

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 919 723**

21 Número de solicitud: 202131039

51 Int. Cl.:

A61K 31/16 (2006.01)

A61L 2/16 (2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A1

22 Fecha de presentación:

05.11.2021

43 Fecha de publicación de la solicitud:

27.07.2022

71 Solicitantes:

BIO LOGIC CROP SCIENCE S.L. (100.0%)
C/ Amadeo de Saboya 1, 1
46010 Valencia (Valencia) ES

72 Inventor/es:

CASAÑA GINER, Víctor

74 Agente/Representante:

SOLER LERMA, Santiago

54 Título: **COMPOSICIÓN CON ACTIVIDAD VIRUCIDA, SU USO Y MÉTODO DE APLICACIÓN**

57 Resumen:

Cada vez más, las enfermedades infecciosas debidas a virus, bacterias, hongos y otros microorganismos transmisibles por contacto, gotas y/o aerosoles, adquieren más importancia debido a la globalización y la facilidad de diseminación entre países muy distantes. Un ejemplo característico es la pandemia de la Gripe A en 2009 y las pandemias de SARS por el virus SARS-Cov en 2003 y la de covid-19 por el virus SARS-CoV-2 en 2020. Para combatir los contagios que puedan producirse por contacto, o por gotas aerosolizadas (incluyendo aquellas superficies contaminadas con agentes infecciosos) se requiere una paleta más amplia de antimicrobianos y virucidas. La presente invención resuelve este problema para infecciones víricas con el uso de un surfactante de baja toxicidad del grupo de metilsulfatos de trimetilamonio.

ES 2 919 723 A1

DESCRIPCIÓN

COMPOSICIÓN CON ACTIVIDAD VIRUCIDA, SU USO Y METODO DE APLICACION

5 Tal y como su nombre indica, la presente invención se refiere a compuestos con actividad virucida, en concreto que comprendan virucidas metilsulfatados de amidas de baja toxicidad activos contra coronavirus, virus de la gripe y virus sin envuelta lipídica.

Uno de los objetivos de la presente invención es su utilidad a nivel industrial y regulatorio
10 para afrontar situaciones de necesidad contra agentes infecciosos de una forma rápida, segura y de acuerdo con los estrictos requisitos legales requeridos a biocidas.

ANTECEDENTES

15 La EPA (Environmental Protection Agency, USA) tiene autorizados los siguientes ingredientes activos contra coronavirus humanos y en particular contra covid-19 (entendiéndose en lo sucesivo que el covid-19 es el síndrome -la enfermedad- y el SARS-CoV-2 el virus que provoca el síndrome covid-19; por el contexto se deduce sencillamente si se refiere al virus o al síndrome o a ambos, por ejemplo, contra el covid-19, implica contra el
20 SARS-CoV-2 e implícitamente, contra el covid-19).

Compuestos declarados activos contra covid-19 por la EPA son:

- 1,2-Hexanediol
- Chlorine dioxide
- Chlorine dioxide; Quaternary ammonium
- 25 • Citric acid
- Citric acid; Thymol
- Dodecylbenzenesulfonic acid
- Dodecylbenzenesulfonic acid; L-Lactic acid
- Ethanol
- 30 • Ethanol (Ethyl alcohol); Phenolic
- Glycolic acid
- Hydrochloric acid
- Hydrogen chloride
- Hydrogen peroxide
- 35 • Hydrogen peroxide; Ammonium carbonate; Ammonium bicarbonate

- Hydrogen peroxide; Octanoic acid; Peroxyacetic acid (Peracetic acid)
- Hydrogen peroxide; Peroxyacetic acid (Peracetic acid); Octanoic acid
- Hydrogen peroxide; Peroxyoctanoic acid; Octanoic acid
- Hydrogen peroxide; Peroxyoctanoic acid; Peroxyacetic acid (Peracetic acid)
- 5 • Hydrogen peroxide; Quaternary ammonium
- Hydrogen peroxide; Silver
- Hypochlorous acid
- Iodine
- Isopropanol
- 10 • Isopropanol; Phenolic
- Isopropanol; Quaternary ammonium
- L-Lactic acid
- Octanoic acid
- Peroxyacetic acid (Peracetic acid)
- 15 • Peroxyacetic acid (Peracetic acid); Hydrogen peroxide
- Phenolic
- Phenolic; Ethanol (Ethyl alcohol)
- Polyhexamethylene biguanide; Quaternary ammonium
- Potassium peroxymonosulfate; Sodium chloride
- 20 • Quaternary Ammonium
- Silver
- Silver ion; Citric acid
- Sodium carbonate peroxyhydrate; Tetraacetyl ethylenediamine
- Sodium chloride
- 25 • Sodium chlorite
- Sodium chlorite; Citric acid
- Sodium chlorite; Sodium dichloroisocyanurate dihydrate
- Sodium dichloroisocyanurate
- Sodium hypochlorite
- 30 • Sodium hypochlorite; Sodium carbonate
- Tetraacetyl ethylenediamine
- Thymol
- Triethylene glycol; Quaternary ammonium

Entre los compuestos virucidas conocidos, se encuentran, a modo no extensivo de todos los compuestos descritos hasta la fecha los siguientes:

- Modificadores de pH
- Peróxidos y derivados
- 5 • Metales
- Iodados y derivados
- Clorados y derivados
- Brominados y derivados
- Terpenos
- 10 • Cationes liposolubles
- Sales
- Alcoholes de cadena corta (nº carbonos menor o igual a cuatro)
- Fenoles
- Aldehídos de cadena corta (nº carbonos menor o igual a cuatro)
- 15 • Aminas terciarias

Dentro de los cationes liposolubles, hay dos grupos relevantes, principalmente los derivados de biguanida y los compuestos de amonio cuaternario.

