



P A T E N T E
D E
I N V E N C I O N

203051

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE INSECTICIDAS ORGANICOS DE SINTESIS, ACTIVADOS", a favor de la firma italiana, MONTECATINI, Società Generale per l'Industria Mineraria e Chimica, de Milán (Italia).

MEMORIA DESCRIPTIVA

Sabido es que los insectos son capaces para la habituación al principio tóxico, y para dar nacimiento a cepas altamente resistentes por selección natural sucesiva, tras tratamiento repetidos a base de sustancias insecticidas.

5. Con este fenómeno está relacionada la eficacia insuficiente, o nula, puesta de manifiesto por algunos insecticidas orgánicos de síntesis en regiones, donde la lucha contra los insectos ha sido conducida con la máxima intensidad.

10. Cepas resistentes a un determinado insecticida (tal como por ejemplo el DDT, el hexaclorociclohexano, etc), pueden ser obtenidas en laboratorio, seleccionando los individuos por exposición a dosis de insecticida crecientes, con la sucesión de las generaciones. Como resultado final se puede criar insectos (por ejemplo Musca domestica) aptos de
15. quedar con vida en continuo contacto con dosis masivas del insecticida.



203051

5. La interpretación, ordinariamente aceptada, para explicar el fenómeno de que los insectos se van haciendo resistentes, admite un metabolismo de la sustancia tóxica en productos no tóxicos, que seguidamente son eliminados por el organismo. Con los insectos de susceptibilidad normal, la capacidad de metabolización resulta inferior a la cantidad de insecticida absorbida por el organismo para traspasar el umbral de la toxicidad.

10. El ir haciéndose resistente se derivaría de una exaltación de la capacidad de metabolismo, de modo que la cantidad de insecticida que penetra en el organismo no llega a traspasar del umbral de toxicidad.

15. Según otras opiniones, la acción tóxica sobre el insecto no sería desarrollada directamente por el producto insecticida tal cual, sino por productos particulares de metabolización del insecticida, según esta hipótesis, el irse haciendo se derivaría de una disminución de metabolizante frente a los productos tóxicos y de una eventual desviación de la metabolización hacia productos no tóxicos.

20. Publicaciones muy recientes han llamado la atención de los investigadores al interesante fenómeno del sinergismo en el terreno de los insecticidas; es decir, la posibilidad de obtener a través de la mezcla de dos o varias sustancias, de las cuales, a lo menos una, es un insecticida, un efecto tóxico considerablemente superior a la suma de los efectos tóxicos de los componentes individuales, aplicados por sí solos.

25. Por ejemplo, Perry y Hoskins (Science, 2 de junio de 1950), adicionando el piperonil-cicloneno al DDT ordinario, encontraron un sensible acrecentamiento de la mortalidad de
30.

3 - 203051

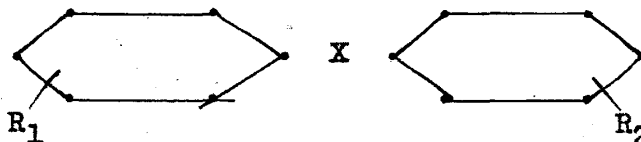


los insectos tratados de este modo, mientras que el piperonil cicloneno solo, no ejerce ninguna acción insecticida.

5. Ahora se ha encontrado y es esto lo que forma un objeto del presente invento, una serie de compuestos que, de suyo, no son insecticidas, o bien presentan un limitado poder insecticida, y que poseen las características de sinergismo para con los insecticidas orgánicos de síntesis.

10. Los compuestos que presentan una actividad sinergizante según el presente invento, corresponden a las siguientes tres fórmulas generales:

FORMULA 1



15. en la cual

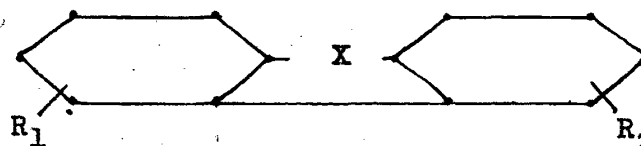
R₁) = -H; halógeno; -O-CH₃; -O-C₂H₅; -NH₂; -OH; (uno
R₂) = o varios átomos o grupos.

X = -CO-; -CH₂-; CH₃-CH=; C₆H₅-CH=; C₆H₅-C(=O)-
-NH-; Z; -N=N-; -N=N-NH-; -S-; -Se-; -NH-NH-
-N-

20.

Z = CH₃; C₂H₅; COCH₃; COH; COCH₂Cl

FORMULA 2



25.

en la cual

R₁) = H; NO₂; halógeno; NH₂; (uno o varios átomos o
R₂) = grupos)

X = -N-; -O-

30.

