

新型杀菌剂——己脒定二羟乙基磺酸盐的特性及其应用

苏 强¹, 郭建维¹, 郑生华²

(1. 广东工业大学化工系, 广东 广州 510006; 2. 雅兰国际生物科技研究中心, 广东 广州 510470)

摘要: 介绍了一种新型杀菌剂己脒定二羟乙基磺酸盐的特性及应用, 己脒定二羟乙基磺酸盐的高效杀菌性、无刺激性和高安全性使其在化妆品中显示独特的功效, 尤其在去屑、祛痘和抗异味等产品中有其独特优势, 具有广泛的应用前景。

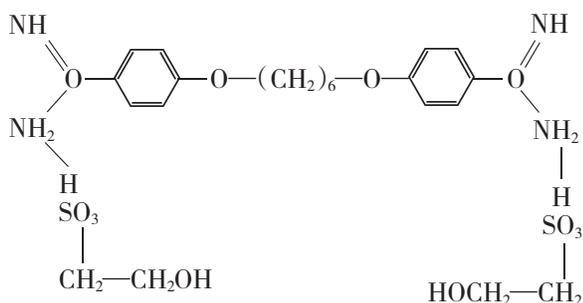
关键词: 化妆品; 杀菌剂; 己脒定二羟乙基磺酸盐

中图分类号: TQ658.9 **文献标识码:** A **文章编号:** 1006-7264(2011)08-0035-03

杀菌剂己脒定二羟乙基磺酸盐是 1 种水溶性的具有广谱抗菌和杀菌性能的阳离子性物质, 对各种革兰氏阳性菌及阴性菌以及各种霉菌和酵母菌都有很高的杀菌和抑菌性能。近年来, 关于它在化妆品和其他行业地应用研究已很多, 显示出它具有非常重要且广泛的应用前景。

1 己脒定二羟乙基磺酸盐的结构

己脒定二羟乙基磺酸盐(Hexamidine Diisethionate), 又称二羟乙基磺酸己氧苯脒, 分子式为: $C_{24}H_{38}N_4O_{10}S_2$, 其结构式为:



2 己脒定二羟乙基磺酸盐的毒理及抗菌性能

己脒定二羟乙基磺酸盐用在化妆品中作杀菌剂时, 其质量分数为 0.03% ~ 0.1%。在化妆品中, 它不但作为杀菌剂和防腐剂, 还可以用作非处方药品。研究表明, 活老鼠的皮肤对己脒定二羟乙基磺酸盐的吸收很差, 而且不会被存储在任何组织中。己脒定二羟乙基磺酸盐在老鼠体内被迅速代谢为己脒定, 主要通过尿液, 少量通过粪便排出体外。小白鼠急性口服

LD₅₀值 0.71 g/kg ~ 2.5 g/kg, 而大老鼠为 0.75 g/kg。在无观测效应水平条件下, 己脒定二羟乙基磺酸盐的口服亚慢性毒性对大老鼠为每天 50 mg/kg。用兔子做亚慢性毒性试验, 兔子对 2% 的己脒定二羟乙基磺酸盐溶液没出现中毒现象。用己脒定二羟乙基磺酸盐溶液对兔子的眼睛做瞬变反应, 0.05% 己脒定二羟乙基磺酸盐没有产生任何反应, 0.10% 己脒定二羟乙基磺酸盐产生轻微的红斑。把 40% 的己脒定二羟乙基磺酸盐溶液涂于 10% 的大鼠体表面产生轻微红斑, 轻度水肿。通过老鼠和兔子的研究, 证明己脒定二羟乙基磺酸盐不是一个致敏剂, 不会引起细菌的诱变。通过临床试验受试者的测试, 0.10% 己脒定二羟乙基磺酸盐溶液不会对人引起主要的刺激和炎症^[2,3]。

己脒定二羟乙基磺酸盐是具有广谱抗菌和杀菌性能的物质, 对各种革兰氏阳性菌及阴性菌以及各种霉菌和酵母菌都有很高的的杀菌和抑菌性能, 特别对引起头屑的卵状糠秕孢子菌, 引起粉刺的痤疮丙酸杆菌有很强的抑制和灭菌效果。

一般而言, 杀菌剂的最小抑菌浓度越小, 其杀菌能力效率越高。己脒定二羟乙基磺酸盐的抗菌性能如表 1 所示。

3 己脒定二羟乙基磺酸盐在化妆品中的应用

己脒定二羟乙基磺酸盐作为一种高效的广谱抗菌剂, 非常安全和温和, 对皮肤的刺激性较小, 与日化产品中常用原料有优良的配伍性, 因此在化妆品行业具有非常独特的应用。

