

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 851139 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application **851139**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification (IPC⁴)
A01N 43/40
A01N 25/30

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **21.03.1985**

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date **21.03.1985**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public **24.09.1985**

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date **12.06.2019**

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet - Priority

23.03.1984 US 592664

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 • Sterling Drug Inc, 90 Park Avenue, New York, NY 10016, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • Gorman, William George, USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

2 • Popp, Karl Frederick, USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Antimikrobisia koostumuksia pintojen desinfiointiin.

Antimikrobiella kompositioner för desinficering av ytor.

Antimikrobinen koostumus pintojen desinfiointiin

Keksintö koskee ei-terapeuttisia antimikrobisia koostumuksia pintojen desinfiointiin, jotka antimikrobise-
 5 na aineena sisältävät bis[4]-(substituoitu amino)-1-pyridi-
 nium[7]alkaania ja ensisijaisena tensidinä kvaternääristä ammoniumfosfaattiesteriä, erityisesti antimikrobisia ihon-
 puhdistuskoostumuksia, sekä niiden käyttötapoja.

US-patentissa 2 684 924, julkistettu 27.7.1954,
 10 kuvataan antimikrobisia aryylibisbiguanideja, mm. kloori-
 heksidiiniä, jotka myös kuvataan Merck Indexissä (kymmenes
 painos, 1983, monografia 2057) ja joiden yhtenä edullisena
 suolamuotona on diglukonaattisuola. US-patentissa 4 053 636,
 julkistettu 11.10.1977, kuvataan antimikrobisia dikloori-
 15 syklopropyylibifenyylibisbiguanideja ja niiden ja poloksa-
 leeni-amiinioksiditensidin muodostamia koostumuksia. US-
 patentissa 3 468 898, julkistettu 23.9.1969, kuvataan an-
 timikrobisia alkyylibisbiguanideja ja kerrotaan, että niitä
 voidaan käyttää "puhdistusaineiden vesiliuoksissa".

20 Gundersenin US-patentissa 4 022 834 kuvataan anti-
 mikrobisia sykloalkyylibisbiguanideja.

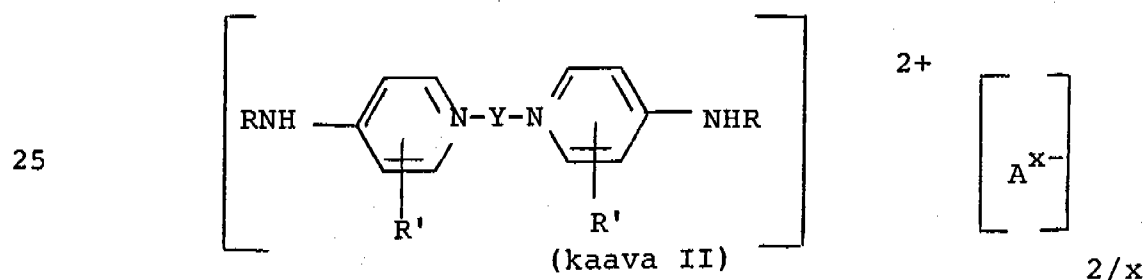
US-patentissa 4 206 215 kuvataan antimikrobisia
 bis[4]-(substituoitu amino)-1-pyridinium[7]alkaaneja ja ker-
 rotaan, että "ne voidaan formuloida minkä tahansa yhteen-
 25 sopivan, farmaseuttisesti hyväksyttävän tensidin, edullises-
 ti ionisoitumattoman tensidin kanssa". Esimerkissä 10 ku-
 vataan 1,10-bis[4]-(oktyyliamino)-1-pyridinium[7]dekaanidiklo-
 ridi, jonka geneerinen nimi on oktenidiinihydrokloridi.

US-patentissa 4 209 449 kuvataan kvaternäärisiä am-
 30 moniumfosfaattiesteritensidejä ja esimerkkinä niitä sisäl-
 tävistä koostumuksista silmiä ärsyttämätön vauvashampoo ja
 huuhte. Eräät näistä tensideistä ovat kaupallisesti saata-
 vissa kauppanimellä Monaquat. Polyeteeniglykoliesteritensi-
 dit muodostavat tunnetun ionisoitumattomien tensidien ryh-
 35 män, joiden erityisesimerkkejä kuvataan geneerisellä nimel-
 lään (CTFA:n omaksuma nimi), kauppanimellään ja rakennekaa-

vallaan teoksessa "CTFA Cosmetic Ingredient Dictionary" (kolmas painos, 1982, julkaisija The Cosmetic, Toiletry and Fragrance Association, Inc., 1110 Vermont Avenue, N.W., Washington, D.C. 20005) ja jotka ovat kaupallisesti saatavissa. US-patentissa 3 472 840 kuvataan kvaternäärisiä, typ-
 5 pipitoisia selluloosaeettereitä, joiden erityisesimerkkejä on samoin kuvattu yllä mainitussa teoksessa CTFA Cosmetic Ingredient Dictionary ja jotka ovat kaupallisesti saatavissa. US-patentissa 4 420 484 kuvataan antimikrobi-
 10 sia ihonpuhdistuskoostumuksia, jotka muodostuvat aryyli- tai alkyylibisbiguanidi- ja/tai bis[4-(substituoitu amino)-1-pyridium]alkaanista antimikrobisena aineena ja polyetee- niglykoliesteritensidin ja betaiini- ja/tai amiinioksiditen-
 15 sidin yhdistelmästä. Erityisesti kuvataan koostumuksia, jotka antimikrobisena aineena sisältävät klooriheksidiiniglukonaattia ja oktenidiinihydrokloridia.

