



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 103747679 B

(45)授权公告日 2017.07.11

(21)申请号 201280038016.0

F-X·舍尔 J·格罗曼

(22)申请日 2012.07.31

(74)专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专

(65)同一申请的已公布的文献号

利商标事务所 11038

申请公布号 CN 103747679 A

代理人 柳冀

(43)申请公布日 2014.04.23

(51)Int.Cl.

(30)优先权数据

A01N 43/90(2006.01)

102011109435.4 2011.08.04 DE

A01P 1/00(2006.01)

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

(56)对比文件

2014.01.29

W0 2010/108738 A2,2010.09.30,

(86)PCT国际申请的申请数据

W0 2010/136121 A2,2010.12.02,

PCT/EP2012/003246 2012.07.31

JP 8187070 A,1996.07.23,

(87)PCT国际申请的公布数据

W02013/017257 DE 2013.02.07

Peter Stoss, et al.Regioselektive

(73)专利权人 克拉里安特国际有限公司

Acylierung von 1,4:3,6-Dianhydro-D-

地址 瑞士穆腾茨

glucit.《Journal of Synthetic Organic

Chemistry》.1987,(第21期),第174-176页.

审查员 曹慧

(72)发明人 M·F·皮尔茨 P·克卢格

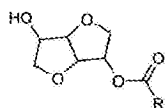
权利要求书2页 说明书11页

(54)发明名称

异山梨醇单酯作为抗微生物有效成分的用
途

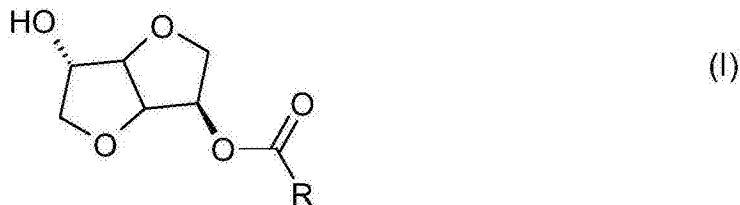
(57)摘要

描述了一种或多种式(I)化合物作为抗微生物有效成分的用途,其中R为具有5至11个碳原子的直链或支链的饱和烷基,或者为具有5至11个碳原子的直链或支链的单不饱和或多不饱和烯基。所述用途优选在化妆、皮肤病学或药学组合中,在植物保护制剂中、在洗涤剂或清洁剂中或在着色剂或涂布剂中进行。



(I)

1. 一种或多种式 (I) 化合物用于制备抗真菌剂的用途



其中

R 为具有 7 至 9 个碳原子的直链饱和烷基。

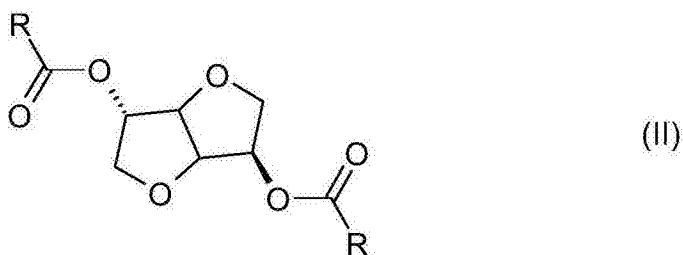
2. 根据权利要求 1 所述的用途, 其中, 式 (I) 中的基团 R 为具有 7 个碳原子的直链饱和烷基。

3. 根据权利要求 1 所述的用途, 其中, 一种或多种式 (I) 化合物用于包含一种或多种其它物质的组合物, 所述其它物质选自山梨醇、山梨醇酯、失水山梨醇、失水山梨醇酯、异山梨醇、异山梨醇二酯和羧酸。

4. 根据权利要求 3 所述的用途, 其中, 所述组合物包含一种或多种式 (I) 化合物和额外的

I) 异山梨醇, 和

II) 一种或多种式 (II) 的异山梨醇二酯,



其中 R 具有在式 (I) 中给出的含义。

5. 根据权利要求 4 所述的用途, 其中, 所述组合物包含一种或多种式 (I) 化合物和额外的

I) 0.05 至 0.7 重量份的异山梨醇, 和

II) 0.1 至 1.0 重量份的一种或多种式 (II) 的异山梨醇二酯,

分别基于 1.0 重量份的一种或多种式 (I) 化合物计。

6. 根据权利要求 3 所述的用途, 其中, 所述组合物包含一种或多种式 (I) 化合物和一种或多种由失水山梨醇和羧酸 $R^a\text{COOH}$ 形成的失水山梨醇酯, 其中 R^a 为具有 5 至 11 个碳原子的直链或支链的饱和烷基, 或具有 5 至 11 个碳原子的直链或支链的单不饱和或多不饱和烯基, 并且一种或多种式 (I) 化合物与一种或多种所述失水山梨醇酯的重量比为 70:30 至 100:0。

