



(19) INSTITUTO NACIONAL  
DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL  
PORTUGAL

(11) *Número de Publicação:* PT 93244 B

(51) *Classificação Internacional:* (Ed. 6)

A01N043/30 A

A61K007/40 B

(12) *FASCÍCULO DE PATENTE DE INVENÇÃO*

(22) <i>Data de depósito:</i> 1990.02.22	(73) <i>Titular(es):</i> CHARWELL CONSUMER PRODUCTS LIMITED CHARWELL HOUSE, BRAY ROAD VALE, GUERNSEY CHANNEL ISLAND GB
(30) <i>Prioridade:</i> 1989.02.28 GB 8904541	
(43) <i>Data de publicação do pedido:</i> 1990.08.31	(72) <i>Inventor(es):</i> WILLIAM JOHN OLIVER GB
(45) <i>Data e BPI da concessão:</i> 11/95 1995.11.15	(74) <i>Mandatário(s):</i> ANTÓNIO JOÃO COIMBRA DA CUNHA FERREIRA RUA DAS FLORES 74 4/AND. 1294 LISBOA PT

(54) *Epígrafe:* PROCESSO DE PREPARAÇÃO DE COMPOSIÇÕES PEDICULICIDAS À BASE DE PIPERONAL

(57) *Resumo:*

[Fig.]

70 684

DCW/VSW

PATENTE Nº. 93 244



"Processo de preparação de composições pediculicidas à base de piperonal"

para que

CHARWELL CONSUMER PRODUCTS LIMITED, pretende obter privilégio de invenção em Portugal.

#### RESUMO

O presente invento refere-se ao processo de preparação de uma composição pediculicida eficaz tanto contra piolhos adultos como contra lêndeas, e exhibe adicionalmente um forte efeito repelente sobre os piolhos adultos. O ingrediente activo é o piperonal do qual se forma, geralmente, uma solução com uma concentração de pelo menos 3%. Um componente adicional da composição é um material formador de película, o qual é capaz de manter o piperonal em contacto com o hospedeiro durante pelo menos duas horas.

MEMORIA DESCRITIVA

O presente invento refere-se ao processo de preparação de composições pediculicidas e inclui um processo para controlar in festações de piolhos.

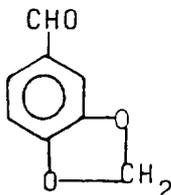
Os piolhos da cabeça constituem um problema de saúde comum e espalham-se rapidamente em instituições como as Forças Armadas e as escolas. Uma das dificuldades do controlo dos piolhos da cabeça é que as lêndeas se fixam muito firmemente à base dos cabelos por meio de secreções adesivas que as tornam muito difíceis de remover. Em segundo lugar, as lêndeas estão protegidas por uma cutícula cerosa que não é penetrada pelas preparações anti-piolhos correntemente disponíveis. Os processos convencionais para controlar os piolhos da cabeça dependem, portanto, do uso de um champô ou loção medicados que solta o adesivo ou goma natural que liga as lêndeas aos cabelos do escalpe e ao mesmo tempo é tóxico para os piolhos fertilizados e activos.

Embora muitas destas preparações convencionais sejam satisfatórias em alguns casos, se usadas conscientemente, o seu sucesso depende de profundos tratamentos, repetidos durante um longo período. Apresentam também a desvantagem de muitos dos repelentes de piolhos que são utilizados possuírem um cheiro desagradável, e isto desencoraja o seu uso contínuo, e correcto, durante o período de tratamento requerido.

Encontrou-se agora um composto relacionado com o benzaldeído que é muito eficaz contra lêndeas e que também actua como repelente de piolhos.

No seu aspecto mais alargado o invento proporciona uma composição pediculicida que é eficaz contra piolhos adultos e lêndeas, o qual compreende uma solução de piperonal, contendo a referida solução um componente que mantém o piperonal em contacto com o hospedeiro durante pelo menos 2 horas.

O piperonal é um aldeído aromático e tem a fórmula:



e a sua preparação é dada na patente dos E.U. nº 2916499 e em J. Org. Chem. 26, 4814 (1961).

No passado o piperonal foi muito largamente usado como constituente de perfumes e aromas em concentrações relativamente baixas, p.e. 50 ppm, conferindo um tom floral doce às fragâncias. O piperonal é solúvel em alcoóis, glicóis e alguns óleos.