Keksinnön mukaiselle koostumukselle on tunnusomais- ta, että se käsittää

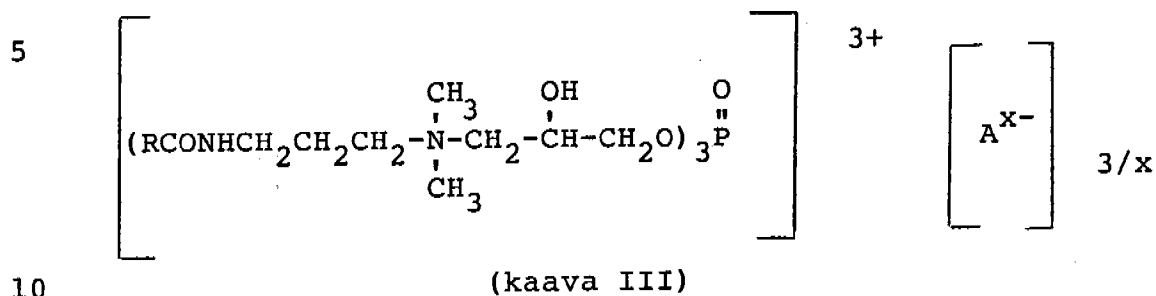
A) n. 0,1 - n. 10 paino-% antimikrobista ainetta, jolla on
 20 rakennekaava:



jossa Y on 4-18 hiiliatomia sisältävä alkyleeni, joka erot-
 30 taa molemmat pyridiniumryhmät 4-18 hiiliatomilla, R on kum- massakin pyridiniumryhmässä sama ja on 6-18 hiiliatomia si- sältävä alkyyli, 5-7 hiiliatomia sisältävä sykloalkyyli- bentsyyli tai fenyyli substituoituna metyleenidioksilla tai yhdellä tai kahdella substituentilla ryhmästä halogeeni,
 35 alempi-alkyyli, alempi-alkoksi, nitro, syano ja trifluori- metyyli, R' on kummassakin pyridiniumryhmässä sama ja

on vety tai alempi-alkyyli, A^{x-} on farmaseuttisesti hyväksyttävä anioni ja x on anionin valenssi,

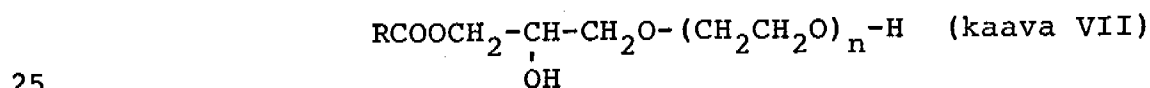
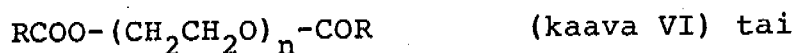
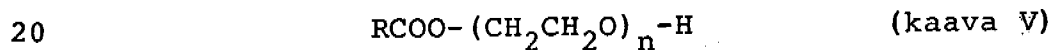
B) n. 0,1 - n. 50 paino-% yhdistettä, jolla on kaava;



jossa R on 5-17 hiiliatomia sisältävä alkyyli, A^{x-} on farmaseuttisesti hyväksyttävä anioni ja x on anionin valenssi, ja

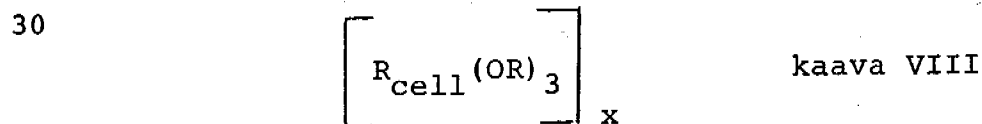
15 C) vesipitoista väliainetta.

Haluttaessa yllä kuvatun koostumuksen B-osassa on lisäksi yksi tai useampi yhdiste ryhmästä
b) yhdiste, jolla on kaava



jossa R on 8-20 hiiliatomia sisältävä alkenyyli tai lano-
liini ja n on kokonaisluku n. 8 - n. 200, ja

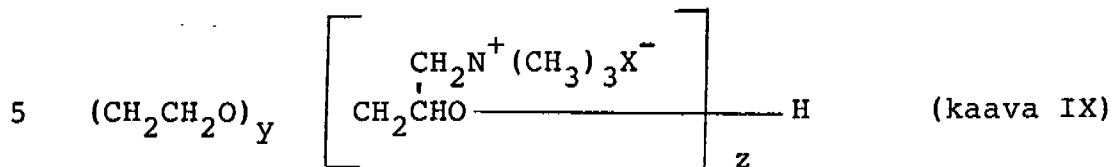
c) yhdiste, jolla on kaava



jossa R_{cell} on anhydroglukoosiyksikön tähtö $(\text{C}_6\text{H}_{10}\text{O}_5)$,

35 x on polymerointiaste ja on kokonaisluku n. 50 - n. 20 000,

edullisesti n. 200 - n. 5000, radikaalit R ovat samoja tai erilaisia ja niillä on kaava



jossa y on kokonaisluku 0-10, z on kokonaisluku 0-3 ja X^- on farmaseuttisesti hyväksyttävä anioni.