7. 根据权利要求 6 所述的用途, 其中, 一种或多种由失水山梨醇和羧酸 $R^a\text{COOH}$ 形成的失水山梨醇酯选自由失水山梨醇和辛酸形成的失水山梨醇酯。

8. 根据权利要求 3 所述的用途, 其中, 由组合物中的一种或多种式 (I) 化合物和一种或多种选自山梨醇、山梨醇酯、失水山梨醇、失水山梨醇酯、异山梨醇、异山梨醇二酯和羧酸的化合物形成的混合物的羟值小于或等于 320。

9. 根据权利要求 3 所述的用途, 其中, 所述组合物以至少 30 重量% 的量包含一种或多种式 (I) 化合物, 分别基于制成的组合物的总重量计。

10. 根据权利要求1所述的用途,用于化妆、皮肤病学或药学组合物中,用于植物保护制剂中,用于洗涤剂或清洁剂中或用于着色剂或涂布剂中。

11. 根据权利要求10所述的用途,其中,所述化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂以0.01至10.0重量%的量包含一种或多种式(I)化合物,分别基于制成的化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂的总重量计。

12. 根据权利要求10所述的用途,其中,所述化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂以水基或水醇基形成或者以乳液或分散体的形式存在。

13. 根据权利要求10所述的用途,其中,所述化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂具有2至11的pH值。

异山梨醇单酯作为抗微生物有效成分的用途

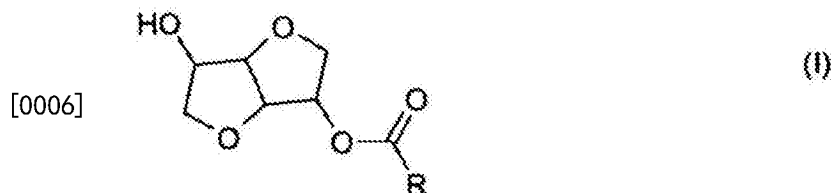
[0001] 本发明涉及异山梨醇单酯作为抗微生物有效成分的用途。

[0002] 工业中使用防腐剂或杀生物剂从而保护例如化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂的产品免受微生物侵袭。已知大量用于该目的的防腐剂或杀生物剂。为此例如可以使用欧盟-化妆品-指令的附录V中的防腐剂或欧盟-杀生物剂-指令中的杀生物剂。

[0003] 然而许多防腐剂的应用的缺点在于,其制备通常是耗费的并且基于合成原料。此外其防腐作用通常需要改进,因此为了充分防腐必须采用高的使用浓度。

[0004] 因此目的在于提供抗微生物有效成分,所述抗微生物有效成分具有有利的防腐剂性能并且优点还在于其基于再生原料。

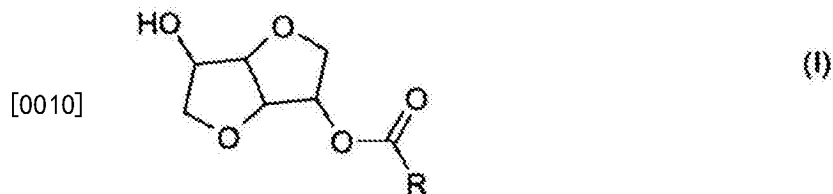
[0005] 现已令人惊讶地发现,通过式 (I) 化合物实现所述目的



[0007] 其中

[0008] R为具有5至11个,优选7至9个和特别优选7个碳原子的直链或支链的饱和烷基,或者具有5至11个,优选7至9个和特别优选7个碳原子的直链或支链的单不饱和或多不饱和烯基。

[0009] 因此,本发明的主题是一种或多种式 (I) 化合物作为抗微生物有效成分的用途



[0011] 其中

[0012] R为具有5至11个,优选7至9个和特别优选7个碳原子的直链或支链的饱和烷基,或者具有5至11个,优选7至9个和特别优选7个碳原子的直链或支链的单不饱和或多不饱和烯基。

