



República Federativa do Brasil
Ministério da Economia
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(11) PI 1009813-5 B1



(22) Data do Depósito: 11/03/2010

(45) Data de Concessão: 09/03/2021

(54) Título: COMPOSIÇÃO REPELENTE ANTI-INSETOS E MÉTODO PARA REPELIR OS INSETOS DA PELE

(51) Int.Cl.: A01N 43/40; A01P 17/00; A01N 25/10; A01N 25/24.

(30) Prioridade Unionista: 13/03/2009 FR 09 51590.

(73) Titular(es): DAKEM.

(72) Inventor(es): MARC ESCULIER.

(86) Pedido PCT: PCT IB2010051050 de 11/03/2010

(87) Publicação PCT: WO 2010/103478 de 16/09/2010

(85) Data do Início da Fase Nacional: 12/09/2011

(57) Resumo: COMPOSIÇÃO REPELENTE ANTI-INSETOS E MÉTODO PARA REPELIR OS INSETOS DA PELE A presente invenção refere-se a uma composição repelente anti-insetos compreendendo, em um meio fisiologicamente aceitável, a título de material ativo repelente para os insetos, pelo menos 1-metilpropila (2-(2-hidroxiethyl) piperidina-1- carboxilato, o referido ativo sendo empregado com pelo menos um copolímero de vinilpirrolidona e alquila linear compreendendo pelo menos 16 átomos de carbono, a título de agente filmogênio. Ela visa, por outro lado, um método para repelir os insetos usando esta composição.

“COMPOSIÇÃO REPELENTE ANTI-INSETOS E MÉTODO PARA REPELIR OS INSETOS DA PELE”

[0001] A presente invenção tem por objeto uma composição repelente anti-insetos picadores, notadamente os mosquitos.

[0002] É conhecido proteger-se dos insetos aplicando sobre a pele ativos repelentes. No entanto, a maior parte das soluções de proteção corporal contra os insetos picadores tem uma duração de eficácia limitada na medida em que esta frequentemente é afetada pela umidade do ambiente. Por exemplo, a taxa de umidade elevada das zonas tropicais, provoca nos indivíduos um aumento grande da sudorese que tem por efeito provocar uma eliminação prematura da composição anti-insetos aplicada na superfície da sua pele. Do mesmo modo, o contato direto com a água, por exemplo, durante um banho, com tal composição aplicada em superfície da pele, é naturalmente igualmente prejudicial.

[0003] Este defeito de resistência à água, manifestado por um grande número de composições anti-insetos, requer, portanto, uma vigilância do indivíduo tratado, que deve aplicar uma nova camada de composição após qualquer contato prolongado com a água ou sudorese significativa.

[0004] Para remediar este defeito, foi proposto o emprego de agentes filmogênicos, como, por exemplo, os copolímeros de vinilpirrolidona, para aumentar a resistência à umidade destas composições anti-inseto.

[0005] A presente invenção visa por seu lado propor uma nova composição anti-insetos acumulando boas propriedades repelentes em relação aos insetos e uma resistência particularmente aumentada em relação à umidade.

[0006] Mais precisamente, a presente invenção propõe uma composição fornecendo uma proteção repelente anti-insetos de longa duração incluindo em condições climáticas extremas e/ou após banhos curtos.

[0007] Os inventores assim descobriram de maneira surpreendente que a associação de um agente filmogênio particular e de uma material ativo repelente de última geração, como o 1-metilpropila (2-(2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato, permite obter tal composição.

[0008] O agente filmogênio considerado de acordo com a invenção assegura, com efeito, eficazmente a fixação da material ativo repelente e impede a sua eliminação ao contato da água.

[0009] Um primeiro objeto da invenção é, portanto, uma composição repelente anti-insetos compreendendo, em um meio fisiologicamente aceitável, a título de material ativo repelente para os insetos, pelo menos o 1-metilpropila (2- (2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato, o referido ativo sendo empregado com pelo menos um copolímero de vinilpirrolidona e alquila linear compreendendo pelo menos 16 átomos de carbono.