- 10 Elävä tai ei-elävä pinta voidaan desinfioiva levittämällä pinnalle antimikrobisesti tehokas määrä keksinnön mukaista koostumusta. Keksinnön mukainen koostumus pystyy erityisesti vähentämään elävän nisäkkään iholla olevien bakteerien määrää, kun iholle levitetään antimikrobisesti
- 15 tehokas määrä tätä koostumusta.

- Kaavassa (II) Y voi olla suora tai haarautunut, se voi sisältää 8-12 hiiliatomia ja on edullisesti 1,10-dekyleeni. Kun R on alkyyli, sekin voi olla suora tai haarautunut, se voi sisältää 7-9 hiiliatomia ja on edullisesti
- 20 n-oktyyli. Kun R on sykloalkyyli, se on edullisesti sykloheksyyli. Halogeeni on fluori, kloori, bromi tai jodi. Kun R on substituoitu fenyyli, se on esim. 3,4-metyleenidioksisfenyyli, p-kloorifenyyli, p-tolyyli, m-metoksifenyyli, p-nitrofenyyli, m-syanofenyyli tai m-(trifluorimetyyli)fenyyli.
- 25 li. R' on edullisesti vety. $\text{A}^{\text{X}-}$ on edullisesti kloridi-ioni ja siten x on edullisesti yksi. Kaavan (II) mukaisessa edullisessa yhdisteessä Y on 1,10-dekyleeni, R on n-oktyyli, R' on vety, $\text{A}^{\text{X}-}$ on kloridi-ioni ja x on 1. Tämän yhdisteen geneerinen nimi on oktenidiinihydrokloridi.

- 30 Kaavan (III) mukaisissa yhdisteissä R on siihen liittyvän hiiliatomin kanssa edullisesti kookospähkinähapporadikaali (n. 48 % lauriinihappoa, 18 % myristiinihappoa, 8 % kapryylihappoa, 8 % palmitiinihappoa, 7 % kapriinihappoa, 6 % öljyhappoa, 3 % linoleiinihappoa ja 2 % steariinihappoa), $\text{A}^{\text{X}-}$ on kloridi-ioni ja x on siten 1. Hyväksytty,
- 35 CTFA:n omaksuma nimi (jota ei vielä esiinny yllä mainituksa

CTFA Cosmetic Ingredient Dictionary:ssa) kaavan (III) mukaiselle yhdisteelle, jossa symboleilla R ja A^{X-} on edellä mainitut edulliset merkitykset, on kokamidopropyyli-PG-dimoniumkloridifosfaatti. Kaavan (III) mukaisista yhdisteistä tämä on edullinen yhdiste, ja se on kuvattu esimerkissä nro 1 yllä mainitussa US-patentissa 4 209 449.

Myös kaavojen (V), (VI) ja (VII) mukaisilla edustavilla yhdisteillä on CTFA:n omaksumat nimet, PEG-150-lauraatti on kaavan (V) mukainen yhdiste, jossa R on undekyyli ja n on keskimäärin 150. PEG-150-distearaatti on kaavan (VI) mukainen yhdiste, jossa R on heptadekyyli ja n on keskimäärin 150. Kaavojen (V), (VI) ja (VII) mukaisista yhdisteistä kaavan (VII) mukainen PEG-78 glyseryylikokoaatti, jossa RCO on kookospähkinähapporadikaali ja n on keskimäärin 78, on edullinen yhdiste.

CTFA:n omaksuma nimi kaavan (VIII) mukaiselle edulliselle yhdisteelle on Polyquaternium-10, (CAS-numerot: 53568-66-4; 54351-50-7; 55353-19-0), erityisesti kauppanimellä UCARE Polymer JR-30M[®] myytävä yhdiste. Polyquaternium-10 on polymeerinen kvaternäärinen ammoniumsuola, joka on muodostettu hydroksietyyliselluloosasta ja trimetyyliammoniumilla substituoidusta epoksidista.

Keksinnön mukaisten koostumusten vesipitoisena väliaineena on edullisesti pelkkä vesi, mutta voidaan käyttää myös farmaseuttisesti hyväksyttävää, veteen sekoitettavaa orgaanista laimenninta, kuten etyylialkoholia, isopropylialkoholia, propyleeniglykolia tai glyserolia tai niiden seosta.

Yllä kuvattujen aineosien lisäksi voivat koostumukset sisältää myös farmaseuttisia apuaineita, kuten kostutusaineita, pehmenysaineita, liukastusaineita, stabilointiaineita, väriaineita, hajusteita ja säilöntäaineita. Antimikrobisen aineen mukanaolosta huolimatta saattaa olla tarpeen lisätä säilöntäainetta mikro-organismien kasvun estämiseksi koostumuksissa. Voidaan myös lisätä farmaseuttisesti hyväksyttävää happoa tai emästä pH:n säätämiseksi.

miseksi ja/tai farmaseuttisesti hyväksyttävää puskuria määrätyn pH:n ylläpitämiseksi.

- Keksinnön mukaisilla koostumuksilla käsiteltäviin eläviin pintoihin kuuluvat kasvi- ja eläinpinnat, erityisesti nisäkkäiden iho ja aivan erityisesti ihmisen iho. Ei-eläviä pintoja ovat kovat ja pehmeät pinnat, kuten puu-, metalli-, lasi-, keramiikka-, muovi-, paperi- ja kangaspinnat. Koostumukset levitetään pinnoille tavalliseen tapaan, esim. kastamalla, kostuttamalla, suihkuttamalla ja hankaamalla. Seuraavat esimerkit valaisevat keksinnön mukaisia koostumuksia.