[0013] 式 (I) 化合物具有极好的防腐剂性能并且优选适合用作杀真菌剂。其还基于再生原料。

[0014] 相比于使用有机酸作为防腐剂,式 (I) 化合物还具有在宽pH-值范围中有效的优点。有机酸通常仅在3.5至6的pH-值范围内显示出良好的作用,而式 (I) 化合物即使在更高的pH-值下也可以有利地使用。

[0015] 至少部分基于再生原料并且可以用作防腐剂的组合物是已知的。

[0016] DE102009022444 (Clariant) 描述了液体组合物,所述液体组合物包含失水山梨醇单辛酸酯和抗微生物有效成分,例如特定的有机酸及其盐、特定的甲醛-供体、特定的异噻

唑啉酮、特定的尼泊金酯及其盐和特定的吡啶酮及其盐,还描述了其用于使化妆、皮肤病学或药产品防腐的用途。

[0017] DE102009022445 (Clariant) 中公开了液体组合物,所述液体组合物包含失水山梨醇单辛酸酯和醇,及其用于使化妆、皮肤病学或药产品防腐的用途。

[0018] JP8187070 (A) (Lion) 中公开了C₈-C₁₈脂肪酸与至少一种选自山梨醇、1,5-失水山梨醇、1,4-失水山梨醇和异山梨醇的多元醇的脂肪酸单酯和所述脂肪酸与多元醇的脂肪酸二酯以33:7至9:1的单酯:二酯的重量比的混合物作为用于食品或饮料的抵抗细菌的抗微生物有效成分。

[0019] 式(I)化合物可以例如根据本领域技术人员常规的方法制得。例如,式(I)化合物可以根据常见的和本领域技术人员已知的方法通过异山梨醇的酯化制得,其中异山梨醇本身以及酯化所使用的酸组分也可市售获得。

[0020] 一种或多种式(I)化合物优选用作杀真菌剂。这意味着在本申请的范围内,一种或多种式(I)化合物可以优选用作抵抗酵母菌和真菌的抗微生物有效成分。特别有利地,一种或多种式(I)化合物用作抵抗真菌的抗微生物有效成分。

[0021] 优选地,一种或多种式(I)化合物中的基团R为具有7至9个碳原子的直链饱和烷基。

[0022] 特别优选地,一种或多种式(I)化合物中的基团R为具有7个碳原子的直链饱和烷基。

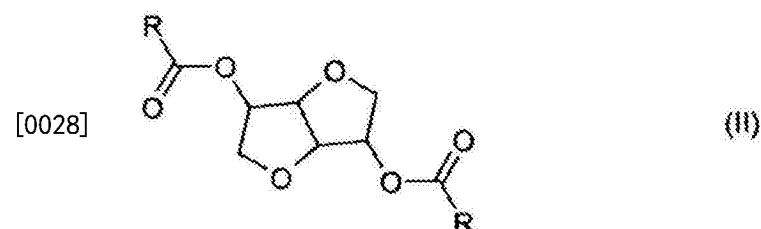
[0023] 一种或多种式(I)化合物可以单独地或在包含一种或多种其它物质的组合物中根据本发明作为抗微生物有效成分使用。所述组合物在下文中被称为“组合物A”。

[0024] 在本发明的一个优选的实施方案中,组合物A包含一种或多种式(I)化合物和额外的一种或多种选自山梨醇、山梨醇酯(山梨醇酯可以为单酯、二酯、三酯、四酯、五酯和/或六酯)、失水山梨醇、失水山梨醇酯(失水山梨醇酯可以为单酯、二酯、三酯和/或四酯)、异山梨醇、异山梨醇二酯和羧酸的其它物质。“失水山梨醇”可以例如为1,4-或1,5-失水山梨醇。羧酸本身以及所述酯的酸组分所基于的羧酸对应于式RCOOH,其中R具有式(I)中给出的含义,并且优选为具有7个碳原子的直链饱和烷基,即羧酸RCOOH优选为辛酸。