Dentro de los compuestos de amonio cuaternario, están descritos con actividad virucida, entre otros:

- 20 • Cloruro de tetradecildimetilbenzilamonio {TDBAC}
- Cloruros de alquildimetilbencilamonio (en donde el grupo alquilo es elegido entre dodecanilo, tetradecanilo y/o hexadecanilo)
- Cloruros de alquildimetiletilbencilamonio (en donde el grupo alquilo es elegido entre dodecanilo y/o tetradecanilo) {ADEBAC}
- 25 • Cloruro de didecildimetilamonio
- Cloruro de N,N-dimetil-N-octil-1-octanaminio
- Cloruro de N-decil-N,N-dimetil-1-decanaminio
- Cloruro de N,N,N-trimetil-1-hexadecanaminio
- Cloruro de N,N-dimetil-N-[3-(trimetoxisilil)propil]-1-octadecanaminium
- 30 • Hidrocloruro de poli(iminoimidocarboniliminoimidocarbonilimidohexametileno)

En lo que respecta a los compuestos de amonio cuaternario, es notable que no todos ellos han sido descritos como virucidas, incluso algunos sólo muestran actividad virucida contra virus envueltos con una capa lipídica. Tampoco se aprecia el uso de metilsulfatos de compuestos de amonio cuaternario cuyas cadenas lipídicas posean alguna insaturación.

Como se observa, existen multitud de grupos químicos que tienen una actividad virucida de contacto, sin embargo, la mayoría de estos tiene problemas de toxicidad, sobre todo por inhalación y también ocular. Un problema del Estado de la Técnica es encontrar virucidas aplicados mediante técnicas que micronizan las gotas que contienen los virucidas (como
 5 aquellas generadas en pistolas aerosol o aeroloses a presión) que no tengan toxicidad elevada por inhalación para mamíferos, sean muy peligrosos corrosivos oculares y además, sean biodegradables. Hay que tener en cuenta que los virucidas empleados en superficies pueden estar en contacto con la piel, comida y otros utensilios que pueden terminar siendo una vía de entrada al cuerpo humano.

10 En lo siguiente, dada la complejidad de los compuestos y las muy diversas formas de nomenclatura que tienen (EINECS, CAS, IUPAC, nombres comerciales, etc.) se empleará en la terminología de los compuestos descritos en la presente invención el sistema Chem to Name tal y como se describe en "Name=Struct: A Practical Approach to the Sorry State of Real-Life Chemical Nomenclature" (J. Brecher, 1999, J. Chem. Inf. Comput. Sci. 1999, 39,
 15 943-950; DOI: 10.1021/ci990062c), tal y como adoptan diversos paquetes informáticos como ChemBioOffice® de Cambridge Software y otros.

US 6,207,241 describe el sulfato de metiltrimetil-[3-(undec-10-enoilamino)propil]azanio como componente de un champú antifúngico, combinado con un fungicida inhibidor de la síntesis de ergosterol. Sin embargo, su efecto no es el de un fungicida per se, sino la de
 20 sinergizar el efecto del mencionado fungicida inhibidor de la síntesis de ergosterol o el propio sulfato de metiltrimetil-[3-(undec-10-enoilamino)propil]azanio, frente a *Malassezia furfur* (*Pytirosporum ovale*), *Epidermophyton*, *Microsporum* y *Trychophyton*. Industrialmente, US 6,207,241 describe que el compuesto está presente en un ca. 40-45% en Rewocid UTM 185. A día de hoy, Evonik presenta el compuesto como descatalogado y como usado en
 25 champús, champús anticaspa, jabones líquidos, mascarillas y cremas para la piel y lociones, a una proporción de uso del 1 al 3%. Sin embargo, ni menciona ni sugiere su uso como virucida.

Adicionalmente, el producto Tetranyl U de Kao Chemicals, describe el sulfato de metiltrimetil-[3-(undec-10-enoilamino)propil]azanio en su Technical Data Sheet (Ficha
 30 Técnica) como un surfactante catiónico con efecto fungicida conocido con efecto en *Candida albicans*, *Aspergillus niger*, y con efecto bactericida frente a *Staphylococcus aureus*, *Pseudomonas aeruginosa* y *Escherichia coli*.

El uso de acuerdo con el registro en curso de la ECHA de los compuestos de la presenta invención (por ejemplo, el compuesto con código de ensayo BLCS-19) es en cosmética y
 35 aseo personal, así como para ser incorporado en productos de lavado y limpieza, no existiendo ninguna mención de sus propiedades virucidas.

DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

5 La presente invención es una solución al problema de uso de virucidas alternativa, superando los inconvenientes arriba mencionados, basada en el uso de compuestos metilsulfatos de amidas insaturadas de N,N,N-trimetilpropan-1-aminio o de N,N,N-dimetiletil-1-aminio.

En concreto las siguientes: Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N,N,N-trimetil-propan-1-aminio, Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N,N,N-trimetilpropan-1-aminio, Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio y Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio.

De los ensayos realizados, se obtiene que son compuestos virucidas de virus tanto con envuelta lipídica como sin ella. Por lo tanto, pueden ser aplicados para desinfección usados a un porcentaje que es fácil de deducir para el experto en la materia basado en la observación de la cantidad efectiva para solventar las posibles diferencias entre sensibilidad de los virus frente a los compuestos de la presente invención.

Esto es, lo virus para los cuales los compuestos de la presente invención se pueden aplicar son:

Tabla 1. Virucidas de acuerdo con la presente invención

Código de ensayo: BLCS-19

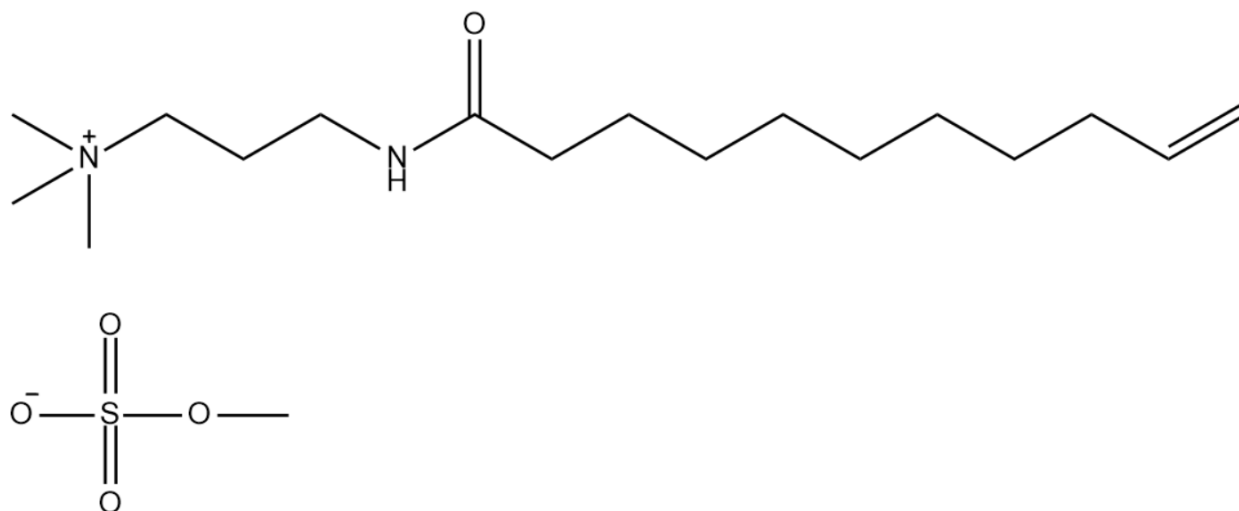
Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N,N,N-trimetil-propan-1-aminio

25 Fórmula química: C₁₈H₃₈N₂O₅S

Masa exacta: 394.25 u.m.a.