[0010] Um segundo objeto da invenção é um método para repelir os insetos frente a um suporte e mais particularmente a pele compreendendo a aplicação sobre o referido suporte de uma quantidade eficaz de pelo menos uma composição tal como foi definida na presente invenção.

[0011] Este suporte é com vantagem a pele, no entanto, pode tratar-se igualmente de um vestuário ou outro material têxtil destinado a assegurar a proteção da pele contra os insetos.

[0012] Como se nota dos exemplos que seguem o copolímero considerado de acordo com a invenção a título de agente filmogênio é vantajoso a vários títulos.

[0013] Em primeiro lugar, testes biológicos de eficácia em condições tropicais confirmaram uma eficácia de 8 horas sem nenhuma picada, a uma composição associando a mesma ao ativo anti-insetos retido de acordo com a invenção. Estes resultados mostram, portanto, que a aplicação deste copolímero específico permite garantir uma resistência aumentada à umidade da formulação anti-insetos e, portanto, conferir a esta formulação um caráter “waterproof”. Eles demonstram igualmente que este filmogênio específico não afeta, por outro lado, a reatividade do 1-metilpropila (2- (2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato em relação aos insetos. Este último permanece eficaz em doses convencionais de emprego.

[0014] Além disso, o copolímero considerado de acordo com a invenção revela-se fácil de formular. Assim, não requer uma quantidade excessiva de óleo para a sua realização. Consequentemente, ele pode ser formulado em uma emulsão aquosa não

graxa (sem efeito graxo, sem efeito adesivo ou dessecativo, sem manchas). Por outro lado, a sua eliminação pode ser obtida facilmente com a água com sabão.

[0015] Por último, este copolímero é particularmente interessante no plano da inocuidade e, a esse respeito, é compatível com uma aplicação sobre a pele, ou mesmo pálpebras e os lábios.

[0016] Com vantagem, a composição de acordo com a invenção apresenta-se sob forma de emulsão óleo-em-água.

[0017] Mais particularmente, esta composição manifesta uma resistência a água (“waterproof”).

Material ativo repelente

[0018] A composição repelente de acordo com a presente invenção, contem, a título de material ativo repelente para com os insetos, pelo menos o 1-metilpropila (2 -(2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato ou um dos seus sais.

[0019] O 1-metilpropila (2 -(2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato é conhecido igualmente sob o nome de ICARIDIN. Atualmente é comercializado sob o nome de SALTIDIN pela empresa Saltigo.

[0020] Uma composição de acordo com a invenção pode com vantagem conter 10 a 25% e preferivelmente de 15 a 22% em peso de 1-metilpropila (2 (2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato em relação ao seu peso total.

[0021] Como evidente, uma composição de acordo com a invenção pode compreender, por outro lado, outro material ativo adicional, notadamente com efeito repelente. Este pode notadamente ser escolhido entre o N, N-dietil-3-metilbenzamida (DEET), o butilacetilaminopropionato de etila (IR3535), a citronela ou ainda o geraniol.

Agente filmogênio

[0022] A composição repelente de acordo com a presente invenção, contem pelo menos igualmente um copolímero de vinilpirrolidona e alquila linear compreendendo pelo menos 16 átomos de carbono, a título de polímero filmogênio. De acordo com uma variante de realização preferida, o motivo alquila linear é com vantagem uma cadeia alquila linear em C₁₆ a C₁₈ e preferivelmente uma cadeia alquila linear em C₁₆.

[0023] Mais precisamente, o copolímero considerado de acordo com a invenção é

um copolímero de vinil pirrolidona e de hexadeceno ou um copolímero de vinil pirrolidona e de eicoseno.

[0024] Pode-se notadamente tratar de produtos comerciais seguintes, o Antaron V-216 e o Antaron V-220 comercializados por ISP (International Specialty Products).

[0025] A composição pode com vantagem conter de 0,1 a 15% e preferivelmente de 1 a 10% em peso de copolímeros de vinilpirrolidona e alquila linear em C₁₆ em relação ao seu peso total.

[0026] Outros agentes filmogênicos adicionais podem estar presentes conjuntamente com o copolímero considerado de acordo com a invenção.