[0025] 在本发明的一个特别优选的实施方案中,组合物A包含一种或多种式(I)化合物和额外的

[0026] I) 异山梨醇,和

[0027] II) 一种或多种式(II)的异山梨醇二酯



[0029] 其中R具有上述在式(I)中给出的含义,并且其中所述异山梨醇二酯优选为异山梨醇二辛酸酯。

[0030] 下文再度优选地,刚才提到的组合物A包含一种或多种式(I)化合物和额外的

[0031] I) 0.05至0.7,优选0.1至0.7和特别优选0.2至0.5重量份的异山梨醇,和

[0032] II) 0.1至1.0, 优选0.2至1.0和特别优选0.4至0.8重量份的一种或多种式(II)的异山梨醇二酯, 其中所述异山梨醇二酯优选为异山梨醇二辛酸酯,

[0033] 分别基于1.0重量份的一种或多种式(I)化合物计, 和优选基于1.0重量份的异山梨醇单辛酸酯计。

[0034] 在下文的本发明的又一个优选的实施方案中, 刚才提到的组合物A不包含羧酸RCOOH或包含至多0.1, 优选0.001至0.05和特别优选0.002至0.01重量份的羧酸RCOOH, 其中R具有上文在式(I)中给出的含义, 并且其中羧酸优选为辛酸, 基于1.0重量份的一种或多种式(I)化合物计, 和优选基于1.0重量份的异山梨醇单辛酸酯计。

[0035] 在本发明的另一个特别优选的实施方案中, 组合物A包含一种或多种式(I)化合物和一种或多种由失水山梨醇和羧酸R^aCOOH形成的失水山梨醇酯, 优选选自由1,4-和/或1,5-失水山梨醇和羧酸R^aCOOH形成的失水山梨醇酯, 其中R^a为具有5至11个, 优选7至9个和特别优选7个碳原子的直链或支链的饱和烷基, 或具有5至11个, 优选7至9个和特别优选7个碳原子的直链或支链的单不饱和或多不饱和烯基, 并且其中一种或多种式(I)化合物与一种或多种上述失水山梨醇酯的重量比为70:30至100:0, 优选80:20至100:0, 特别优选90:10至100:0和尤其优选95:5至100:0。给出的“100:0”的重量比意指在本发明的所述特别优选的实施方案中, 上述组合物A必须不包含失水山梨醇酯。

[0036] 在上述组合物A中优选这样的组合物, 其中一种或多种由失水山梨醇和羧酸R^aCOOH形成的失水山梨醇酯选自由失水山梨醇和辛酸形成的失水山梨醇酯, 并且优选选自由1,4-和/或1,5-失水山梨醇和辛酸形成的失水山梨醇酯, 并且失水山梨醇酯特别优选为失水山梨醇单辛酸酯。

[0037] 在所述组合物A中, 由一种或多种式(I)化合物和一种或多种(任选包含的)由失水山梨醇和羧酸R^aCOOH形成的失水山梨醇酯形成的混合物的OH-值优选小于或等于320, 特别优选小于或等于285, 尤其优选小于或等于245和极其优选小于或等于225。

[0038] 在本发明的另一个特别优选的实施方案中, 由一种或多种式(I)化合物和一种或多种选自山梨醇、山梨醇酯、失水山梨醇、失水山梨醇酯、异山梨醇、异山梨醇二酯和羧酸的化合物形成的混合物的OH-值小于或等于320, 优选小于或等于285, 特别优选小于或等于245和尤其优选小于或等于225。

[0039] 在本发明的另一个特别优选的实施方案中, 组合物A不包含选自山梨醇和山梨醇酯的化合物。

[0040] 在本发明的另一个特别优选的实施方案中, 组合物A不包含选自失水山梨醇和失水山梨醇酯的化合物。

[0041] 如果组合物A包含一种或多种选自山梨醇和山梨醇酯(其中所述酯的酸组分所基于的羧酸优选为辛酸)的化合物, 所述化合物总共优选以小于或等于5.0重量%的量, 特别优选以小于或等于3.0重量%的量, 尤其优选以小于或等于1.0重量%的量和极其优选以小于或等于0.5重量%的量包含在组合物A中, 其中以重量%表示的数据分别基于制成的组合物A的总重量计。

[0042] 如果组合物A包含一种或多种选自失水山梨醇和失水山梨醇酯(其中所述酯的酸组分所基于的羧酸优选为辛酸)的化合物, 所述化合物总共优选以小于或等于20.0重量%的量, 特别优选以小于或等于10.0重量%的量, 尤其优选以小于或等于5.0重量%的量和极其优