Esimerkki 1

<u>Aineosa</u>	<u>Paino-%</u>
Oktenidiinihydrokloridia	2,00
15 Kokamidopropyli-PG-dimoniumkloridifosfaattia	5,00
PEG-78 glyseryylikokoaattia	10,0
Hajustetta	0,100
Väriainetta	0,00500
Natriumhydroksidia pH:n säätämiseksi arvoon 7	-
20 Puhdistettua vettä	ad 100

Esimerkki 2

<u>Aineosa</u>	<u>Paino-%</u>
Oktenidiinihydrokloridia	2,00
Kokamidopropyli-PG-dimoniumkloridifosfaattia	5,00
25 Polyquaternium-10:tä (UCARE Polymer JR 30M)	0,750
Hajustetta	0,100
Väriainetta	0,00500
Natriumhydroksidia pH:n säätämiseksi arvoon 7	-
Puhdistettua vettä	ad 100,0

Esimerkki 3

<u>Aineosa</u>	<u>Paino-%</u>
Oktenidiinihydrokloridia	2,00
Kokamidopropyli-PG-dimoniumkloridifosfaattia	6,0
PEG-78 glyseryylikokoaattia	11,00
35 Natriumfosfaattia	0,276

Esimerkki 3 (jatkoa)

<u>Aineosa</u>	<u>Paino-%</u>
Dinatrium-EDTA:a	0,100
Hajustetta	0,100
5 Väriainetta	0,00500
Natriumhydroksidia pH:n säätämiseksi arvoon 7,2	-
Puhdistettua vettä	ad 100,00

Esimerkki 4

<u>Aineosa</u>	<u>Paino-%</u>
10 Oktenidiinihydrokloridia	2,00
Kokamidopropyli-PG-dimoniumkloridifosfaattia	6,0
PEG-78 glyseryylikokoaattia	11,0
Isopropyylialkoholia	5,00
Natriumfosfaattia	0,276
15 Dinatrium-EDTA:a	0,100
Hajustetta	0,100
Väriainetta	0,00500
Natriumhydroksidia pH:n säätämiseksi arvoon 7,2	-
Puhdistettua vettä	ad 100,0

20 Koostumusten biologiset ominaisuudetSiannahasta leikattujen kiekkojen upotustesti

- Steriileihin, siannahasta leikattuihin kiekkoihin, halkaisija 10 mm, siirrettiin Staphylococcus epidermis ATCC 17917:n viljelmää, jossa oli 10^6 - 10^7 pesäkkeen muodostavaa yksikköä/ml, inkuboitiin tryptoosifosfaattiliemessä kuusi tuntia 37°C :ssa, eristettiin liemestä, inkuboitiin uudelleen 18-24 tuntia 30°C :ssa, pestiin kahdesti 0,0743-m kaliumdivetyfosfaattivesiliuoksella, jossa oli 0,1 % polyeteeniglykoli-p-iso-oktyylifenyylietteriä
- 30 (kauppanimi Triton X-100), ja varastoitiin -70°C :ssa. Sitteen kunkin kiekon annettiin sulaa, upotettiin kolmeksi minuutiksi 2 ml:aan yhtä esimerkkien 3 ja 4 koostumusta tai 25-millimoolista kaliumdivetydivetyfosfaattivesiliuosta kontrolliliuoksena, pestiin 10 ml:lla steriiliä tislattua vettä viiden sekunnin ajan ja sitten kiekosta otettiin näyte pyörittämällä sitä minuutti 10 ml:ssa 0,025-m

kaliumdivetyfosfaattivesiliuosta, jossa oli 0,1 % polyeteeniglykoli-p-iso-oktyylifenyylietteriä (kauppanimi Triton X-100), 0,2 % lesitiiniä, 1,55 % polysorbaatti 80:tä (kauppanimi Tween 80), 1,0 % naftaleenisulfonihapon natriumsuolan ja anionisen dispergointiaineen kondensaat-
 5 tia (kauppanimi Tamal-N Micro) ja 0,1 % natriumtiosulfaattia.

Eloonjääneiden bakteerien lukumäärän määrittämiseksi peräkkäiset kymmenkertaiset laimennokset, joissa
 10 oli 1,0 ml:n näytteitä näytteenottoliuosta, 0,0035-m kaliumdivetyfosfaattivesiliuosta, jossa oli 0,2 % lesitiiniä ja 1,55 % polysorbaatti 80:tä (kauppanimi Tween 80), siirrettiin soija-kaseiinielatusagarille levynvalamistekniikalla. Levyt inkuboitiin 73°C:ssa ja laskettiin bak-
 15 teerien lukumäärä. Laskettiin lukumäärien keskimääräiset kymmenlogaritmiarvot ja väheneminen kontrolliin verrattuna ja analysoitiin statistisesti. Seuraavat tulokset ja niille lasketut keskivirheet, jotka saatiin käyttämällä kymmentä kiekkoa jokaista kontrolliliuosta ja testatta-
 20 vaa esimerkkiä kohti, osoittavat että esimerkkien 3 ja 4 koostumukset vähensivät merkitsevästi kiekoissa olevien bakteerien lukumäärän keskimääräistä kymmenlogaritmiarvoa.