Masa molecular: 394.57 u.m.a.

Análisis elemental: C, 54.79%; H, 9.71%; N, 7.10%; O, 20.27%; S, 8.13%



Código de ensayo: BLCS-20

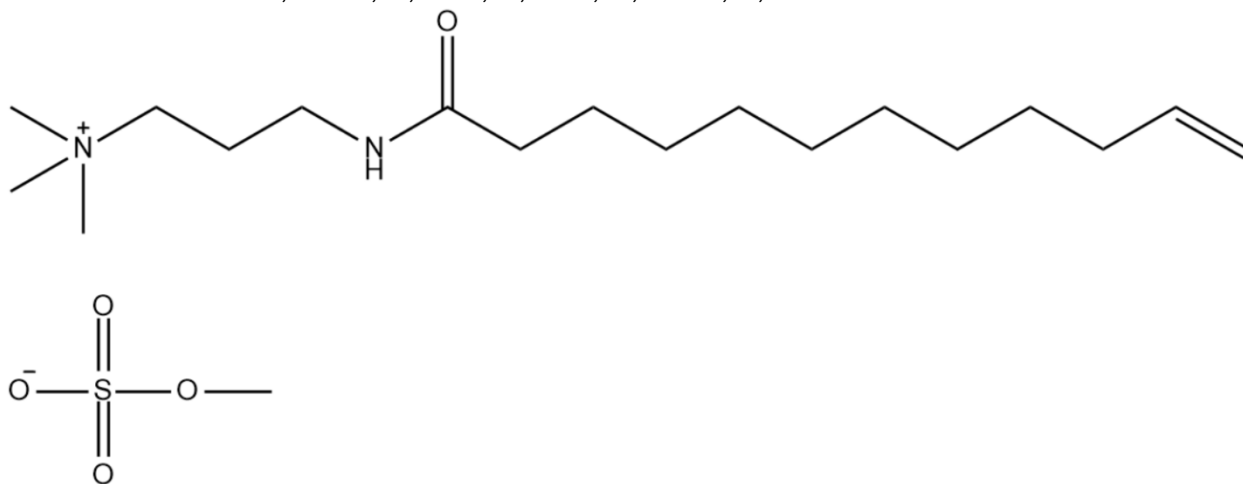
5 Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N,N,N-trimetilpropan-1-aminio

Fórmula química: C₁₉H₄₀N₂O₅S

Masa exacta: 408.27 u.m.a.

Masa molecular: 408.60 u.m.a.

Análisis elemental: C, 55.85; H, 9.87; N, 6.86; O, 19.58; S, 7.85



10

[Continuación de la Tabla 1]

Código de ensayo: BLCS-21

15 Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio

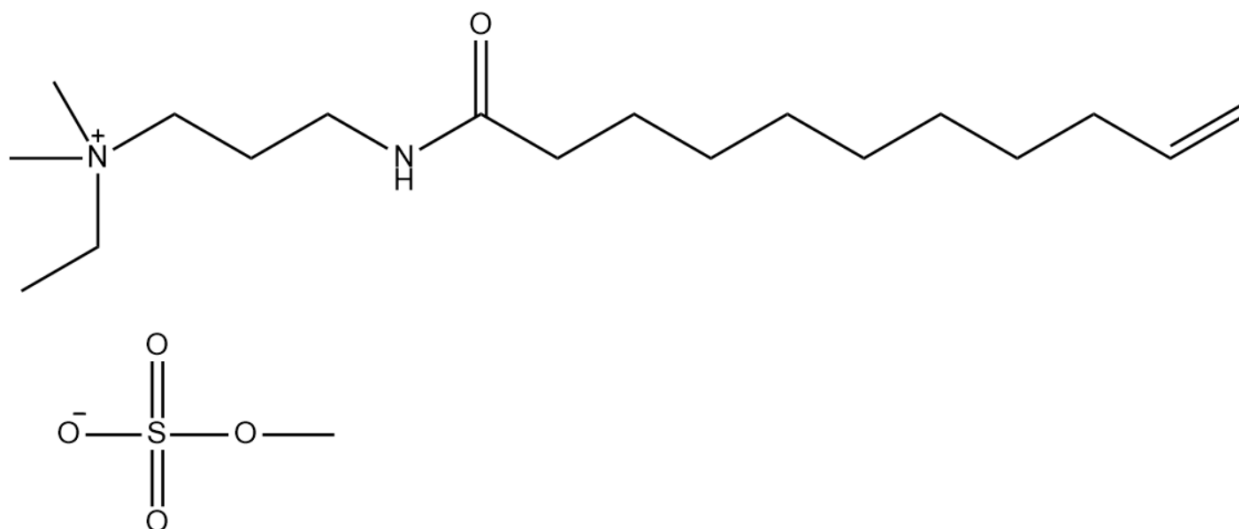
Fórmula química: C₁₉H₄₀N₂O₅S

Masa exacta: 408.27 u.m.a.

Masa molecular: 408.60 u.m.a.

