

206031

30



CERTIFICADO

DE

ADICION 206031

por "MEJORAS INTRODUCIDAS EN EL OBJETO DE LA PATENTE PRINCIPAL, Nº 203.051", por "Procedimiento para la preparación de insecticidas orgánicos de síntesis, activados", a favor de la firma italiana, MONTECATINI, Società Generale per l'Industria Mineraria e Chimica, de Milano (Italia), Vía F. Turati, 18.

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

Es conocido que insectos sometidos a tratamientos repetidos a base de substancias insecticidas, están en condiciones de habituarse al principio tóxico y a criar razas altamente resistentes por selecciones naturales sucesivas.

5. Este fenómeno explica el efecto escaso o nulo, producido por algunos insecticidas de síntesis orgánicos en las regiones donde la lucha contra los insectos había sido llevada a cabo con la máxima intensidad.

10. Razas resistencias a determinados insecticidas (tales, como por ejemplo, el DDT, el hexaclorociclohexano, etc)., pueden obtenerse, en el laboratorio, seleccionando individuos por exposición a dosis de insecticida crecientes, con la sucesión de las generaciones. Como resultado final se puede criar insectos (por ejemplo Musca doméstica), capaces para quedar con vida en contacto continuo con dosis masivas de insecticida.

15.



206031

La interpretación, generalmente aceptada, para explicar el fenómeno de esta formación de razas resistentes con los insectos, admite un "metabolismo" de la substancia tóxica que transforma ésta en productos no tóxicos, eliminados seguidamente por el organismo. Con los insectos que tienen una susceptibilidad normal, la aptitud metabólica es inferior a la cantidad de insecticida absorbida por el organismo, de modo que el límite del "umbral de toxicidad" es traspasado.

5.

10.

15.

Según otras opiniones, la acción tóxica sobre el insecto no es producida directamente por el producto insecticida con tal, sino por productos particulares del "metabolismo" del insecticida; según esta hipótesis, se supone que la formación de razas resistentes se deriva de una disminución de la capacidad metabólica de formar los productos tóxicos y de una eventual desviación del metabolismo hacia la formación de 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, mezclando dos o varias substancias, de las cuales una, al menos, sea un insecticida, un efecto tóxico considerablemente más marcado que la suma de los efectos tóxicos de los componentes individuales utilizados solos.

25.

Por ejemplo, la solicitud de patente nº 203.051, del 18 de abril de 1952, de la misma petitionerio, tiene por objeto dar un número de substancias que, aunque no sean insecticidas en sí mismas, o que tengan solo un limitado poder insecticida, actúan como sinérgicas, si son adicionadas a insecticidas orgánicos sintéticos.

30.

Constituye un objeto del presente invento, facilitar

20631

30

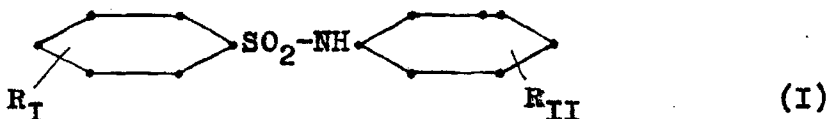


otra serie de sustancias que presentan una acción sinérgica en mezcla con insecticidas orgánicos sintéticos.

En efecto, se ha encontrado que los compuestos de la fórmula

5.

I



en la cual  $R_I$  y  $R_{II}$ , representan H, halógeno,  $\text{OCH}_3$ ,  $\text{OC}_2\text{H}_5$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NHCH}_3$ ,  $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ ,  $\text{NO}_2$ , OH,  $\text{CH}_3$ ,  $\text{C}_2\text{H}_5$  (uno o varios grupos, iguales o diferentes, con excepción del caso, en el cual  $R_I$  y  $R_{II}$  fuesen ambos  $\neq$  H), compuestos que se pueden definir como "anilidas de los ácidos arilsulfónicos, substituidos en, a lo menos, uno de los anillos", son "sinérgicos" para los insecticidas orgánicos sintéticos.

10.

15.

