales como hidroxietilcelulosa, hidroxipropilcelulosa, poliácridatos, polivinilpirrolidona, ciclometiconas, emulsionantes (p. ej., no ionogénicos tales como polietoxilatos de alcohol graso, ésteres de sorbitán etoxilados), éteres poliglicólicos de cadena larga, tampones (pH 4-9, preferiblemente 5-7), aceites ésteres (p. ej., aceite de yoyoba), aceites de silicona, aceites (p. ej., aceite de oliva), perfume, colorantes, antioxidantes (p. ej., vitamina E, BHT en cantidades de 0,01 a 0,05% en peso) o

35 sustancias base cosméticas o farmacéuticas habituales para producir emulsiones de aceite/agua o de agua/aceite, geles, lociones y otras formas de preparaciones.

40

Preparación para el tratamiento de la caspa

45 una realización preferida de la preparación según la invención es una composición de lavado del cabello anticaspa, un enjuague anticaspa para el cabello o un tratamiento anticaspa para el cabello, que comprende la combinación de acuerdo con la invención en una cantidad de 0,1 a 10% en peso, preferiblemente de 0,3 a 6% en peso, en particular preferiblemente de 0,5 a 2% en peso, basado en el peso total de la preparación, y también opcionalmente uno o más principios activos, auxiliares y/o aditivos.

Los principios activos, auxiliares y/o aditivos opcionales de este tipo se seleccionan preferiblemente de principios activos tales como ketoconazol, climbazol, clotrimazol, bifonazol y ácido undecilénico, octopirox, ciclopirox, pirtionona de zinc, ácido linoleico conjugado, disulfuro de selenio, ácido salicílico, etc.

50

Los vehículos incluyen materiales que se usan normalmente en productos para el cuidado del cabello, tales como agua, disolventes (p. ej., etanol, isopropanol), humectantes, espesantes, perfume o fragancia, colorantes, tintes,

pigmentos, agentes perlantes, alcoholes grasos, ésteres de ácidos grasos, amidas grasas, emulsionantes, siliconas, modificadores de la viscosidad, conservantes, agentes de complejación, tales como EDTA, filtros UV, aminoácidos y derivados de aminoácidos, proteínas, hidrolizados de proteínas, hidratos de carbono, polisacáridos, extractos vegetales, tampones, etc.

5 La presente invención también proporciona una composición de tratamiento para el cabello que debe enjuagarse y tiene un contenido de la combinación según la invención, tras cuya aplicación, después de aclarar con agua, tiene lugar una mayor deposición de los principios activos sobre el cabello y el cuero cabelludo (efecto de asentamiento, depósito). En relación con esto, la combinación de acuerdo con la invención ayuda al cuidado, al efecto de promoción del brillo y efecto de mejora de la facilidad del peinado de la composición. También se proporciona una
10 composición que permanece en la piel, cuero cabelludo o el cabello después de usar.

Preferiblemente, la composición para el cuidado del cabello es un champú o una composición de acondicionamiento para el cabello que típicamente comprende agua en una cantidad de aproximadamente 50 a aproximadamente 98% en peso, preferiblemente de 60 a 90% en peso, en particular preferiblemente al menos 70% en peso. El champú comprende uno o más tensioactivos de lavado, que son cosméticamente compatibles y adecuados para la aplicación
15 local en el cabello.

Los ejemplos de tensioactivos de lavado son tensioactivos aniónicos, tales como sulfatos de alquilo, éteres de alquilsulfatos, alquilarilsulfonatos, sulfosuccinatos de alquilo, N-alkuil-sarcosinatos, fosfatos de alquilo, éteres de alquil-fosfatos, éteres de alquil-carboxilatos, alfa-olefinosulfonatos, o sales de los mismos, etc.; tensioactivos anfóteros tales como óxidos de alquilamina, alquilbetainas, alquilamidopropilbetainas, alquilsulfobetainas, glicinatos de alquilo, anfopropionatos de alquilo, etc.; tensioactivos no iónicos (p. ej., como cotensioactivos), tales como etoxilatos de alcohol graso, alquil o dialquil-alcanolamidas, poliglucósidos de alquilo (APG), etc.; tensioactivos catiónicos, tales como sales de alquil(C8-C20)trimetilamonio, sales de cetilpiridinio, sales de benzalconio, sales de dialquildimetilamonio, etc.; polímeros catiónicos tales como, por ejemplo calidades policuaternio, calidades Luviquat, calidades Gafquat, polisacáridos catiónicos, derivados de celulosa catiónicos, etc.