25	Esi- merkki	Havaittujen bakteerien lukumäärän keskim. $\log_{10}$ kiekkoa kohti	Bakteerien lukumäärän vähenemisen $\log_{10}$ kontrolliin verrattuna kiekkoa kohti
	3	4,77 $\pm$ 0,18	1,43 $\pm$ 0,18
	4	4,58 $\pm$ 0,12	1,62 $\pm$ 0,12

30

Apinan käden hankaustesti

Määritettiin esimerkkien 1-4 koostumusten antimikrobinen vaikutus nukutettujen apinoiden käsien normaaliin bakteeriflooraan. Kukin käsi testattiin erikseen ja mie-
 35 livaltaisessa järjestelyksessä. Käsiä hangattiin ensin kaksi minuuttia Camay-merkkisellä tankosaippualla lämpi-

mässä vesijohtovedessä, huuhdeltiin yksi minuutti juokse-
vassa, lämpimässä vesijohtovedessä, pestiin kaksi minuut-
tai Camay-merkkisellä tankosaippualla, huuhdeltiin kaksi
minuuttia juoksevassa, lämpimässä vesijohtovedessä ja
5 kuivattiin steriilillä pyyheliinalla. Tämän jälkeen otet-
tiin näytteet mikroflooran määrittämistä varten ennen han-
kaamista testikoostumuksella.

Näytteenotto tapahtui siten, että käteen vedettiin
steriili, lateksista valmistettu kirurginhansikas, hansik-
10 kaaseen kaadettiin 100 ml fosfaattivesiliuoksella (0,07-m,
pH 7,8) puskuroitua näytteenottoliuosta, jossa oli 0,1 %
polyeteeniglykoli-p-iso-oktyylyfenyylieetteriä (kauppani-
mi Triton X-100), näytteenottonesteessä olevaa kättä
hierottiin minuutti ja näyte näytteenottonesteestä (10 ml)
15 laimennettiin samalla tilavuudella fosfaattivesiliuoksel-
la (pH 7,2) puskuroitua, 2 % naftaleenisulfonihapon nat-
riumsuolan ja anionisen dispergointiaineen kondensaattia
(kauppanimi Tamol-N Micro) sisältävää neutralointiliuos-
ta. Näin neutraloidun näytteen tilavuudeksi tuli 20 ml.

20 Sitten kättä pestiin 45 sekuntia ja hangattiin
15 sekuntia 5 ml:lla testikoostumusta, huuhdeltiin 30 se-
kuntia lämpimän, juoksevan vesijohtoveden alla, pestiin
90 sekuntia ja hangattiin 30 sekuntia 5 ml:n lisämäärällä
testikoostumusta, huuhdeltiin jälleen 30 sekuntia lämpi-
25 män, juoksevan vesijohtoveden alla, kuivattiin steriilil-
lällä pyyheliinalla ja näytteenotto toistettiin. Tämä menet-
tely toistettiin kolme kertaa ja kokonaisuudessaan neljä
kertaa kahdeksan tunnin aikana niin, että käsittelyjen
(hankausten) minimiväliaika oli yksi tunti. Kolmannen
30 hankauksen jälkeen ei otettu näytettä.

Sitten jokaisesta neutraloidusta näytteestä ja jo-
kaisesta siitä valmistetusta kolmesta peräkkäisestä kym-
menkertaisesta laimennoksesta otettiin kolme rinnakkais-
näytettä (kukin 1 ml), jotka siirrettiin soija-kaseiini-
35 elatusagarille levynvälämistekniikalla. Levyt inkuboi-

tiin aerobisesti 37°C :ssa 48-72 tuntia ja sitten laskettiin bakteerien lukumäärä automaattisella pesäkelaskurilla (malli 880 Artek Systems Corp.), joka oli kytketty tietokoneeseen (PDP 15). Tietojen käsittelyä varten oli laadittu ohjelma ja arvot on ilmoitettu alla lukumäärän vähennemisen keskimääräisenä kymmenlogaritmina tilanteesta tankosaippuahankauksen jälkeen ja ennen ensimmäistä testikoostumushankausta (esihankaus 1) tilanteeseen ensimmäisen (jälkihankaus 1), toisen (jälkihankaus 2) ja neljännän (jälkihankaus 4) testikoostumushankauksen jälkeen, sekä lukumäärän kokonaisvähennemisen keskimääräisenä kymmenlogaritmina.

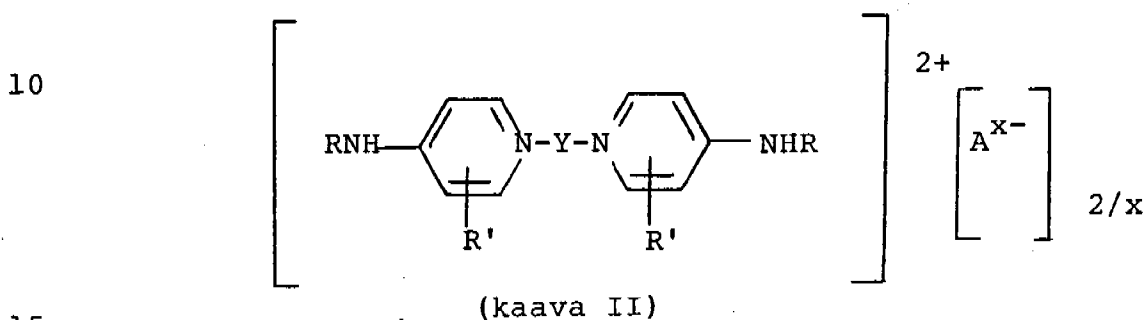
Seuraavat tulokset mukaanlukien keskivirheet saatiin käyttämällä 20 kättä kumpaakin esimerkkiä 1 ja 2 ja 24 kättä kumpaakin esimerkkiä 3 ja 4 kohti. Tulokset osoittavat, että mikrobien lukumäärän väheneminen oli merkitsevästi ja kasvavasti suurempi jokaisen koostumuksen jokaisella hankauksen jälkeisellä näytteenottokerralla.