[0027] A título ilustrativo e não limitativo destes agentes filmogênicos adicionais, podem ser notadamente citados o Tricontanil PVP, o copolímero diinolei/dimetil carbonato hidrogenado, os copolímeros de acrilatos ou ainda os copolímeros acrilatos/alquilmetacrilatos.

[0028] Por razões evidentes, o Icaridin e o agente filmogênio requerido de acordo com a invenção são formulados em um meio fisiologicamente aceitável.

[0029] Assim, uma composição de acordo com a invenção compreende com vantagem a título de meio fisiologicamente aceitável, um meio aquoso e em particular a água, preferivelmente desmineralizada. Este meio aquoso pode estar presente em uma quantidade indo até 80% e preferivelmente de 40 a 80% em peso em relação ao seu peso total.

[0030] A composição de acordo com a invenção pode, por outro lado, compreender um ou vários óleos de silicone. A título de exemplos de óleos de silicone que convêm à invenção podem notadamente ser citados dimeticona, trimeticona fenólica, meticona de alquila C₂₆-C₂₈, dimeticona cetílica e dimeticona estearílica e as suas misturas.

[0031] Estes óleos são interessantes no plano da formulação. Eles conferem também um caráter deslizante apreciável à aplicação às fórmulas compreendendo os mesmos. Além disso, com certeza estes óleos possuem, por outro lado, uma função emoliente.

[0032] Este óleo silicone é preferivelmente a dimeticona.

[0033] Com vantagem, uma composição de acordo com a invenção pode compreender de 0,1 a 10% e preferivelmente de 1 para 5% em peso de óleo (s) de silicone em relação ao seu peso total.

[0034] A composição apresenta-se com vantagem sob forma de emulsão, notadamente óleo em água.

[0035] Em relação a sua formulação de tipo emulsão, uma composição de acordo com a invenção compreende geralmente com vantagem um ou vários agentes emulsionantes. Este agente pode ser escolhido entre os ésteres de sacarose, os ésteres graxos de glicerol, os ácidos graxos, os alcoóis graxos etoxilados e as suas misturas.

[0036] A composição de acordo com a invenção pode com vantagem, por outro lado, compreender um ou vários umectantes. Este umedecendo pode ser escolhido entre os glicóis como a glicerina, propileno glicol, ou ainda o dipropileno glicol e as ceras como a manteiga de carité ou a cera de abelha e as suas misturas.

[0037] O umectante é preferivelmente a glicerina.

[0038] Do mesmo modo, uma composição de acordo com a invenção pode, por outro lado, compreender um ou vários emolientes. A título de exemplos de emolientes podem particularmente ser citados o benzoato de alquila em C₁₂ a C₁₅, o palmitato de isopropila, o miristato de isopropila, o palmitato de etil-hexila, os óleos vegetais, os óleos minerais, os silicones e as suas misturas.

[0039] O emoliente é preferivelmente o benzoato de alquila em C₁₂ a C₁₅.

[0040] A composição de acordo com a invenção pode, por outro lado, compreender um ou vários agentes gelificantes escolhidos entre o palmitato de sacarose, o estearato de glicerila, o citrato de estearato de glicerila e as suas misturas.

[0041] De acordo com uma variante de realização uma composição de acordo com a invenção, pode, por outro lado, compreender um ativo anti-UV apto a conferir à mesma propriedades protetoras em relação a uma exposição a UV.

[0042] A composição de acordo com a invenção pode, por outro lado, compreender os aditivos clássicos no domínio, como, por exemplo, os escolhidos entre a lista não exaustiva como os agentes quelantes, os conservantes, os

reguladores de pH, os perfumes.

[0043] Como precisado acima, a composição apresenta-se com vantagem sob forma de emulsão notadamente óleo em água. Esta composição pode apresentar-se sob forma de creme, um leite ou um gel, aplicável conforme o caso por pulverização.