Análisis elemental: C, 55.85; H, 9.87; N, 6.86; O, 19.58; S, 7.85

20



Código de ensayo: BLCS-22

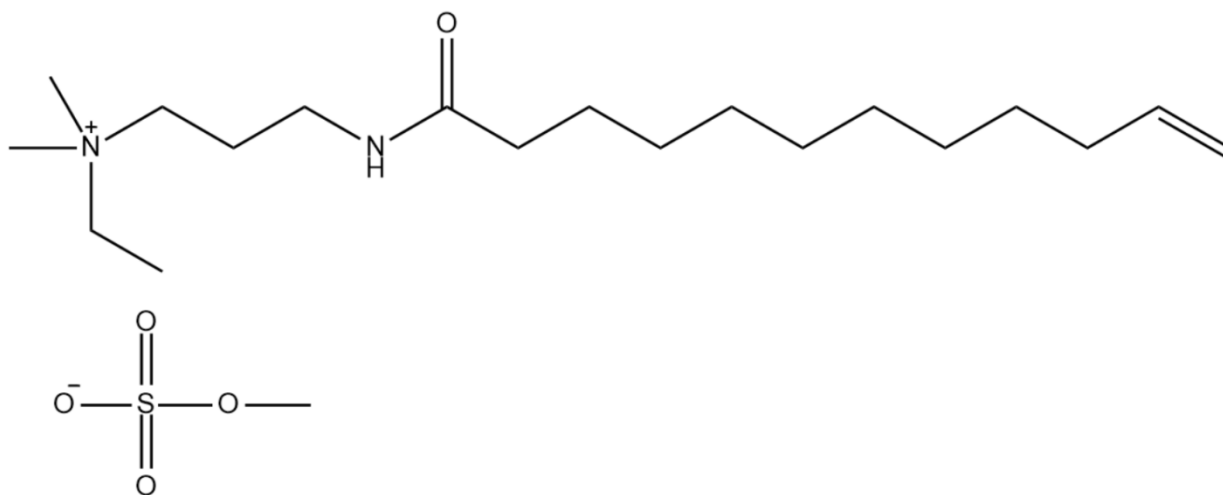
Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio

5 Fórmula química: C₂₀H₄₂N₂O₅S

Masa exacta: 422.28

Masa molecular: 422.62

Análisis elemental: C, 56.84%; H, 10.02%; N, 6.63%; O, 18.93%; S, 7.59%



10

EJEMPLOS DE FORMAS DE LLEVAR A CABO LA INVENCION

Ejemplo 1.

15 Se realizan la siguientes formulaciones de acuerdo a la presente invención y con las composiciones indicadas:

Fórmula 1-1

	Concentración p/p
Agua	99.75 %
Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N,N,N-trimetil-propan-1-aminio	0.25 %

5	Fórmula 1-2	Concentración p/p
	Etanol	70 %
	Propilenglicol	29.75 %
	Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N,N,N-trimetil-propan-1-aminio	0.25 %

- 10 Se procede al ensayo (declaradas por igual como solución de etanol al 70%, para evitar posibles sesgos en el análisis) de su actividad virucida conforme a la norma NF EN 14476:2013 + A2:2019, en poliovirus tipo 1, adenovirus tipo 5, norovirus murino y coronavirus 229E.

Las condiciones experimentales son las siguientes:

- 15 • Temperatura: 37 °C ± 1 °C
- Metodo de titulación TCID50 (Dosis infectiva 50% para cultivo celular)
- Concentraciones: 80%; 50%; 0.1 %.
- Tiempos de contacto: 5 minutos.
- 20 • Temperatura de contacto 30 °C ± 1 °C
- Diluyente utilizado Agua destilada estéril
- Aspecto de las diluciones del producto Transparentes.
- Sustancias interferentes:

Condiciones limpias en presencia de seroalbúmina bovina 0,3 g/L.

- 25 • Procedimiento para eliminar la citotoxicidad: Filtración molecular.
- Procedimiento para detener acción: Enfriamiento con hielo.

La reducción con el intervalo de confianza del 95% para cada formulación y virus se muestra en la siguiente tabla de resultados 1.

	Conc.	log reducción			Conc.	log reducción		
Poliovirus tipo 1 ATCC VR-192	80%	4.83	±	0.50	80%	4.92	±	0.48
Adenovirus tipo 5 ATCC VR-5	80%	5.49	±	0.34	80%	5.66	±	0.34
Norovirus murino S99 Berlin	80%	5.91	±	0.34	80%	6.8	±	0.35
	50%	4.17	±	0.05	50%	4.26	±	0.50
Coronavirus 229E ATCC VR-740	50%	>6	±	0.37	80%	>6	±	0.35
Influenza A H1N1 pdm09 A/California/7/2009	50%	5.83	±	0.40	80%	5.75	±	0.40

Se puede observar que la eficacia es similar tanto en presencia de etanol, que es virucida en cierta medida per se, para virus con envoltura lipídica (pero no si envoltura lipídica), como en presencia de agua.

Es remarcable la potenciación del efecto virucida si la composición contiene etanol y propilenglicol en el caso de norovirus, con una reducción de ca. 1 log.

Las soluciones de virucidas mencionadas, son usados según la aplicación y circunstancias en concentraciones del 0.01% al 5%, independientemente del medio líquido seleccionado.

Ejemplo 2.

Formulaciones alternativas a las ensayadas en Ejemplo 1.

Fórmula 2-1

	Concentración p/p
Agua	99.75 %
Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N,N,N-trimetilpropan-1-aminio	0.25 %

Fórmula 2-2

	Concentración p/p
Agua	99.75 %
Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio	0.25 %

Fórmula 2-3

	Concentración p/p
Agua	99.75 %
Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio	0.25 %

Fórmula 2-4

	Concentración p/p
Agua	50 %
Isopropanol	20 %
Etanol	20 %
Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N,N,N-trimetilpropan-1-aminio	5 %
Cloruro de benzalkonio	3 %
Povidona	1 %

	Fórmula 2-5	Concentración p/p
5	Etanol	70 %
	Propilenglicol	29.75 %
	Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N,N,N-trimetil-propan-1-aminio	0.25 %
10	Fórmula 2-6	Concentración p/p
	Etanol	70 %
	Propilenglicol	29.75 %
	Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio	0.25 %
15	Fórmula 2-7	Concentración p/p
	Etanol	70 %
	Propilenglicol	29.75 %
	Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio	0.25 %
20	Fórmula 2-8	Concentración p/p
	Etanol	70 %
	Propilenglicol	29.75 %
25	Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio	0.25 %

Los compuestos de la presente invención se pueden usar a cualquier concentración en la cual muestren actividad virucida en cualquier medio de presentación y aplicación (sea gas, líquido o sólido) y considerando el tiempo de contacto, siendo preferente la concentración de

30 0.01 % al 5 % en peso/peso, preferentemente entre el 0.1 % al 0.3 % en peso/peso, en agua o bien en una mezcla de etanol al 70 % peso/peso y propilenglicol. Estas soluciones se pueden formular, introducir en envases a presión generadores de aerosoles o pistolas aerosoles sin presión, para después ser esprayados.