Lukumäärän vähennemisen keskim. $\log_{10}$ esihankauksesta 1 lähtien

	<u>Esimerkki</u>	<u>Jälkihankaus 1</u>	<u>Jälkihankaus 2</u>	<u>Jälkihan- kaus 4</u>	<u>Yhteensä</u>
	1	1,08 $\pm$ 0,10	1,45 $\pm$ 0,15	2,67 $\pm$ 0,26	1,73
25	2	1,11 $\pm$ 0,11	1,67 $\pm$ 0,18	2,82 $\pm$ 0,22	1,87
	3	1,11 $\pm$ 0,11	1,70 $\pm$ 0,14	2,72 $\pm$ 0,24	1,84
	4	0,86 $\pm$ 0,08	1,15 $\pm$ 0,15	2,24 $\pm$ 0,25	1,41

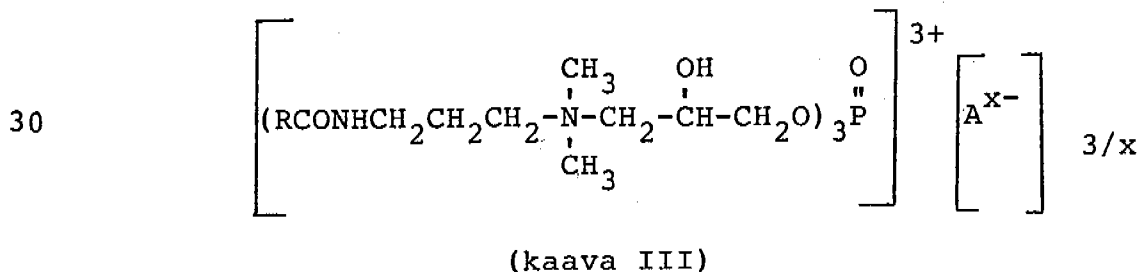
Patenttivaatimukset

1. Antimikrobinen koostumus pintojen desifiointiin, jota ei ole tarkoitettu lääkitykseen, t u n n e t t u
 5 siitä, että se käsittää
 A) n. 0,01 - n. 10 paino-% antimikrobista ainetta, jolla on rakennekaava:



- jossa Y on 4-18 hiiliatomia sisältävä alkyleeni, joka erottaa molemmat pyridiniumryhmät 4-18 hiiliatomilla, R on kummassakin pyridiniumryhmässä sama ja on 6-18 hiiliatomia sisältävä alkyyli, 5-7 hiiliatomia sisältävä
 20 sykloalkyyli, bentsyyli tai fenyyli substituoituna metyleenidioksilla tai yhdellä tai kahdella substituentilla ryhmästä halogeeni, alempi-alkyyli, alempi-alkoksi, nitro, syano ja trifluorimetyyli, R' on kummassakin pyridiniumryhmässä sama ja on vety tai alempi-alkyyli, A^{x-} on
 25 farmaseuttisesti hyväksyttävä anioni ja x on anionin valenssi,

- B) n. 0,1 - n. 50 paino-% yhdistettä, jolla on kaava:



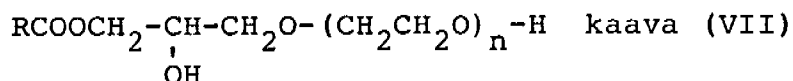
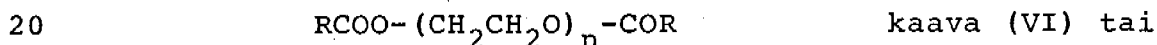
- 35 jossa R on 5-17 hiiliatomia sisältävä alkyyli, A^{x-} on farmaseuttisesti hyväksyttävä anioni ja x on anionin valenssi, ja

C) vesipitoista väliainetta.

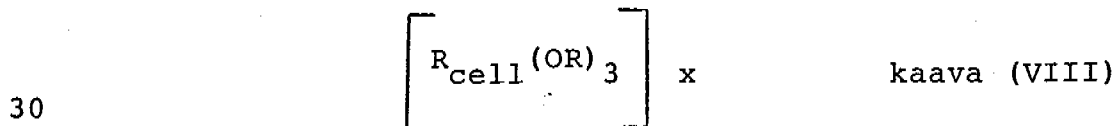
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen koostumus, t u n n e t t u siitä, että kaavan (II) mukaisessa yhdisteessä Y on 1,10-dekyleeni, R on n-oktyyli, R' on vety, 5 A^{-x} on kloridi-ioni ja x on 1, ts. kaavan (II) mukainen yhdiste on oktenidiinihydrokloridi.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen koostumus, t u n n e t t u siitä, että kaavan (III) mukaisessa yhdisteessä RCO on kookospähkinähapporadikaali, A^{-x} on kloridi-ioni ja x on 1, ts. kaavan (III) mukainen yhdiste 10 on kokamidopropyyli-PG-dimoniumkloridifosfaatti.

4. Jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen mukainen koostumus, t u n n e t t u siitä, että komponentti B sisältää lisäksi yhden tai useampia yhdisteitä ryhmästä, 15 joka käsittää
b) yhdisteen, jolla on kaava



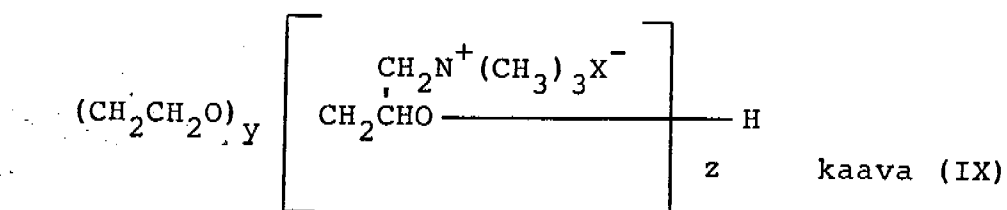
25 jossa R on 8-20 hiiliatomia sisältävä alkyyli tai alkenyyli tai lanoliini ja n on kokonaisluku n. 8 - n. 200, ja
c) yhdisteen, jolla on kaava



jossa R_{cell} on anhydroglukoosiyksikön tähde ($C_6H_{10}O_5$),

x on polymerointiaste ja on kokonaisluku n. 50 - n.

20 000, edullisesti n. 200 - n. 5000, radikaalit R ovat samoja tai erilaisia ja niillä on kaava



5 jossa y on kokonaisluku 0-10, z on kokonaisluku 0-3, edellyttäen, että y ja z eivät samanaikaisesti ole nollija, ja X^- on farmaseuttisesti hyväksyttävä anioni.

5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen koostumus,
t u n n e t t u siitä, että lisäyhdiste on kaavan (VII)
10 mukainen ja erityisesti yhdiste, jossa RCO on kookospähkinähapporadikaali ja n on keskimäärin 78, ts. kaavan (VII) mukainen yhdiste on PEG-78-glyseryylikokoaatti.

6. Patenttivaatimuksen 4 mukainen koostumus,
t u n n e t t u siitä, että lisäyhdiste on kaavan (VIII)
15 mukainen ja erityisesti se on Polyquaternium-10.

7. Jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen 4-6 mukainen koostumus, t u n n e t t u siitä, että se sisältää n. 1 - n. 10 % antimikrobista ainetta A), n. 5 - n. 20 % komponenttia B) ja n. 5 - n. 20 % lisäainetta,
20 joka on polyeteeniglykolitensidi.

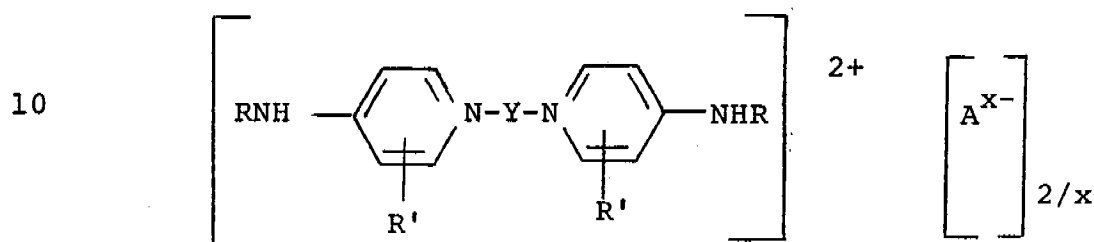
8. Ei-terapeuttinen menetelmä elävän tai ei-elävän pinnan desifioimiseksi, t u n n e t t u siitä, että pinnalle levitetään antimikrobisesti tehokas määrä jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen mukaista koostu-
25 musta.

Patentkrav

1. Antimikrobiell komposition för desinfektering av ytor, vilken inte avsetts för medicineri, k ä n n e -

5 t e c k n a d därav, att den omfattar:

A) ca. 0,01 - ca. 10 vikt-% av ett antimikrobiellt ämne med strukturformeln:

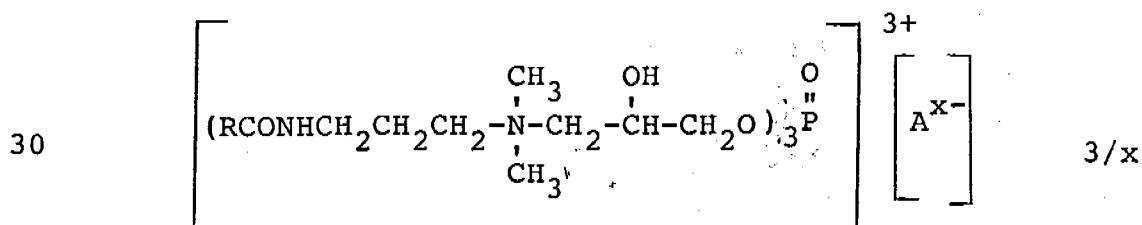


(formel II)

15

vari Y är alkylen med 4-18 kolatomer, vilken åtskiljer de båda pyridiniumgrupperna från varandra med 4-18 kolatomer, R är samma i båda pyridiniumgrupper och är alkyl med 6-18 kolatomer, cykloalkyl med 5-7 kolatomer, bensyl eller fe-
 20 nyl substituerad med metylendioxi eller en eller två substituenter från gruppen bestående av halogen, lägre-alkyl, lägre-alkoxi, nitro, cyano och trifluormetyl, R' är samma i båda pyridiniumgrupper och är väte eller lägre-alkyl, A^{x-} är en farmaceutiskt godtagbar anjon och x är anjonens
 25 valens,

B) ca. 0,1 - ca. 50 vikt-% av en förening med formeln:



(formel III)

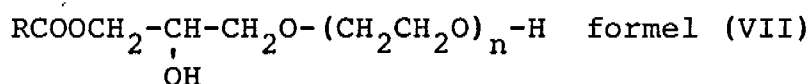
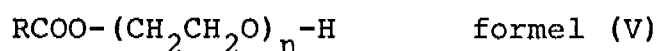
vari R är alkyl med 5-17 kolatomer, A^{x-} är en farmaceutiskt
 35 godtagbar anjon och x är anjonens valens, och

C) ett vattenhaltigt medium.