Na prática do presente invento, é bastante importante que o piperonal seja mantido em solução, dado que não é tão eficaz no seu estado sólido. Embora o piperonal seja solúvel em alcoóis de baixo peso molecular, p.e. etanol ou isopropanol, o álcool tende a separar-se, deixando o piperonal cristalino depositado no corpo ou cabelos do hospedeiro. Verificou-se que se consegue uma acção repelente, de longa duração, pela incorporação de um componente formador de película, hidrofílico, na composição. Embora não esteja completamente confirmado, crê-se que o componente formador de película, hidrofílico, reduz a taxa de evaporação do solvente, evitando assim a cristalização. Qualquer que seja o mecanismo exacto deste vantajoso efeito, as formulações que contêm este componente formador de película, exibiram um efeito fortemente repelente contra piolhos, que dura até 6 a 8 horas, após aplicação ao cabelo.

As soluções de piperonal contendo cerca de 1% de ingrediente activo não são, de modo geral, muito activas. É desejável uma concentração de pelo menos cerca de 3%, e preferem-se composições contendo pelo menos 4% de piperonal. Não há limite superior crítico, mas usualmente, não há vantagem em utilizar mais do que cerca de 10%.

Como indicado anteriormente, o piperonal é solúvel em álcoóis, glicóis e alguns óleos, em particular em óleos de terpenos. O etanol ou o propanol são convenientemente usados como solvente principal. Contudo, em ordem a reduzir a sua velocidade de evaporação, podem ser incluídos na formulação álcoóis de maior peso molecular, glicóis, óleos compatíveis e/ou água. Por exemplo, o solvente pode compreender 50 a 70% de etanol ou propanol. Os terpenos são um ingrediente opcional preferido, particularmente se se deseja um máximo de propriedades ovícidas. É uma propriedade dos terpenos, melhorarem a penetração, pelo piperonal, da cutícula cerosa das lêndeas. Outro componente opcional, desejável, é um hidrocar-



boneto de cadeia longa, alifático, que parece melhorar a molhabilidade da pele dos piolhos com as composições pediculicidas.

Os exemplos seguintes, nos quais todas as percentagens são em peso, fornecem composições pediculicidas ilustrativas, de acordo com o presente invento.

Os ingredientes especificados nos exemplos seguintes foram misturados nas quantidades indicadas para dar as formulações correspondentes.

#### Exemplo 1

Loção de piperonal com terpenos e alcanos de cadeia longa

Piperonal	5,0% p/p
Mistura de alcanos de cadeia longa (Shellsol T)	5,0% p/p
Terpineol	8,2% p/p
D-limoneno	5,3% p/p
Álcool isopropílico	76,5% p/p

O Shellsol T é uma mistura complexa de alcanos de cadeia longa.

O terpineol e o D-limoneno são terpenos de ocorrência natural, com pontos de ebulição bastante elevados.

#### Exemplo 2

Loção de piperonal com óleo essencial e resina copolimérica

Piperonal	5,0% p/p
Óleo de tomilho	0,5% p/p
Meristato de isopropilo	2,0% p/p
Propileno-glicol	10,0% p/p
Resina copolimérica de ácido adípico ( Cartaretin F )	1,0% p/p
Álcool isopropílico	50,0% p/p
Água	31,5% p/p

O óleo de tomilho é um óleo volátil, destilado a partir de Thymus vulgaris, e compreende principalmente timóis e carvacrol. É um anti-irritante. A cartaretin F é um copolímero de ácido adípico/dimetilamino-hidroxi-propildietilenotriamina. É um fixador do cabelo.

Exemplo 3

Loção de piperonal com lanolina solúvel

Piperonal	5,0% p/p
Lanolina solúvel (Lanexol AWS)	2,0% p/p
Etanol	60,0% p/p
Água	33,0% p/p

A lanolina solúvel é uma lanolina modificada. A lanolina é uma cera natural complexa, compreendendo ésteres e poliésteres de alcoóis gordos e ácidos gordos de cadeia longa.

Exemplo 4

Loção de piperonal com resina copolimérica PVP/VA

Piperonal	5,0% p/p
Resina PVP/VA (Kollidon VA 64)	1,0% p/p
Etanol	60,0% p/p
Água	34,0% p/p

PVP/VA é uma resina copolimérica de polivinilpirrolidona/acetato de vinilo. É um formador de película solúvel em água.