收稿日期: 2011-06-20

作者简介: 苏 强 (1986-), 男, 湖南人, 硕士。

表 1 己脒定二羟乙基磺酸盐的抗菌性能

Tab.1 Antibacterial properties of hexamidine diisethionate

微生物测试	菌株参考号	MIC / $\mu\text{g}\cdot\text{mL}^{-1}$	MMC / $\mu\text{g}\cdot\text{mL}^{-1}$
金黄色葡萄球菌	MH 19	1	8
表皮葡萄球菌	NCIB 8853	0.8	25
八叠球菌	ATCC 9341	0.8	1.6
化脓链球菌	NCTC 2432	0.5	0.64
干燥棒状杆菌	NCTC 8481	3.2	3.2
粉刺丙酸杆菌	NCTC 521	0.1	12.4
颗粒丙酸杆菌	NCTC 521	0.1	12.4
卵状糠秕孢子菌	NCYC 0218	12.4	100
节眼蚤菌		250	
毛癣菌	NCPF 410	500	1000
普通变形杆菌	NCIB 4175	25	50
克雷伯杆菌	NCIB 10341	12	50
粘质沙雷菌	ATCC 14041	50	100
绿脓假单胞菌	ATCC 9027	50	50
枯草杆菌	ATCC 6633	3.2	6.4
白色链珠菌	ATCC 10231	3	6.4
青霉菌	ATCC 9644	0.8	1.6
黑曲霉菌	ATCC 16404	0.8	0.8

注: MIC 为最小抑菌浓度; MMC 为最小杀菌浓度

3.1 洗发和护发用品

己脒定二羟乙基磺酸盐是一种新型的去屑止痒剂,对于引起头屑的马拉色菌(卵状糠秕孢子菌),因其独特的结构具有非常强的杀灭作用。对马拉色菌的最小抑菌浓度(MIC)为 $12.5 \mu\text{g}/\text{mL}$,最小杀菌浓度(MMC)为 $100 \mu\text{g}/\text{mL}$;尤其因为其阳离子性对头发产生的吸附作用,更有利于其去屑作用的加强和持久发挥,这是其他去屑剂不具备的特性。皮肤科的临床研究表明,含 0.1% 己脒定二羟乙基磺酸盐的洗发香波较对照香波能明显降低单位面积头皮区域上的马拉色菌,而随着马拉色菌密度的降低,头皮屑的严重程度也有明显改善。一般的去屑香波添加 0.02% ~ 0.05% 即可达到明显的去屑效果。

除了其出色的去屑性能外,相对于其他去屑原

剂,还有其他优点:①使用方便简单:水溶、不沉降和无需悬浮;②不会引起变色;③非常安全和温和,甚至对眼睛都无刺激,也可存留于皮肤和头皮上;④应用面更广:除传统的去屑香波外,可用于透明香波、护发产品及喷雾剂型等;⑤不会影响洗发水手感的降低和变化,长期使用不会影响发质;⑥对生产设备无特殊要求。

3.2 祛痘产品和防痘产品

己脒定二羟乙基磺酸盐对粉刺丙酸杆菌的最低抑菌浓度(MIC)为 $0.1 \mu\text{g}/\text{mL}$,最低杀菌浓度(MMC)为 $12.4 \mu\text{g}/\text{mL}$,相对于水杨酸(MIC $>2000 \mu\text{g}/\text{mL}$)效果强许多倍;甚至比抗生素(化妆品已禁止使用)中的克林霉素(MIC 约 $32 \mu\text{g}/\text{mL}$)和红霉素(MIC 约 $64 \mu\text{g}/\text{mL}$)^[4]都有效得多,足见其对粉刺丙酸杆菌强大的杀灭作用。

己脒定二羟乙基磺酸盐特别适用于祛痘产品,添加量 0.08% ~ 0.1%。同时因为其良好的配伍性和稳定性使其几乎适用于各种剂型:霜、精华和啫喱等几乎所有化妆品剂型。

对于开放型痤疮,单独使用杀菌剂就有明显疗效,对于封闭型痤疮,适当配合加入剥离渗透的原料,如(包含水杨酸 Cyclosystem complex salicylic acid 50%)更有利于杀菌作用的迅速发挥。

另外,己脒定二羟乙基磺酸盐同时对粉刺丙酸杆菌的脂肪酶的抑制作用,使其特别适用于有粉刺倾向的油性皮肤,对于防痘产品:各类霜、乳、洗面奶和面膜等。

3.3 防腐剂

由于己脒定二羟乙基磺酸盐具有非常广谱的抗菌和杀菌性能,非常适合当防腐剂使用,国外已有许多专利和文献采用它作为防腐剂,但因为其相对较高的成本,使其在防腐剂方面的应用受到限制。