选以小于或等于1.0重量%的量包含在组合物A中,其中以重量%表示的数据分别基于制成的组合物A的总重量计。

[0043] 在本发明的另一个特别优选的实施方案中,组合物A以至少30重量%的量,优选以至少50重量%的量,和特别优选以至少60重量%的量包含一种或多种式(I)化合物,分别基于制成的组合物A的总重量计。

[0044] 物质的羟值或OH-值被理解为在1g物质的乙酰化时与乙酸的结合量等量的KOH的毫克数。

[0045] 用于确定OH-值的合适的测定方法例如DGF C-V17a (53), Ph.Eur. 2.5.3方法A和DIN53240。

[0046] 在本发明的范围内,OH-值按照DIN53240-2测定。在此如下进行:称量1g精确到0.1mg的均质化的待测量样本。添加20.00ml乙酰化混合物(乙酰化混合物:在1升吡啶中拌入50ml乙酸酐)。使样本完全溶解在乙酰化混合物中,任选伴随搅拌和加温。添加5ml催化剂溶液(催化剂溶液:将2g4-二甲基氨基吡啶溶解在100ml吡啶中)。封闭反应容器并且放置在预热至55℃的水浴中10分钟并且在此进行混合。然后使反应溶液与10ml去离子水混合,重新封闭反应容器并且再次在振动水浴中反应10分钟。将样本冷却至室温(25℃)。然后添加50ml2-丙醇和2滴酚酞。用氢氧化钠溶液(氢氧化钠溶液c=0.5mol/l)滴定所述溶液(Va)。在相同条件下而不称量样本,测定乙酰化混合物的有效值(Vb)。

[0047] 通过有效值测定和样本滴定的消耗量根据下式计算OH-值(OHZ):

$$[0048] \quad OHZ = \frac{(Vb - Va) \cdot c \cdot t \cdot M}{E}$$

[0049] OHZ=以mg KOH/g物质表示的羟值

[0050] Va=以ml表示的在滴定样本时的氢氧化钠溶液的消耗量

[0051] Vb=以ml表示的在滴定有效值时的氢氧化钠溶液的消耗量

[0052] c=以mol/l表示的氢氧化钠溶液的物质质量浓度

[0053] t=氢氧化钠溶液的滴定量

[0054] M=KOH的摩尔质量=56.11g/mol

[0055] E=以g表示的样本净重

[0056] (Vb-Va)为在上述待测量样本的乙酰化中与乙酸的结合量等量的以ml表示的所使用的氢氧化钠溶液的量。

[0057] 上述用于测定OH-值的方法在下文中被称为“方法OHZ-A”。

[0058] 优选地,根据本发明的用途在化妆、皮肤病学或药学组合物中、在植物保护制剂中、在洗涤剂或清洁剂中或在着色剂或涂布剂中进行。所述植物保护制剂优选包含一种或多种杀生物剂。

[0059] 化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂优选以0.01至10.0重量%的量,特别优选以0.1至5.0重量%的量和尤其优选以0.2至3.0重量%的量包含一种或多种式(I)化合物,分别基于制成的化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂的总重量计。

[0060] 化妆、皮肤病学或药学组合物,植物保护制剂,洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂具有优选在50至200000mPa·s范围内,特别优选在500至100000mPa·s范围内,尤其优选在

2000至50000mPa·s范围内和极其优选在5000至30000mPa·s范围内的粘度(20℃, Brookfield RVT, RV-转子组, 20转/分钟)。

[0061] 化妆、皮肤病学或药学组合物优选以流体、凝胶、泡沫、喷雾、洗剂或霜剂的形式存在。

[0062] 化妆、皮肤病学或药学组合物优选为用于治疗足癣的试剂或去屑试剂。在该情况下, 根据本发明的用途作为抵抗足癣和抵抗皮肤的杀真菌剂进行。

[0063] 化妆、皮肤病学或药学组合物, 植物保护制剂, 洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂优选以水基或水醇基形成或者以乳液或分散体的形式存在。特别优选地, 其以乳液的形式存在并且其尤其优选以水包油乳液的形式存在。

[0064] 化妆、皮肤病学或药学组合物, 植物保护制剂, 洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂可以包含对于各种应用而言所有常规使用的物质作为其它助剂和添加剂, 例如油、蜡、乳化剂、共乳化剂、解胶剂、表面活性剂、消泡剂、增溶剂、电解质、羟基酸、稳定剂、聚合物、成膜剂、增稠剂、胶凝剂、富脂剂、脱脂剂、其它抗微生物有效成分、生源性有效成分、收敛剂、活性物质、除臭物质、防晒过滤剂、抗氧化剂、氧化剂、保湿剂、溶剂、着色剂、颜料、珠光剂、芳香剂、乳浊剂和/或硅酮。