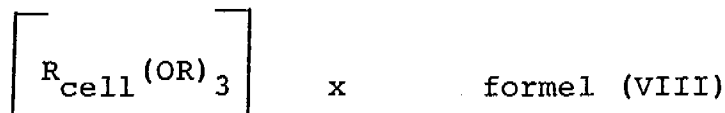
2. Komposition enligt patentkravet 1, k ä n n e -
t e c k n a d därav, att i föreningen med formeln (II)
är Y 1,10-decylen, R är n-oktyl, R' är väte, A^{x-} är en
5 kloridjon och x är 1, dvs. föreningen med formeln (II)
är oktenidinhydroklorid.

3. Komposition enligt patentkravet 1 eller 2,
k ä n n e t e c k n a d därav, att i föreningen med for-
meln (III) är RCO en kokosnötsyraradikal, A^{x-} är en klo-
10 ridjon och x är 1, dvs. föreningen med formeln (III) är
kokamidopropyl-PG-dimoniumkloridfosfat.

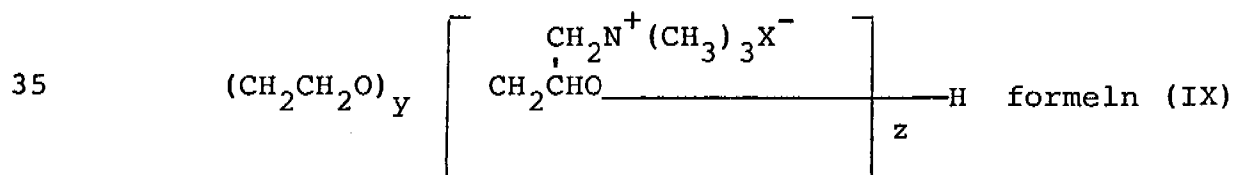
4. Komposition enligt något av de föregående pa-
tentkraven, k ä n n e t e c k n a d därav, att kompo-
nent B ytterligare innehåller en eller två föreningar
15 från gruppen, som omfattar
b) en förening med formeln



vari R är alkyl eller alkenyl med 8-20 kolatomer eller
lanolin och n är ett heltal av ca. 8 - ca. 200, och
25 c) en förening med formeln



30 vari R_{cell} är resten av en anhydroglukosenhet (C₆H₁₀O₅),
x är polymeriseringsgrad och är ett heltal av ca. 50 -
ca. 20 000, företrädesvis ca. 200 - ca. 5 000, radikalerna
R är lika eller olika och de har formeln



vari y är ett heltal 0-10, z är ett heltal 0-3, förutsatt, att y och z inte samtidigt betecknar noll, och X^- är en farmaceutiskt godtagbar anjon.

5 5. Komposition enligt patentkravet 4, k ä n n e -
t e c k n a d därav, att den ytterligare föreningen är
en förening med formeln (VII) och speciellt en förening
där RCO är en kokosnötsyraradikal och n har ett genomsnitt-
ligt värde av 78, dvs. föreningen med formeln (VII) är
PEG-78-glycerylkokoat.

10 6. Komposition enligt patentkravet 4, k ä n n e -
t e c k n a d därav, att den ytterligare föreningen är
en förening med formeln (VIII) och speciellt Polyquater-
nium-10.

15 7. Komposition enligt något av de föregående pa-
tentkraven 4-6, k ä n n e t e c k n a d därav, att den
innehåller ca. 1 - ca. 10 % av det antimikrobiella ämnet
A), ca. 5 - ca. 20 % av komponent B) och ca. 5 - ca. 20 %
av det ytterligare ämnet, som är en polyetenglykoltensid.

20 8. Icke-terapeutiskt förfarande för desinfektering
av en levande eller icke-levande yta, k ä n n e t e c k -
n a t därav, att på ytan anbringas en antimikrobiellt
effektiv mängd av en komposition enligt något av de före-
gående patentkraven.

Viitejulkaisu - Anförda publikationer

Julkisia suomalaisia patenttihakemuksia: - Offentliga finska patentansökningar:

Hakemus-, kuulutus- ja patenttijulkaisu: - Ansökningspublikationer,
utläggnings- och patentskrifter:FI

CH

DE

DK

FR

GB *P 1533 952 CO7D 2/3/72*

NO

SE

US

Merkitse hakemusjulkaisun (esim. saksal. Offenlegungsschrift) numeron
eteen H ja vastaavasti kuulutus- ja patenttijulkaisun numeron K ja P.

EP

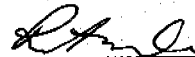
P 13713 CID 1/34

P 24 031 CID 3/37

WO

Muita julkaisuja: - Andra publikationer:

Merck Index 8. painos 1968, s. 236



Allekirjoitus