3.4 除异味产品和抗汗配方

腋下等部位的异味都是由微生物引起,己脒定二羟乙基磺酸盐优越的杀菌性能和水溶等特点,使其各种剂型(含喷雾水剂)的除异味配方非常有效,而且方便。

3.5 其他产品

由于己脒定二羟乙基磺酸盐高效的杀菌性能和对皮肤高的安全性和温和性,它还能用于剃须用品(预防须后皮肤感染)、护手霜甚至婴幼儿皮肤护理产品中。2002年, FDA 报道己脒定二羟乙基磺酸盐作为杀菌剂应用于 38 个产品中;2004年, CTFA 报道己

脒定二羟乙基磺酸盐在化妆品中的使用质量分数为 0.03% ~ 0.1%^[5,6]。

4 结语

目前, 己脒定二羟乙基磺酸盐凭借其高效的杀菌性、无刺激性和较高安全性的突出优点, 已广泛地应用于国外化妆品行业。目前除了进口的 ELESTAB® HP 100 供应外, 国内已有对应型号 Atdf® pf-95 满足供应。随着国内己脒定二羟乙基磺酸盐成本的降低和应用研究的不断深入, 在个人护理品以及洗涤用品等各种日化产品中, 它将成为活性抗菌成分的理想选择。尤其在去屑、祛痘和抗异味等配方中有其独特优势。

参考文献:

- [1] Tidwell R, Jones S K, Geratz J D, et al. Analogues of pentamidine in the treatment of experimental pneumocystis cariniipneumonia[J]. *Journal of Medicinal Chemistry*, 1990, 33(4): 1252-1257.
- [2] Eric H. Final report on the safety assessment of hexamidine and hexamidien diisethionate[J]. *International Journal of Toxicology*, 2007, 26(3): 79-90.
- [3] Wilma F B, Donald V B, Jame G M. et al. Safety of ingredients used in cosmetics [J]. *Journal of the American Academy of Dermatology*, 2005, 52(1): 125-132.
- [4] Young-Hee Lim. In vitro activity of kaempferol isolated from the impatiens balsamina alone and in combination with erythromycin or clindamycin against propionibacterium acnes[J]. *The Journal of Microbiology*, 2007(10): 473-477.
- [5] Joseph M Z. Susan A G. Personal care composition: US, 0038360[P]. 2008.
- [6] Anette B, Silke H, Alexander F. et al. Cosmetic preparation against skin pigmentation: US, 0181920[P]. 2008.

Properties and applications of a novel antiseptic —— hexamidine diisethionate

SU Qiang¹, GUO Jian-wei¹, ZHENG Sheng-hua²

(1. Chemical Engineering Department, Guangdong University of Technology, Guangzhou, Guangdong 510006, China;

2. Technology Research Center of Grandway International, Guangzhou, Guangdong 510470, China)

Abstract: The properties and applications of a novel antiseptic, hexamidine diisethionate were introduced. Hexamidine diisethionate is an efficient bactericidal with non-irritation to skin and good safety. It shows wide application in cosmetics specially in the anti-dandruff, anti-acne and anti-odor products.

Key words: cosmetic; antiseptic; hexamidine diisethionate

(上接第 30 页)

- [7] 蔡照胜. 微乳型厨房清洗剂的研制和生产[J]. *日用化学工业*, 2002, 32(3): 75-77.
- [8] 阎佳. 厨房油污清洗剂的研制[J]. *应用化工*, 2010, 4(4): 621-623.
- [9] 贺晓慧. 水基金属油污清洗剂的研制[J]. *精细化工*, 1998, 15(6): 11-13.
- [10] 周强, 金祝年. 涂料化学[M]. 北京: 化学工业出版社, 2009.
- [11] 刘方方, 李伟. 液体洗涤剂主要组分的选择和复配依据[J]. *河北科技大学学报*, 2007, 28(2): 114-118.
- [12] 陈瑞菁, 张丹林, 杨伟红. 油烟机清洁剂的研制[J]. *广州化工*, 1991(2): 24-27.

Formula design of liquid-base hard oil dirt cleaning agent for smoke extractor

JIANG Li, WANG Xiao-chun, ZHANG Lei

(Shanghai Hutchison WhiteCat Co., Ltd., Shanghai 200231, China)

Abstract: This paper analyzed the cleaning mechanism of liquid-based heavy oil soil cleaning agent. Orthogonal experiments were designed for formula development according to three cleaning methods and results were compared through cleaning efficiency test. Based on the data of orthogonal experiments, further discussion was made on how to raise cleaning efficiency. As a result, an optimized formula with lower cost was archived which showed better cleaning efficiency than other commercial products. Its detergency came to 99.8% after ten mins cleaning, and the flowing down of cleaning agent form dirt surface was delayed. The product has little fog when it is sprayed. It is good for use, harmless to human body and environmental friendly.

Key words: cleaning agent; heavy grease soil; environmental friendly; safety