[0065] 化妆、皮肤病学或药学组合物, 植物保护制剂, 洗涤剂或清洁剂或着色剂或涂布剂具有优选2至11, 特别优选4.5至8.5和尤其优选5.5至6.5的pH-值。

[0066] 如下实施例和应用应当详细阐释本发明, 但是本发明并不限于这些实施例。除非另有声明, 所有百分比数据为重量百分比(重量%)。

[0067] 研究实施例:

[0068] A) 异山梨醇辛酸酯的制备

[0069] 在具有蒸馏头的搅拌仪器中在80℃下预置190.0g (1.3mol) 异山梨醇 (Ecogreen Oleochemicals的“Sorbon”) 和187.5g (1.3mol) 辛酸(羊脂酸) 连同作为催化剂的0.38g氢氧化钠溶液(18重量%的水溶液)。在搅拌和引入氮气(10-12升/小时)下首先将反应混合物加热至180℃, 此时开始蒸馏出反应水。然后在1小时内将物料加热至190℃, 在另外的2小时内加热至210℃。在达到210℃之后酯化足够长的时间, 直至达到<1mg KOH/g的酸值。获得345.7g琥珀色异山梨醇辛酸酯(理论值的97%)。pH-值(在1:1的乙醇/水中5重量%) 为5.9。pH-值根据DIN EN1262测量。

[0070] 异山梨醇辛酸酯的其它分析特征参数:

[0071] 酸值: 0.9mg KOH/g, 根据DIN EN ISO2114测量

[0072] 羟值: 206mg KOH/g, 按照DIN53240-2根据方法OHZ-A测量

[0073] 皂化值: 204mg KOH/g, 根据DIN EN ISO3681测量

[0074] 异山梨醇辛酸酯具有如下组成:

[0075]

物质	重量%
辛酸	0.4
异山梨醇	18.1
异山梨醇单辛酸酯	50.9
异山梨醇二辛酸酯	30.6

[0076] 所述组合物在下文中被称为“异山梨醇辛酸酯1”。

[0077] B) 异山梨醇辛酸酯1的抗微生物效果的测定

[0078] 下文研究异山梨醇辛酸酯在丁基聚乙二醇中抵抗细菌、真菌和酵母菌的抗微生物效果。为了用细菌进行检测,用丁基聚乙二醇稀释异山梨醇辛酸酯1,然后在50℃下以不同浓度将其添加至缓冲至pH7 (+/-0.2) 的液体Caso-琼脂(酪蛋白胨琼脂)(在下文中被称为组合物B1、B2等)。为了用真菌和用酵母菌进行检测,用丁基聚乙二醇稀释异山梨醇辛酸酯1,然后以不同浓度将其添加至缓冲至pH5.6 (+/-0.2) 的液体Sabouraud-4%-葡萄糖琼脂(在下文中被称为组合物PH1、PH2等)。将组合物B1、B2等或PH1、PH2等的每一个倒入培养皿,并且分别用相同量的细菌、真菌和酵母菌进行接种。最低抑制浓度(MHK)为组合物B1、B2等或PH1、PH2等中的细菌、真菌和酵母菌的生长被抑制时的浓度。

[0079] 确定的和在下表1中给出的异山梨醇辛酸酯1的最低抑制浓度值已经针对丁基聚乙二醇的稀释影响进行校准。

[0080] 表1 异山梨醇辛酸酯1的最低抑制浓度(MHK)

[0081]

研究的细菌(B)、真菌(P)或酵母菌(H)	异山梨醇辛酸酯 1 的 MHK [ppm]
金黄色酿脓葡萄球菌(<i>Staphylococcus aureus</i>)(B)	2500
铜绿假单胞菌(<i>Pseudomonas aeruginosa</i>)(B)	10000
大肠杆菌(<i>Escherichia coli</i>)(B)	7500
产气肠杆菌(<i>Enterobacter aerogenes</i>)(B)	10000
肺炎克雷伯菌(<i>Klebsiella pneumoniae</i>)(B)	10000
普通变形杆菌(<i>Proteus vulgaris</i>)(B)	5000
食油假单胞菌(<i>Pseudomonas oleovorans</i>)(B)	10000
弗氏柠檬酸杆菌(<i>Citrobacter freundii</i>)(B)	10000
白色念珠菌(<i>Candida albicans</i>)(H)	600
巴西曲霉菌(<i>Aspergillus brasiliensis</i>)(P)	800
朱黄青霉菌(<i>Penicillium minioluteum</i>)(P)	600
土曲霉菌(<i>Aspergillus terreus</i>)(P)	600
腐皮镰孢霉菌(<i>Fusarium solani</i>)(P)	600
绳状青霉菌(<i>Penicillium funiculosium</i>)(P)	400