Como podemos observar, los compuestos de la presente invención se pueden usar

35 eficazmente frente a virus con envuelta lipídica y virus sin envuelta lipídica.

Estos virus, en su nomenclatura preferente en inglés son: Adeno-associated virus, Aichi virus, Australian bat lyssavirus, Astrovirus MLB1, Astrovirus VA1, BK polyomavirus, Banna

virus, Barmah forest virus, Bundingo ebolavirus, Bunyamwera virus, Bunyavirus La Crosse, Bunyavirus snowshoe hare, Cercopithecine herpesvirus, Chandipura virus, Chikungunya virus, Cosavirus A, Cowpox virus, Coxsackievirus, Crimean-Congo hemorrhagic fever virus, Dengue virus, Dhori virus, Dugbe virus, Duvenhage virus, Eastern equine encephalitis virus, 5 Ebolavirus, Echovirus, Encephalomyocarditis virus, Epstein-Barr virus, European bat lyssavirus, GB virus C, Hepatitis G virus, Hantaan virus, Hendra virus, Hepatitis A virus, Hepatitis B virus, Hepatitis C virus, Hepatitis E virus, Hepatitis delta virus, Horsepox virus, Human adenovirus, Human astrovirus, Human bocavirus, Human bocavirus 2, Human coronavirus (including SARS-CoV-1, SARS-CoV-2, MERS, HKU1, E229, OC43, NL63), 10 Human cosaviruses A, B, C, D, E, Human cytomegalovirus, Human enterovirus 68, Human enterovirus 70, Human herpesvirus 1, Human herpesvirus 2, Human herpesvirus 6, Human herpesvirus 7, Human herpesvirus 8, Human immunodeficiency virus, Human papillomavirus 1, Human papillomavirus 2, Human papillomavirus 16, Human papillomavirus 18, Human papillomavirus 116, Human parainfluenza, Human parvovirus 4, Human parvovirus B19, 15 Human respiratory syncytial virus, Human rhinovirus, Human SARS coronavirus, Human spumaretrovirus, Human T-lymphotropic virus, Human torovirus, Influenza A virus, Influenza B virus, Influenza C virus, Influenza A(H1N1)pdm09 virus, Influenza A(H3N2) viruses, Influenza A(H5N1) virus, Isfahan virus, JC polyomavirus, Japanese encephalitis virus, Junin arenavirus, KI Polyomavirus, Klassevirus, Kunjin virus, Lagos bat virus, Lake Victoria 20 Marburgvirus, Langat virus, Lassa virus, Lordsdale virus, Louping ill virus, Lymphocytic choriomeningitis virus, Machupo virus, Mayaro virus, Measles virus, Melaka virus, Mengo encephalomyocarditis virus, Merkel cell polyomavirus, Mokola virus, Molluscum contagiosum virus, Monkeypox virus, Mumps virus, Murray valley encephalitis virus, New York virus, Nipah virus, Norwalk virus, O'nyong-nyong virus, Orf virus, Oropouche virus, Pichinde virus, 25 Poliovirus, Punta toro phlebovirus, Puumala virus, Rabies virus, Rift valley fever virus, Rosavirus A, Ross river virus, Rotavirus A, Rotavirus B, Rotavirus C, Rubella virus, Sagiyama virus, Salivirus A, Sandfly fever sicilian virus, Sapporo virus, Semliki forest virus, Seoul virus, Simian foamy virus, Simian virus 5, Sindbis virus, Southampton virus, St. Louis encephalitis virus, Tick-borne powassan virus, Torque teno virus, Toscana virus, Uukuniemi virus, Vaccinia virus, Varicella-zoster virus, Variola virus, Venezuelan equine encephalitis virus, Vesicular stomatitis virus, Western equine encephalitis virus, WU polyomavirus, West Nile virus, Yaba monkey tumor virus, Yaba-like disease virus, Yellow fever virus, Zika virus. 30 De particular interés es el uso de los compuestos de la invención para desinfección de los siguientes virus:

HPV (papiloma humano), HIV (SIDA), Herpes simplex, Herpes Varicella-Zoster (HZV), Hepatitis A, B, C, delta, E, adonovirus, coronavirus (en particular SARS y SARS-CoV-2), normovirus, coxackievirus.

Los compuestos de la presente invención se pueden mezclar con otros antisépticos conocidos para aumentar la eficacia biocida, tanto sinérgicamente como por adición de efectos.