[0044] A presente invenção visa, por outro lado, a utilização de uma composição, de acordo com a invenção, repelente em relação aos insetos. Mais precisamente, visa um método para repelir os insetos de uma pele compreendendo a aplicação em quantidade suficiente sobre um suporte, como a pele, ou destinado a ser colocado em contato com a mesma, de uma composição tal como foi definida de acordo com a presente invenção.

[0045] Os exemplos e figuras a seguir são apresentados a título ilustrativo e não limitativo da invenção.

Exemplo 1:

Formulação tópica de acordo com a invenção

Nome comercial	Nome INCI	Função	% Ponderal
Saltidin (Icaridin) comercializado por Saltigo	Carboxilato de hidroxietil isobutil piperidina	Anti-mosquito ativo	20
Antaron V 216 comercializado por ISP (International Specialty Products)	Copolímero de VP/hexadeceno	Filmogênio	5
DC 200 Fluid 100 CST	Dimeticona	Silicone	2
Tegosoft TN	C ₁₂₋₁₅ benzoato de alquila	Emoliente	2
Água desmineralizada	Água	Solvente	Qsp
Glicerina	Glicerina	Emoliente	5
Arlatone V 175	Palmitato de sacarose, Estearato de glicerila,	Emulsificante	1,10

	Estearato de glicerila, Citrato, sacarose Manano, goma de xantano		
Carbopol EDT 2050	Carbômero	Agente gelificante	0,10
EDTA dissódico	EDTA dissódico	Agente gelificante	0,10
Euxyl PE9010	Fenoxietanol, Etil-hexilglicerina	Conservador	0,80
Trietanolamina	Trietanolamina	Regulador de PH	0,10
Perfume Yakusa	Perfume	Perfume	1,50

Exemplo 2:

[0046] A eficácia da formulação do exemplo 1 foi apreciada no que diz respeito aos mosquitos *Anopheles stephensi*.

[0047] Na ausência de norma francesa, o método segue as linhas diretrizes seguintes:

[0048] Recomendações Gerais OMS: WHO/CDS/WHOPES/2001.2

[0049] ASTM (American Society for Testing and Materials): ASTM E951-94 (laboratório)

[0050] Os testes são efetuados com fêmeas de mosquitos criadas em laboratório: *Anophèles stephensi* (cepa ORSTOM).

[0051] As fêmeas utilizadas para os testes tem idade de 6 a 10 dias e sofreram um jejum prévio de 24 horas (sem refeições de sangue) a fim de aumentar a sua agressividade.

[0052] O alvo da refeição de sangue é um camundongo de tipo "hairless" (sem pelos) mantido em uma gaiola de contenção (olhos protegidos) e que é revestida de produto a testar (0,1 g/60 cm²). Aplicação por pipeta.

[0053] 30 minutos após aplicação do produto, o camundongo é introduzido depois em uma gaiola que contem cerca de 200 fêmeas (eliminação prévia dos machos por gradiente de alimento).

[0054] O teste dura 5 minutos e durante este prazo, registra-se o número de mosquitos que pousaram sobre o camundongo (efeito “landing”), depois o número de picadas efetivas (exceto se ineficácia manifesta).

[0055] O teste é parado a partir de 5 picadas efetivas.

[0056] O teste é recommçado com novos lotes de mosquitos, após 2, 4, 6, 7, 8 e 9 horas após aplicação de acordo com o limite de persistência do produto (o camundongo é liberado no intervalo).

[0057] O mesmo teste é realizado com camundongos que não receberam nenhum tratamento a fim de verificar a tendência natural dos mosquitos a picar. Verifica-se que há pelo menos 10 “landings” e mais de 5 picadas em 30 segundos para validar o teste.

[0058] O teste é parado no fim de 5 picadas (“stop”) na tabela dos dados que figuram abaixo.

[0059] Os dados de “landing” correspondem ao número de mosquitos que se colocam sobre a zona tratada, mas, que partem sem ter estado a picar. Este dado pode informar sobre o limite de persistência dos produtos porque os mosquitos aproximam-se cada vez mais da zona tratada até o efeito repelente seja insuficiente e que haja uma picada efetiva.