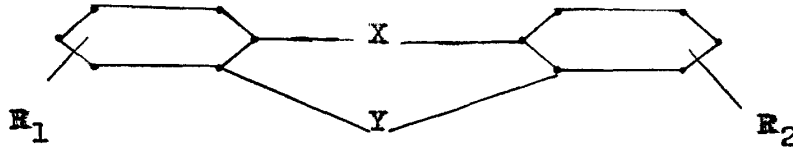
Z = -H; -CH₃; -C₂H₅;



203051

FORMULA 3

5.



en la cual

R_1
 R_2) = H; NO; halógeno; (uno o varios átomos o grupos)

10.

X } = -O- -S- -NH- -NH- -CS- =CN-C₆H₅
 Y } = =CH-OH ; =CH-OH ; -S- ; -O- ; -NH- ; -O-

con compuestos activos que recaen bajo las fórmulas generales indicadas más arriba, particularmente las siguientes:

15.

FORMULA 1

Benzofenona; 4,4'-diclorodifeniletano; trifenilmetano;
 trifenilclorometano; difenilamina; 4,4'-diclorodifenilamina;
 4-clorofenil-fenilamina; 4,4'-dimetoxidifenilamina; 4,4'-
 -dietoxidifenilamina; 4,4'-dioxidifenilamina; metildifenilamina;
 etildifenilamina; acetildifenilamina; formildifenilamina;
 cloroacetildifenilamina; p-aminobenceno; diazoaminobenceno.

25.

1,3,6,8-tetranitrocarbazol.

FORMULA 3.

fenotiacina.



La mayoría de las sustancias anteriormente citadas, son liposolubles, lo cual facilita la penetración mediante vehículo en el organismo del insecto.

5. Siempre conforme al invento, las sustancias aditivas son mezcladas en proporciones variables con el insecticida; dichas proporciones pueden variar de un 1,1 por ciento a un 2 por ciento, en el mejor de los casos, a un 10 al 30 por ciento para la mayoría de las aplicaciones, llegando hasta un 100 por ciento y más aún., estando referidos dichos porcentajes al peso del insecticida a activar.

10. La adición de las sustancias activadoras según el invento, puede practicarse el insecticida orgánico de síntesis tal cual, o a mezclas de insecticidas orgánicos de síntesis, o de insecticidas orgánicos de síntesis e inorgánicos, así como a las preparaciones ordinarias conteniendo sustancias inertes, diluentes, disolventes y similares, aptos para hacer posible el empleo de los mismos o de mejorar las características de empleo.

15. A título ilustrativo y no limitativo del invento, a continuación se facilitan algunos ejemplos de su realización.

EJEMPLO 1

20. Con una solución de DDT en benzol se constituye por evaporación del disolvente depósitos en la superficie interior de algunos matraces de 500 cm³, teniendo una superficie de 300 cm², de manera que se obtiene una concentración de 1 g de DDT por m² de superficie.

25. En las matraces se introduce 80 moscas (Musca doméstica), derivando de una cepa altamente resistente al DDT; al cabo de una estancia de 3 horas en los depósitos, las moscas son pasadas a la jaula de observación, donde se efectúan los
- 30.

203051



5. recuentos después de 20 horas. La mortalidad encontrada en estas condiciones importa un 5 por ciento. Efectuando los ensayos bajo las mismas condiciones y con la misma técnica y empleando soluciones bencénicas a base de benzol de DDT, mezcladas con el 20 por ciento de metildifenilamina, se encuentra una mortalidad de un 80 por ciento.

10. Resultados que concuerdan completamente con los arriba indicados, son obtenidos si se pone los insectos "test" en contacto con los depósitos de DDT, o respectivamente, de DDT con 20% de metildifenilamina, obtenidos en superficies porosas (cartón, o enlucidos, de cal y de arena) por rociada de emulsiones acuosas, de modo que se constituyen concentraciones en principio activo iguales a las citadas arriba (1 g/m²

EJEMPLO 2.

15. Individuos de Muesca doméstica, seleccionados sobre octacloro, expuestos durante dos horas a depósitos de 2 gramos por m² de DDT, sufren una mortalidad de un 21 por ciento; puestos en contacto durante dos horas con un depósito igual de DDT, con teniendo un 30 por ciento de 4,4'-dimetoxidifenilamina, manifiestan una mortalidad de un 90 por ciento.

EJEMPLO 3.

25. Individuos de Musca doméstica de elevada resistencia al DDT, expuestos durante dos horas a depósitos de un gramo por m² de metoxicloro, sufren una mortalidad de un 42 por ciento; puestos en contacto durante dos horas con un depósito igual de metoxicloro conteniendo un 25 por ciento de benzofenona, presentan una mortalidad de un 90 por ciento.

30. Desde luego se manifiesta el aumento del poder tóxico producido por los productos estudiados en los insecticidas orgánicos sintéticos, no solamente frente a las cepas de

-7- 203051



moscas que se han ido haciendo resistentes, sino asimismo, a moscas de susceptibilidad normal.

La invención, dentro de su esencialidad, podrá ser llevada a la práctica en otras variantes de realización que difieran en detalle de las indicadas a título de ejemplo, a las cuales alcanzará igualmente la protección que se recaba. Podrá, pues, realizarse, empleando los medios, aparatos, temperaturas y proporciones más adecuados a cada caso: por quedar todo ello comprendido dentro del espíritu de las reivindicaciones.