En particular pueden ser combinados, a las dosis conocidas del estado de la técnica, con (en inglés): 3,6-Diamino-10-methylacridinium Chloride; 8-Hydroxyquinoline product; 8-Hydroxyquinoline Sulfate Ointment; Acriflavine product; Acrisorcin; Actinoquinol; Alexidine; Aluminum acetate; Ambazone; Aminacrine hydrochloride; Aminacrine product; Aminacrine Pyruvate; Aminacrine Undecylate; Amphomycin Calcium; Amylmetacresol; Auriclosene; Azelaic acid; Bensalan; Benzalkonium product; Benzethonium chloride; Benzethonium product; Benzododecinium; Benzododecinium bromide; Benzoin; Benzoxiquine; Benzoxonium Chloride; Benzoyl peroxide; Benzyl alcohol; Benzylsulfamide; Bibrocathol; Biclotymol; Bismuth subgallate; Bismuth Tribromophenate; Boric acid; Calcium hydroxide; Camphor product; Carbamide peroxide; Cetalkonium; Cetalkonium chloride; Cetrimonium; Cetrimonium Chloride; Cetylpyridinium Acetate; Cetylpyridinium Bromide; Cetylpyridinium chloride; Cetylpyridinium Chloride Anhydrous; Cetylpyridinium product; Chaulmosulfone; Chloramine-T; Chlorhexidine gluconate; Chlorhexidine hydrochloride; Chlorhexidine product; Chlorindanol; Chloroazodin; Chlorocresol; Chlorothymol; Chloroxilenol; Chlorphenesin product; Chlorphenoctium Amsonate; Cicliomenol; Cinoquidox; Cloflucarban; Cloguanamil; Cloponone; Cocamidopropylbetaine (in water); Crotamiton; Crotoniazide; Cuprimyxin; Cyclomenol; Dakins Solution; Debropol; Decominol; Deditonium; Deditonium Bromide; Dibromopropamidine product; Dichlorobenzyl alcohol; Dichloroxilenol; Dicresulene; Dipyrithione; Disiquonium; Disiquonium Chloride; Dodeclonium bromide; Dofamium; Dofamium Chloride; Famiraprinium Chloride; Fenticlor product; Fepradinol; Fludazonium; Fludazonium Chloride; Fluorosalan; Furmethoxadone; Gloxazone; Guaiacol product; Halazone; Halopenium Chloride; Haloprogin; Hexachlorophene product; Hexedine; Hexetidine product; Hexylresorcinol product; Hydrogen peroxide; Iodoform; Laurcetium; Laurcetium Bromide; Laurixamine; Lauroguadine; Laurolinium Acetate; Lopobutan; Mafenide acetate; Mecetronium; Mecetronium ethylsulfate; Mequidox; Meralein; Merbromin product; Mercurous iodide; Mercury ammonium chloride product; Metabromsalan; Methaniazide; Methylisothiazolinone; Monalazone; Monalazone Disodium; Morniflumate; Myristalkonium Chloride; Nibroxane; Nifuradene; Nifuraldezone; Nifuralide; Nifurethazone; Nifurfoline; Nifurimide; Nifurizone; Nifuroquine; Nifuroxazide; Nifuroxime; Nifurpirinol; Nifurpazine; Nifurvidine; Nifurzide; Nitromersol; Noxythiolin product; Octafonium Chloride; Octenidine

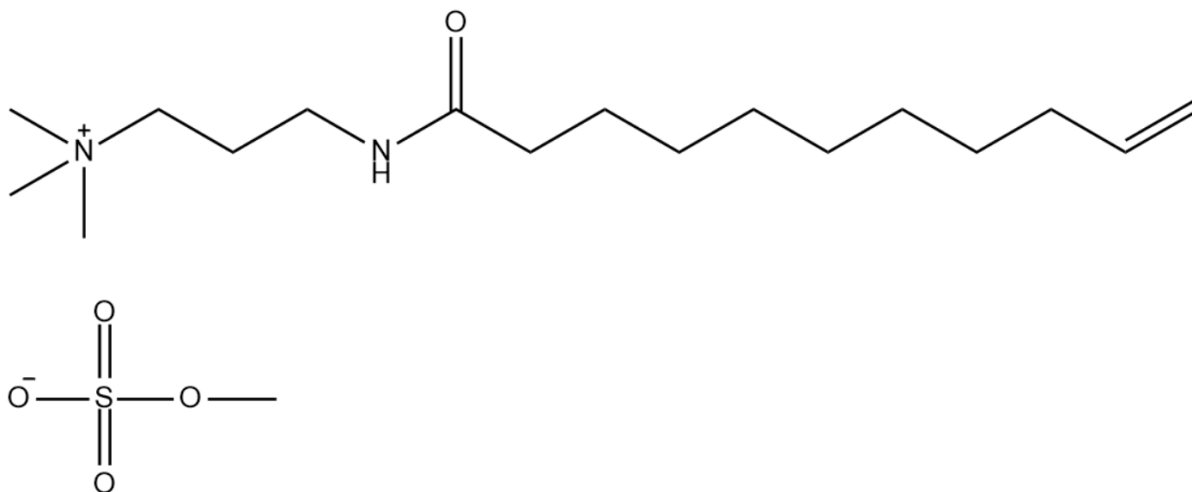
Saccharin; Olanexidine; Opratonium Iodide; Oxyquinoline sulfate; Parachlorophenol;
 Penoctonium; Penoctonium Bromide; Phanquone; Phenolate Sodium; Phenoxyethanol
 product; Phenyl ethyl alcohol; Phthalylsulfacetamide; Picloxydine; Picric acid; Pirralkonium;
 Pirralkonium Bromide; Pirtenidine; Pirtenidine Hydrochloride; Prednicarbate; Proflavine
 5 Dihydrochloride; Proflavine Hemisulfate; Proflavine product; Proflavine Sulfate; Resorcinol;
 Resorcinol Monoacetate; Romifenone; Salicylanilide; Sanguinarium Chloride; Selenium
 sulfide; Sepazonium; Sepazonium Chloride; Silver nitrate; Silver Oxide; Silver Picrate; Silver
 sulfadiazine; Sodium meralein; Sulfacecole; Sulfarsphenamine; Symclosene; Talmetoprim;
 Tavaborole; Temodox; Tetradonium; Tetradonium Bromide; Thimerosal product; Thymol
 10 iodide; Thymol product; Tibezonium; Tibezonium Iodide; Tolidium; Tolidium Chloride;
 Tribromsalan; Trichlorocarbanilide product; Undecoylium Chloride; Zinc Carbonate; Zinc
 phenolsulfonate;

En la medida los compuestos de la presente invención pueden ser aplicados in vivo, la
 15 presente invención de igual forma encuentra aplicación como antiviral tópico y/o sistémico
 en aplicaciones médicas y veterinarias. No hay razón alguna para que compuestos no
 ejerzan su actividad virucida y antiviral in vivo, especialmente observando que el
 metabolismo de compuestos similares muy estudiados, como el cloruro de benzalconio, no
 suponen una rápida degradación en mamíferos, tanto en animales de interés ecológico, en
 20 ganadería y mascotas como en humanos.