25 Preparación para el tratamiento de hongos de los pies/piel

Una realización adicional de la invención es el uso de la combinación según la invención para producir una preparación (cosmética o farmacéutica) para el tratamiento de hongos de los pies/piel. En relación con esto, las preparaciones típicamente comprenden de 0,05 a 10% en peso, preferiblemente de 0,1 a 5% en peso y en particular preferiblemente de 0,2 a 2% en peso de la combinación, en cada caso basado en el peso total de las preparaciones,
30 y también opcionalmente uno o más principios activos, auxiliares y/o aditivos.

Los principios activos, auxiliares y/o aditivos opcionales de este tipo se seleccionan preferiblemente de principios activos tales como triclosán, fanesol (en particular para combatir hongos de la piel en preparaciones cosméticas), etc.

Los principios activos fungicidas (antimicóticos) usados son, por ejemplo, compuestos de la clase de imidazoles, triazoles, bencilaminas, alilaminas, morfolinis, fenoles, compuestos de amonio cuaternario etc., butenafina, terbinafina, ketoconazol, miconazol, bifonazol, clotrimazol, climbazol, econazol etc., también ácido undecilénico y derivados del ácido undecilénico.

Los auxiliares y aditivos habituales usados en las preparaciones para controlar los hongos de pies/piel son disolventes, tales como agua, alcoholes inferiores, polioles, éteres glicólicos, polietilenglicol, tampones, conservantes, humectantes, agentes de complejación, antioxidantes, emulsionantes, promotores de la penetración, espesantes, modificadores de la viscosidad, perfume o fragancia, bases de pomadas, protectores de la piel, agentes para el cuidado de la piel, aceites, extractos de plantas, polímeros, aceites esenciales, extractos de plantas, hidratos de carbono y derivados de hidratos de carbono, alcoholes grasos, sustancias tensioactivas etc.

Mediante el uso de las combinaciones según la invención, sorprendentemente se pueden proporcionar eficazmente preparaciones de una forma baja en COV o exentas de COV. Esto contribuye a no dañar el medio ambiente y la aceptación del cliente de las preparaciones. En cambio, la formulación de ejemplo D en el documento DE 4240674 C1 comprende 40% en peso de etanol.

Se ha encontrado, por ejemplo, que usando una concentración de 0,1% en peso del concentrado particularmente preferido descrito antes (corresponde simplemente a 0,016% en peso de éter de glicerol, tal como éter 1-(2-
50 etilhexílico) del glicerol, 0,0016% en peso de alcano de bispiridinio (tal como dihidrocloruro de octenidina), 0,0825% en peso de poliol (tal como 1,2-propilenglicol) y aproximadamente 80 ppm de antioxidante (tal como vitamina E), se logra una eficacia como principio activo desodorante comparable a 0,1% en peso de triclosán. Esto también era sorprendente en vista de la gran cantidad de principios activos que se establecen obligatoriamente en la preparación desodorante D en el documento DE 4240674 C1 (0,9% en peso de éter monoalquílico de glicerol, 0,1% en peso de alcano de bispiridinio y 1% en peso de 1,2-propilenglicol). No se podía deducir del documento DE 4240674 C1 que proporcionando las combinaciones según la invención, se pudiera hacer un principio activo desodorante en forma de concentrado, comparable con el triclosán que contiene cloro, no deseado.

Las combinaciones según la invención son estables en el almacenamiento, es decir, no se observa la formación de productos de descomposición no deseados ni la degradación del principio activo incluso tras almacenamiento a temperatura elevada, tal como 40°C, a lo largo de un periodo de 3 meses, 6 meses, 9 meses o incluso 12 meses.

5 Las preparaciones según la invención tienen eficacia comparativamente selectiva y, a la baja concentración de uso necesaria, protegen la microflora de la piel, que es importante para la protección de defensa de gérmenes oportunistas o patógenos.

10 Las preparaciones según la invención se caracterizan por una buena compatibilidad con la piel, son compatibles con un gran número de auxiliares y aditivos cosméticos habituales, son adecuadamente rápidamente solubles en agua (a diferencia de muchos otros principios activos desodorantes tales como el triclosán o sustancias eficaces como antimicóticos tales como clotrimazol, ketoconazol, bifonazol, econazol, tioconazol, ciclopiroxolamina, terbinafina, amorolfina etc.) y no se acumulan en la piel. Por otra parte, como resultado de su carácter anfífilo, se unen a constituyentes de la piel y/o el cabello y por lo tanto son eficaces durante más tiempo.