Exemplo 5

Loção de piperonal com resina polimérica

Piperonal	5,0% p/p
PVP (Kollidon 90)	1,0% p/p
Etanol	60,0% p/p

O PVP é uma resina polimérica de polivinilpirrolidona. É um formador de película solúvel em água.

Exemplo 6

Loção de piperonal com proteína de colagénio quaternizado

Piperonal	5,0% p/p
Proteína de colagénio quaternizado (Crotein Q)	0,5% p/p
Etanol	60,0% p/p
Água	34,5% p/p

A proteína de colagénio quaternizado é um derivado de amónio quaternário de proteína de colagénio hidrolisada. É um amaciador altamente nutritivo, solúvel em água.

Exemplo 7

Loção de piperonal com fluído de silicone modificado

Piperonal	5,0% p/p
Fluído de silicone modificado (Dow Corning 190)	1,0% p/p
Etanol	60,0% p/p
Água	34,0% p/p

O fluído de silicone modificado (Dow Corning 190) é um copolímero de glicol de silicone. É um agente molhante e de espalhamento.

Exemplo 8

Loção de piperonal com celulose quaternizada

Piperonal	5,0% p/p
Celulose Quaternizada (Crodacel QL)	1,0% p/p
Etanol	60,0% p/p
Água	34,0% p/p

Os derivados de celulose quaternizada são produzidos por quaternização de hidro-alquilceluloses com vários grupos alquilo. São agentes amaciadores.

Podem ser incluídos outros compostos pediculicidas nas composições deste invento p.e. malatião ou carbarilsevin, embora isto não seja essencial. Crê-se que o piperonal actua penetrando a cutícula cerosa das lêndêas e inactivando-as e, deste modo, não depende do desalojamento das lêndêas dos fios de cabelo, como acontece com muitas preparações anti-piolhos convencionais.

No tratamento de piolhos do cabelo, a formulação contendo piperonal é aplicada ao cabelo e deixada em contacto por períodos entre duas e doze horas. Podem ser incluídos na preparação outros aditivos, p.e. surfactantes para aumentar a molhabilidade do cabelo e ingredientes para baixar a velocidade de evaporação da solução.

As composições do presente invento apresentam várias vantagens em relação às composições anti-piolhos convencionais. Para além da sua eficácia a matar piolhos adultos e lêndêas, exhibe uma actividade repelente superior contra piolhos adultos. Além disto, devido a possuir um cheiro agradável e estar aprovado, pelas auto-

ridades governamentais competentes, como aditivo alimentar, o pi-peronal não apresenta qualquer perigo para a saúde na utilização das composições nem relutância entre as pessoas infectadas em aceitar o tratamento.

Embora o invento tenha sido descrito com particular referên-cia ao combate de infestações de piolhos da cabeça, as composições do invento são também eficazes do mesmo modo contra outros piolhos, p.e., piolhos ladros, piolhos do vestuário e piolhos do corpo.

REIVINDICAÇÕES

1 - Processo de preparação de uma composição pediculicida, eficaz contra piolhos adultos e lêndeas, caracterizado por compreender a formação de uma solução de piperonal, à qual é adicionado um componente que mantém o piperonal em contacto com o hospedeiro durante pelo menos 2 horas.

2 - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por a solução conter pelo menos 3% em peso de piperonal.

3 - Processo de acordo com a reivindicação 2, caracterizado por a composição conter de cerca de 4 a cerca de 10% em peso de piperonal.

4 - Processo de preparação de uma composição para o controlo de piolhos, caracterizado por compreender a formação de uma solução de piperonal, à qual é adicionado um componente formador de película, que é nutriente para o cabelo do hospedeiro.

5 - Processo de acordo com a reivindicação 4, caracterizado por o componente formador de película ser um polímero hidrofílico.

6 - Processo de acordo com a reivindicação 5, caracterizado por o componente formador de película ser seleccionado de entre um polímero de vinilpirrolidona, um polímero de acetato de vinilo, um colagénio quaternizado, um derivado de celulose quaternizado ou um polímero contendo grupos hidroxilo e amino.

7 - Processo de acordo com a reivindicação 5 ou 6 caracterizado por o formador de película hidrofílico estar presente numa quantidade de cerca de 0,3 a 3% em peso.

Lisboa, 22. FEV. 1990

CHARWELL CONSUMER PRODUCTS LIMITED

- O AGENTE OFICIAL -