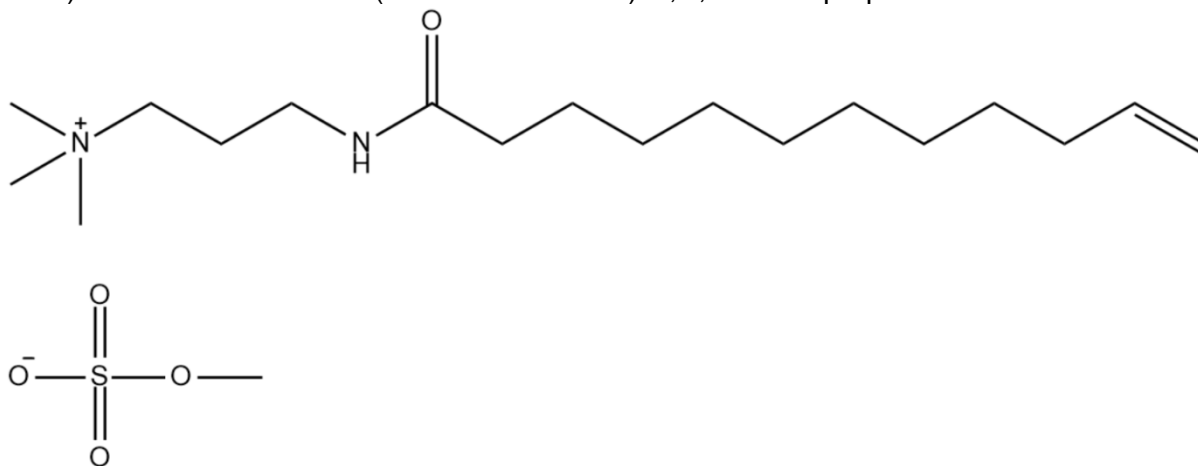
REIVINDICACIONES

1. Composición con actividad virucida caracterizada porque el(los) ingrediente(s) activo(s) es(son) un metilsulfatos de aminio seleccionado entre al menos uno de los siguientes compuestos:

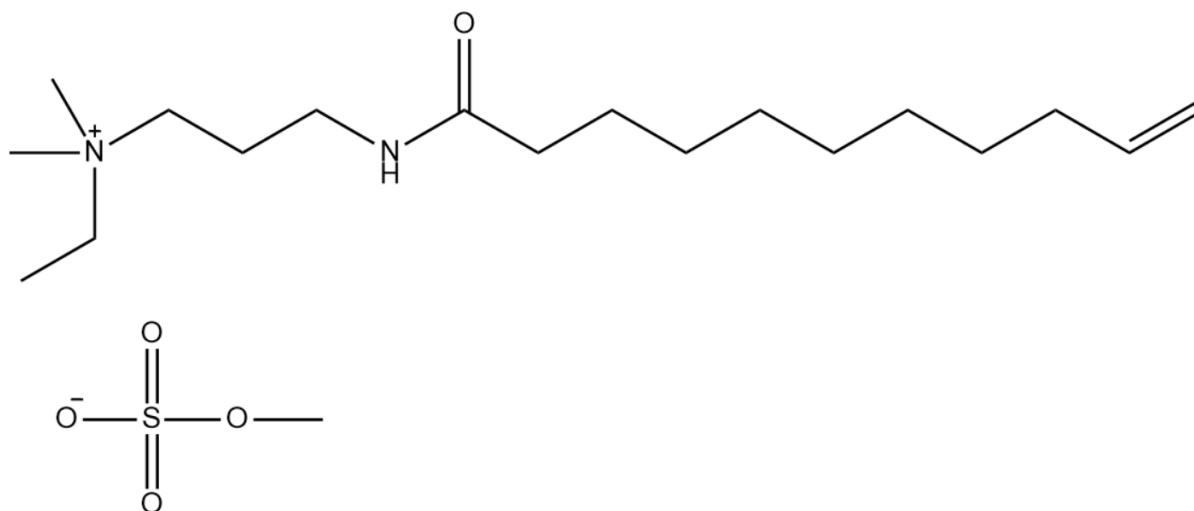
i) Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N,N,N-trimetil-propan-1-aminio



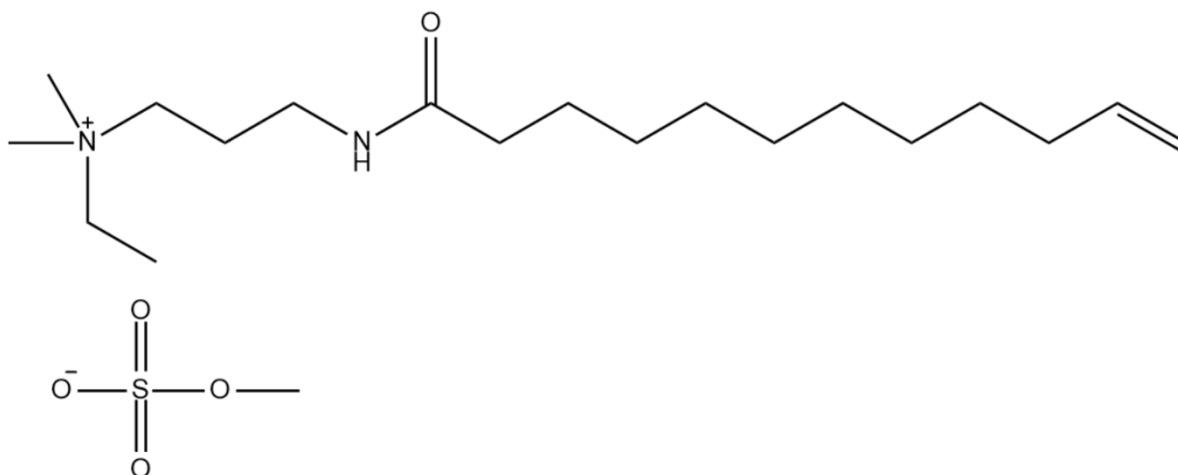
ii) Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N,N,N-trimetilpropan-1-aminio



iii) Metilsulfato de 3-(undec-10-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio



iv) Metilsulfato de 3-(dodec-11-enamido)-N-etil-N,N-dimetilpropan-1-aminio



5

2. Composición con actividad virucida de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizada porque los compuestos reivindicados están en una concentración de 0.01 % al 5 % en peso/peso en agua.
- 10 3. Composición con actividad virucida de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizada porque los compuestos reivindicados están en una concentración de 0.01 % al 5 % en peso/peso en una solución de etanol al 70% y el resto es propilenglicol.
4. Composición con actividad virucida de acuerdo con las reivindicación 1 caracterizada porque contiene al menos uno de los compuestos reivindicados y es activa frente a
- 15 virus con envuelta lipídica y virus sin envuelta lipídica.
5. Composición con actividad virucida de acuerdo con la reivindicación 4 caracterizada porque la concentración es del 0.1 % al 0.3 % en peso/peso.