[0060] Durante e entre os prazos, os camundongos são mantidos em uma atmosfera de tipo “tropical” em condições controlados a 27 ± 1 °C e $70 \pm 5\%$ de umidade relativa.

[0061] As gaiolas são mudadas ao cada teste unitário e espaçadas de três metros.

[0062] Três repetições são efetuadas por fórmula a testar e sobre três camundongos diferentes, ou seja, nove testes unitários por fórmula.

[0063] Os resultados são apresentados na tabela I a seguir.

Tabela 1

ANOPHELES STEPHENSII	camun- dongo	rep.	T0+2H		T0+4H		T0+6H		T0+7H		T0+8H		T0+9H	
			P	L	P	L	P	L	P	L	P	L	P	L
Exemplo de formulação 1	1	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	stop	stop
		2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	stop	stop
		3	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	stop	stop

	2	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	stop	stop
		2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	stop	stop
		3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	stop	stop
	3	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	stop	stop
		2	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	stop	stop
		3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	stop	stop
	Produto de teste	1	1	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
			2	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
			3	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		2	1	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
			2	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
			3	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
		3	1	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
			2	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop
			3	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop	stop

O = número de picadas

Rep. Repetições

L : "landing" = número de mosquitos que pousaram no camundongo sobre a zona tratada

Stop = o teste é parado quando se observa mais de 5 picadas

[0064] Pode ser notado que nas condições deste teste, com as amostras fornecidas, cepas de insetos e método considerados, a fórmula mostrou um efeito repelente altamente significativo no frente a *Anophèles stephensi*. A persistência de ação é de 8 horas.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição repelente anti-insetos, caracterizada pelo fato de compreender, em um meio fisiologicamente aceitável, a título de material ativo repelente para os insetos, pelo menos 20% em peso de 1-metilpropila (2-(2-hidroxietil) piperidina-1-carboxilato, o referido agente ativo sendo empregado em um meio aquoso com cerca de 5% em peso de pelo menos um copolímero de vinilpirrolidona e hexadeceno e pelo menos um óleo de silicone.

2. Composição repelente de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de compreender de 40 a 80% em peso do meio aquoso em relação ao seu peso total.

3. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de compreender um ou vários óleos de silicone escolhidos entre a dimeticona, trimeticona fenílica, meticona de alquila C₂₆-C₂₈, dimeticona cetílica, dimeticona estearílica e as suas misturas.

4. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de compreender de 0,1 a 10% e preferivelmente de 1 para 5% em peso de óleo (s) de silicone em relação ao seu peso total.

5. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de compreender, por outro lado, um ou vários umectantes notadamente escolhidos entre os glicóis como a glicerina, propileno glicol, ou ainda o dipropileno glicol e as ceras como a manteiga de carité ou a cera de abelha e as suas misturas, preferivelmente a glicerina.

6. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de compreender, por outro lado, um ou vários emolientes notadamente escolhidos entre os ésteres como o benzoato de alquila de C₁₂ a C₁₅, o palmitato de isopropila, o miristato de isopropila, o palmitato de etil-hexila, os óleos vegetais, os óleos minerais, os silicones e as suas misturas, preferivelmente o benzoato de alquila de C₁₂ a C₁₅.

7. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações

precedentes, caracterizada pelo fato de que se apresenta sob a forma de emulsão, preferivelmente óleo em água.

8. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de compreender, por outro lado, um ou vários agentes emulsionantes escolhidos entre os ésteres de sacarose, os ésteres graxos de glicerol, os ácidos graxos, os alcoóis graxos etoxilados e as suas misturas e/ou um ou vários agentes gelificantes escolhidos entre o palmitato de sacarose, o estearato de glicerila, o citrato de estearato de glicerila e as suas misturas.

9. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de que apresenta uma resistência à água.

10. Composição repelente de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de se apresentar sob forma de creme, um leite ou um gel, aplicável conforme o caso por pulverização.

11. Método para repelir os insetos da pele, caracterizado pelo fato de compreender a aplicação em quantidade suficiente sobre um suporte, como a pele, ou destinado a ser colocado em contato com a mesma, de uma composição definida em qualquer uma das reivindicações 1 a 10.