15 Los constituyentes individuales de las preparaciones según la invención son conocidos como aditivos y humectantes para el cuidado de la piel (éter de glicerol tales como Sensiva SC 50) y/o como desinfectantes de heridas (alcanos de bispiridinio tales como octenidina) y por lo tanto, además de su función desodorizante, ayudan a mejorar el estado de la piel o protegen contra infecciones (infección de heridas de lesiones de la piel relativamente pequeñas, en particular las llamadas superinfecciones de la piel por hongos y bacterias).

20 Las preparaciones según la invención protegen contra microorganismos (bacterias, levaduras, hongos) que penetran en y/o habitan en la piel y los folículos capilares y de síntomas tales como escamado, picor o manchas de la piel (eczemas, piel grasa) o que pueden afectar de forma adversa al bienestar de otra forma.

Las combinaciones de principios activos según la invención, pueden prevenir la formación de síntomas seborreicos, en particular de caspa y también eliminan síntomas seborreicos existentes, en particular la caspa.

25 Las preparaciones según la invención protegen contra los fenómenos cosméticos, dermatológicos y médicos causados por estos microorganismos (p. ej., olor de la axila, olor de pies, olor corporal, caspa, acné, superinfecciones, infecciones de heridas).

Las preparaciones según la invención reducen la adhesión de microorganismos a estructuras de la superficie de células vivas y muertas de la piel humana, y haciendo esto contrarrestan los efectos no deseados de los microorganismos en la piel.

30 Las ventajas de usar las presentes combinaciones de principios activos frente a la técnica anterior son la eficacia significativamente mayor comparada con las concentraciones necesarias del principio activo individual que logra un efecto comparable. Esto permite el desarrollo de productos más suaves, más cuidadosos con la piel.

Las preparaciones según la invención se puede usar como productos con un intervalo de pH amplio, el intervalo de pH es ventajosamente de 3 a 9, preferiblemente de 4 a 8, en particular preferiblemente de 5 a 7.

REIVINDICACIONES

- 1.- Combinación de principios activos que consiste en:
- a) de 8% a 30% en peso de éter 1-(2-etilhexílico) del glicerol o de éter 1-(dedecílico) del glicerol,
 - b) de 0,8% a 3% en peso de dihidrocloruro de octenidina,
 - 5 c) de 40% a 88% en peso de poliol que se selecciona de 1,2-propilenglicol, glicerol, eritritol, 1,2,6-hexanotriol, inositol, lactitol, maltitol, manitol, metilpropanodiol, fitantriol, poligliceroles, sorbitol y xilitol, y
 - d) de 0,003% a 0,02% en peso de antioxidante seleccionado de vitamina E y sus derivados, 3-terc-butil-4-hidroxianisol y 2,6-di-terc-butil-p-cresol, estando dicha combinación de principios activos exenta de alcohol alifático monohídrico, de óxido de amina, de alcoholes aromáticos, y siendo la relación en peso de la suma de los
- 10 componentes a) b) y d) al componente c) de 1:2 a 1: 8.
- 2.- Combinación según la reivindicación 1, caracterizada porque el poliol es 1,2-propilenglicol.
- 3.- Combinación según una de las reivindicaciones precedentes, caracterizada porque el antioxidante se selecciona de vitamina E y 3-terc-butil-4hidroxianisol.
- 4.- Combinación según una de las reivindicaciones precedentes, caracterizada porque consiste en:
- 15 a) de 14 a 18% en peso de éter 1-(2-etilhexílico) del glicerol,
 - b) de 1,4 a 1,8% en peso de dihidrocloruro de octenidina,
 - c) de 70 a 85% en peso de 1,2-propilenglicol y
 - d) de 0,006 a 0,010% en peso de vitamina E.
- 5.- Combinación según una de las reivindicaciones precedentes, para usar en un método de tratamiento del olor
- 20 corporal no deseado.
- 6.- Preparación cosmética que comprende de 0,05 a 1% en peso, de la combinación según una de las reivindicaciones 1 a 4, y opcionalmente uno o más principios activos, auxiliares y/o aditivos adicionales.