6. Composición con actividad virucida de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizada porque se encuentra en el interior de una recipiente a presión generador de aerosol.
7. El uso de los compuestos conforme a la reivindicación 1 para la desinfección de virus patógenos para cualquier animal o vegetal.
- 5 8. El uso de los compuestos conforme a la reivindicación 1 para la desinfección de virus patógenos para animales mamíferos no humanos.
9. El uso de los compuestos conforme a la reivindicación 1 para la desinfección de los siguientes virus humanos:
Adeno-associated virus, Aichi virus, Australian bat lyssavirus, Astrovirus MLB1,
10 Astrovirus VA1, BK polyomavirus, Banna virus, Barmah forest virus, Bundingo ebolavirus, Bunyamwera virus, Bunyavirus La Crosse, Bunyavirus snowshoe hare, Cercopithecine herpesvirus, Chandipura virus, Chikungunya virus, Cosavirus A, Cowpox virus, Coxsackievirus, Crimean-Congo hemorrhagic fever virus, Dengue virus, Dhori virus, Dugbe virus, Duvenhage virus, Eastern equine encephalitis virus,
15 Ebolavirus, Echovirus, Encephalomyocarditis virus, Epstein-Barr virus, European bat lyssavirus, GB virus C, Hepatitis G virus, Hantaan virus, Hendra virus, Hepatitis A virus, Hepatitis B virus, Hepatitis C virus, Hepatitis E virus, Hepatitis delta virus, Horsepox virus, Human adenovirus, Human astrovirus, Human bocavirus, Human bocavirus 2, Human coronavirus (including SARS-CoV-1, SARS-CoV-2, MERS, HKU1, E229, OC43, NL63), Human cosaviruses A, B, C, D, E, Human cytomegalovirus, Human enterovirus 68, Human enterovirus 70, Human herpesvirus 1, Human herpesvirus 2, Human herpesvirus 6, Human herpesvirus 7, Human herpesvirus 8, Human immunodeficiency virus, Human papillomavirus 1, Human papillomavirus 2, Human papillomavirus 16, Human papillomavirus 18, Human papillomavirus 116, Human parainfluenza, Human parvovirus 4, Human parvovirus B19, Human respiratory syncytial virus, Human rhinovirus, Human SARS coronavirus, Human spumaretrovirus, Human T-lymphotropic virus, Human torovirus, Influenza A virus, Influenza B virus, Influenza C virus, Influenza A(H1N1)pdm09 virus, Influenza A(H3N2) viruses, Influenza A(H5N1) virus Isfahan virus, JC polyomavirus,
30 Japanese encephalitis virus, Junin arenavirus, KI Polyomavirus, Klassevirus, Kunjin virus, Lagos bat virus, Lake Victoria Marburgvirus, Langat virus, Lassa virus, Lordsdale virus, Louping ill virus, Lymphocytic choriomeningitis virus, Machupo virus, Mayaro virus, Measles virus, Melaka virus, Mengo encephalomyocarditis virus, Merkel cell polyomavirus, Mokola virus, Molluscum contagiosum virus, Monkeypox virus, Mumps virus, Murray valley encephalitis virus, New York virus, Nipah virus,
35 Norwalk virus, O'nyong-nyong virus, Orf virus, Oropouche virus, Pichinde virus,

Poliovirus, Punta toro phlebovirus, Puumala virus, Rabies virus, Rift valley fever virus, Rosavirus A, Ross river virus, Rotavirus A, Rotavirus B, Rotavirus C, Rubella virus, Sagiyama virus, Salivirus A, Sandfly fever sicilian virus, Sapporo virus, Semliki forest virus, Seoul virus, Simian foamy virus, Simian virus 5, Sindbis virus, Southampton virus, St. louis encephalitis virus, Tick-borne powassan virus, Torque teno virus, Toscana virus, Uukuniemi virus, Vaccinia virus, Varicella-zoster virus, Variola virus, Venezuelan equine encephalitis virus, Vesicular stomatitis virus, Western equine encephalitis virus, WU polyomavirus, West Nile virus, Yaba monkey tumor virus, Yaba-like disease virus, Yellow fever virus, Zika virus.

10. El uso de los compuestos conforme a la reivindicación 9 para la desinfección de virus pertenecientes a las familias coronavirus, influenza (gripe), poliovirus, adenovirus y norovirus.

11. Método de desinfección de virus en superficies consistente en aplicar sobre las superficies soluciones conteniendo los compuestos reivindicados en la reivindicación 1 durante al menos cinco minutos.

12. Uso de los compuestos virucidas de acuerdo con la reivindicación 1 en medicina y veterinaria como antivirales, tanto con vía tópica como otras vías de uso médico y veterinario.



- ②① N.º solicitud: 202131039
②② Fecha de presentación de la solicitud: 05.11.2021
③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TECNICA

⑤① Int. Cl.: **A61K31/16** (2006.01)
A61L2/16 (2006.01)

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
X	WO 2018033718 A1 (BYOTROL PLC) 22/02/2018; página 3, líneas 14-25; página 5, líneas 1-3; página 9, líneas 8-10; página 11, líneas 25-28; página 12, líneas 31-37; página 13, líneas 26-28; página 17, líneas 8-10, líneas 30-31; página 18, línea 25-página 19, línea 7; página 20, línea 1-28; línea 33-página 22, línea 3.	1-12
X	ES 2141678 A1 (LARIOS GARCIA JOSE) 16/03/2000; columna 8, líneas 8-60; columna 9, líneas 29-56; Tabla 1; reivindicación 4.	1-12
A	US 2012107415 A1 (LISOWSKY THOMAS <i>et al.</i>) 03/05/2012; párrafos [0003], [0026], [0027], [0039], [0056], [0062]; reivindicación 3.	1-12
A	US 5783604 A (GARCIA NUNEZ MARIA ROSALIA) 21/07/1998; columna 3, líneas 48-62; columna 4, líneas 33-38.	1-12

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia

Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la
misma categoría

A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita

P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación
de la solicitud

E: documento anterior, pero publicado después de la fecha
de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

☒ para todas las reivindicaciones

☐ para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe
18.07.2022

Examinador
N. Vera Gutierrez

Página
1/2

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K, A61L

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC, REGISTRY, CAS, WPI, EMBASE, MEDLINE, BIOSIS, NPL, XPESP