[0082] 通过表1中列出的结果可知,异山梨醇辛酸酯1具有尤其是抵抗酵母菌白色念珠菌和测试的真菌的抗微生物效果。

[0083] C) 异山梨醇辛酸酯1的成分的抗微生物效果

[0084] 辛酸具有抗微生物效果。然而由于辛酸在组合物“异山梨醇辛酸酯1”中仅以至多

0.4重量%的量存在,其在该组合物中的抗微生物效果可以忽略的小。此外,辛酸在6或更大的pH-值下不具有抗微生物效果。

[0085] 类似于异山梨醇辛酸酯1的抗微生物效果的测定,在其它测试系列中一方面测定包含89.6重量%异山梨醇二辛酸酯和9.4重量%异山梨醇单辛酸酯(其余:1重量%)的混合物(在下文中被称为“异山梨醇二辛酸酯”)的抗微生物效果,另一方面测定纯异山梨醇。结果列于表2中。

[0086] 表2异山梨醇二辛酸酯和异山梨醇的最低抑制浓度(MHK)

[0087]

研究的细菌(B)、真菌(P)或酵母菌(H)	异山梨醇二辛酸酯的 MHK [ppm]	异山梨醇的 MHK [ppm]
金黄色酿脓葡萄球菌 (<i>Staphylococcus aureus</i>)(B)	10000	10000
铜绿假单胞菌 (<i>Pseudomonas aeruginosa</i>)(B)	10000	10000
大肠杆菌 (<i>Escherichia coli</i>)(B)	10000	10000
产气肠杆菌 (<i>Enterobacter aerogenes</i>)(B)	10000	10000
肺炎克雷伯菌 (<i>Klebsiella pneumoniae</i>)(B)	10000	10000
普通变形杆菌 (<i>Proteus vulgaris</i>)(B)	10000	10000
食油假单胞菌 (<i>Pseudomonas oleovorans</i>)(B)	10000	10000
弗氏柠檬酸杆菌 (<i>Citrobacter freundii</i>)(B)	10000	10000
白色念珠菌 (<i>Candida albicans</i>)(H)	10000	10000
巴西曲霉菌 (<i>Aspergillus brasiliensis</i>)(P)	10000	10000
朱黄青霉菌 (<i>Penicillium minioluteum</i>)(P)	10000	10000
土曲霉菌 (<i>Aspergillus terreus</i>)(P)	10000	10000
腐皮镰孢霉菌 (<i>Fusarium solani</i>)(P)	5000	10000
绳状青霉菌 (<i>Penicillium funiculosium</i>)(P)	5000	10000

[0088] 如由表2的结果可知,异山梨醇和异山梨醇二辛酸酯均不具有抗微生物效果。

[0089] 由于一方面组合物异山梨醇辛酸酯1中包含的化合物辛酸、异山梨醇和异山梨醇二辛酸酯的不足的抗微生物效果,另一方面由表1的结果可知的组合物“异山梨醇辛酸酯1”的抗微生物效果,可以推断,组合物异山梨醇辛酸酯1中包含的化合物异山梨醇单辛酸酯同样具有显著的抗微生物效果,尤其是作为抵抗酵母菌和真菌的杀真菌剂。

[0090] 出于该原因还认为,组合物异山梨醇二辛酸酯相对于真菌腐皮镰孢霉菌和绳状青霉菌的低活性归因于其中包含的化合物异山梨醇单辛酸酯。

[0091] D) 应用实施例

[0092] 根据本发明的用途可以例如在如下制剂中进行。

[0093] 制剂实施例1:修复保湿霜

[0094]