N O T A

Deserpto el objeto de la invención, se hace constar que la presente solicitud se acoge a los derechos de prioridad de la patente italiana de fecha 21 de abril de 1951, y se declaran como nuevas y de propia invención, las siguientes reivindicaciones:

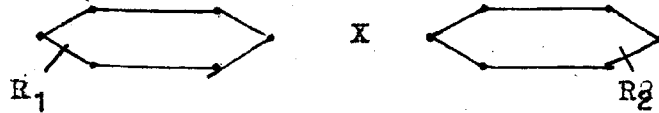
1ª.- Procedimiento para la preparación de insecticidas orgánicos de síntesis, activados, caracterizados por la presencia de sustancias activadoras, cuyas composiciones corresponden, esencialmente, a dos anillos bencénicos, no sustituidos, o sustituidos por halógeno; OH; -OCH₃; OC₂H₅; -NH₂, NO, -NO₂, dichos anillos bencénicos estando ligados entre sí por medio de; a lo menos, un puente constituido por un metaloide, o por una agrupación atómica bivalente.

2ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado por el hecho de que, como sustancias activadoras,

203051



son empleados compuestos que corresponden a la fórmula general



5.

en la cual

R_1
 R_2) = -H; halógeno; O-CH₃; -OC₂H₅; -NH₂; -OH; (uno o varios átomos o agrupaciones)

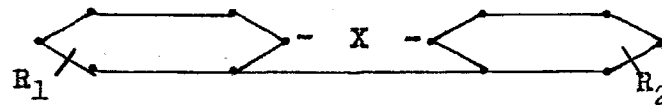
$X \neq$ -CO-; -CH₂-; CH₃-CH=; C₆H₅-CH=; C₆H₅-C(=O)-; NH-;
 Z ; -N=N-; -N=N-NH-; -S-; -Se-; -NH-NH-.
 \downarrow
 -N-

10.

$Z =$ -CH₃; -C₂H₅; -COCH₃; -COH; -COCH₂Cl.

3ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizados por el hecho de que, como substancias activadoras, se emplean compuestos correspondientes a la fórmula general:

15.



en la cual

R_1
 R_2) = -H; -NO₂; halógeno; -NH₂; (uno o varios átomos o agrupaciones).

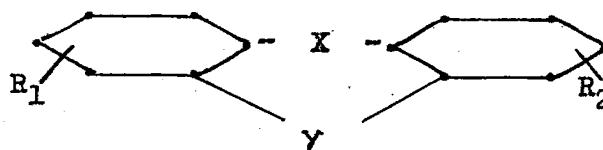
20.

$X =$ Z -O-
 -N-

Z -H-; CH₃; -C₂H₅

4ª.- Procedimiento según la reivindicación 3ª, caracterizado por el hecho de que, como substancias activadoras se utilizan compuestos correspondientes a la fórmula general:

25.



30.

en la cual



- 9 - 203051

R_1) = H; -NO; halógeno; (uno o varios átomos o agrupaciones).
 R_2

5. X) = $\begin{matrix} -O- & -S- & -NH- & -NH- & -CS- & =CN-C_6H_5 \\ -CH-OH & =CH-OH & -S- & -O- & -NH- & -O- \end{matrix}$

10. 5ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado por un contenido de substancia activadora que llega, al menos, a un 1,1 por ciento, oscilando, de preferencia, entre el 10 por ciento y el 30 por ciento, dichos porcentajes estando calculados sobre el peso del insecticida a activar.

15. 6ª.- Procedimiento según las reivindicaciones 2ª ó 5ª, caracterizado por el hecho de que, como substancias activadoras se utilizan, particularmente, la difenilamina, o sus derivados, conteniendo grupos de sustitución en los anillos, o hidrógeno en el grupo amino.

20. 7ª.- Procedimiento según las reivindicaciones 1ª y 6ª, caracterizado porque, cuando el vehículo está constituido a base de DDT, se emplea como medio activador, de un 10 al 30 por ciento, aproximadamente, de metildifenilamina, calculada sobre el peso del DDT.

25. 8ª.- Procedimiento según las reivindicaciones 1ª y 6ª, caracterizado porque, cuando el vehículo está constituido a base de DDT, se emplea como medio activador, de un 20 al 40 por ciento de 4,4'-dimetoxidifenilamina, calculada sobre el peso del DDT.

30. 9ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado por el hecho de que, cuando el vehículo está constituido a base de metoxicloro, se emplea como medio activador



203051

de un 15 a un 35 por ciento de benzofenona, calculada sobre el peso del metoxicloro.

10ª.- Procedimiento para la preparación de insecticidas orgánicos de síntesis, activadas.

5. Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de diez hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola cara, acompañadas de la documentación reglamentaria.

Madrid, a 18 de Abril de 1952.-

10.

p.a. JAIME ISERN MIRALLES
p p