相	成分	重量%
A	Hostacerin [®] SFO	2.0
	葵花籽油山梨醇酯	
	Velsan [®] CCT	4.5
	辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯	
	Cetiol [®] OE	4.5
	辛醚	
	Lanette [®] 22	4.0
	山嵛醇	
	Lanette [®] 18	4.0
	硬脂醇	
	Fucogel [®] 1000	1.0
	Biosacchride Gum-1	
B	Coenzyme [®] Q 10	0.1
	泛醌	

[0095]

C	水	增补至 100
	甘油	10.0
	Hostaphat [®] CK 100	0.6
	鲸蜡基磷酸钾	
D	苯氧乙醇	1.0
	异山梨醇辛酸酯 1	1.0
E	NaOH (10 重量%于水中)	适量

[0096] 制备:

[0097] I混合A的组分并且加热至80℃

[0098] II混合C的组分并且加热至80℃

[0099] III将B添加至I。

[0100] IV将II添加至III并且搅拌直至混合物冷却至室温

[0101] V将D添加IV

[0102] VI用E将pH-值调节至5.5

[0103] 制剂实施例2:

[0104]

相	成分	重量%
A	Hostacerin [®] EWO	16.0
	聚甘油基-2-倍半异硬脂酸酯(和)白蜂蜡(和)巴西棕榈蜡	
	(和)硬脂酸乙基己酯(和)硬脂酸镁(和)硬脂酸铝	
	棕榈酸酯异丙酯	10.0
	鳄梨油	2.0
	Velsan [®] CCT	2.5
	辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯	
B	Octopirox [®]	0.05
	吡罗克酮乙醇胺盐	
	丙二醇	1.0
C	水	增补至 100
	甘油	4.0

[0105]

	硫酸镁 * 7H ₂ O	0.7
	尿囊素	0.5
D	醋酸生育酚	0.5
	迷迭香(迷迭香)叶油	0.1
	尿素	10.0
	异山梨醇辛酸酯 1	1.0
	苯氧乙醇	0.8

[0106] 制备:

[0107] I混合A的组分并且加热至80℃

[0108] II混合B的组分直至所有物质溶解(可能伴随略微升温)

[0109] III将II添加至I

[0110] IV混合C的组分并且升温至50℃

[0111] V以高速将IV搅拌入I直至冷却至35℃

[0112] VI在35℃下将D添加至V

[0113] 制剂实施例3和4:植物保护制剂

[0114]

制剂号	3	4
成分	各个成分的量[重量%]	
莠去津	43.6	43.6
Dispersogen [®] PSL 100	-	1.7
Genapol [®] LSS	-	1.6
Dispersogen [®] LFS	2.1	-
丙二醇	4.3	4.3
Defoamer [®] SE 57	0.6	0.6
Kelzan [®] S (2 重量%于水中)	7.3	7.3
异山梨醇辛酸酯 1	0.3	0.2
苯甲醇	1.0	1.0
水	增补至 100	增补至 100

[0115] 制备:

[0116] 用其它成分(除了 **Kelzan[®] S**-溶液之外)预分散有效物质,然后经受微细研磨,直至平均粒度<2微米。然后搅拌入 **Kelzan[®] S**-溶液。

[0117] 制剂实施例5:手洗餐具洗洁精

[0118]

成分	重量%
Hostapur[®] SAS 60 (链烷磺酸盐, 60 重量%于水中)	40.0
Hostapur[®] OS 液体 (C14-16 烷基磺酸钠, 40 重量%于水中)	11.0
Genaminox[®] LA (二甲基月桂胺氧化物, 30 重量%于水中)	3.0
Genagen[®] CAB (椰油酰氨基丙基甜菜碱, 30 重量%于水中)	3.0
异山梨醇辛酸酯 1	0.8
苯甲醇	0.8
水	增补至 100

[0119] 制剂实施例6:表面清洁剂(通用清洁剂)

[0120]	成分	重量%
	Hostapur[®] SAS 60 (链烷磺酸盐, 60 重量%于水中)	5.0
	Genapol[®] UD 080 (十一醇+8 EO)	2.0
	Genaminox[®] LA (二甲基月桂胺氧化物, 30 重量%于水中)	2.0
	甲基异噻唑啉酮	0.01
	异山梨醇辛酸酯 1	1.0
	水	增补至 100

[0121] 制剂实施例5和6的制备:

[0122] 预置一半水量并且以制剂实施例5和6的表中所示的顺序搅拌入组分。然后添加余量的水。得到澄清的水性组合物。