A título de ejemplo, pero no de limitación, los siguientes compuestos son sinérgicos conforme al presente invento:

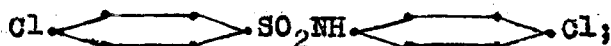
p-clorobenzolsulfonanisidida; p-clorobenzolsulfon-p-cloroanilida; 2,4-diclorobenzolsulfon-2-cloro-2-toluidida; 2-cloro-4-metilamino-benzolsulfon-4-cloroanilida; benzolsulfon-p-cloroanilida; p-clorobenzolsulfon-anilida; p-clorobenzolsulfon-p-toluidida; p-metoxibenzolsulfon-p-cloroanilida; p-metilbenzolsulfon-anilida; p-fenolsulfon-p-cloroanilida; p-metoxibenzolsulfon-anisidida.

20.

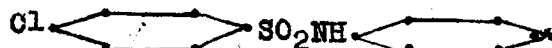
25.

Particularmente, se ha encontrado que los compuestos siguientes, presentan una actividad sinérgica considerable:

a) p-clorobenzolsulfon-p-cloroanilida (véase los ejemplos 1, 5, 6 y 7)

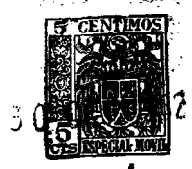


b) p-clorobenzolsulfon-anilida (véase el ejemplo 2)

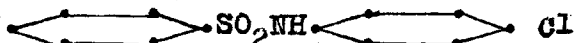


30.

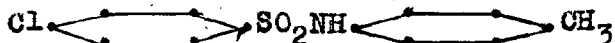
206031



c) benzol-p-cloroanilida (véase los ejemplos 3 y 8)



d) p-clorobenzolsulfon-p-toluidida (véase el ejemplo 4)



5.

Las sustancias activadoras o sinérgicas según el invento, pueden adicionarse a un insecticida orgánico de sintesis cualquiera, o a mezclas de insecticidas orgánicos de sintesis entre sí, o a mezclas de insecticidas orgánicos de sintesis con insecticidas inorgánicos, lo mismo que a preparaciones insecticidas ordinarias conteniendo sustancias inertes, diluentes, disolventes y similares, conforme a las exigencias del empleo práctico.

10.

Los sinérgicos según el presente invento pueden ser mezclados con el insecticida en proporciones variables según necesidad; estas proporciones pueden variar de 1%, o 2%, en los casos más favorables, a 10-30% en la mayoría de los casos de aplicación, pudiendo alcanzar 100% e incluso más, cuyos porcentajes están indicados con respecto al peso del insecticida a activar. El especialista en la materia determinará cómodamente las relaciones de adición de un sinérgico particular, del mismo modo en que determina las proporciones del insecticida, cuyas proporciones dependen esencialmente del coste como igualmente de las condiciones ambientes.

15.

20.

Naturalmente, el crecimiento de la toxicidad de los insecticidas orgánicos de síntesis, producido por los sinérgicos, resulta eficaz, no sólo contra las razas resistentes, sino también contra los insectos que tienen una susceptibilidad normal.

25.

30.

Los productos sinérgicos según la presente invención, resultan particularmente eficaces para combatir la formación

200031



de razas resistentes en las moscas domésticas, y son utilizados, con una ventaja particular, con el DDT y otros insecticidas clorados de síntesis, sin ser por éllo limitadoa a este empleo.

Los siguientes ejemplos experimentales muestran la acción sinérgica de los compuestos según el presente invento; dichos ejemplos se refieren al DDT y a las preparaciones de DDT con algunos otros insecticidas, en consideración a su importancia práctica, pero sin limitación.

5.

EJEMPLO 1.

10.

Se formó, con una solución bencénica de DDT, por evaporación del disolvente, depósitos sobre la superficie interior de unos "bakers", teniendo aproximadamente 500 cm<sup>2</sup> de superficie, la concentración fué de 0,04 g/m<sup>2</sup>.

15.

Alrededor de 200 moscas domésticas (Muesa doméstica) de una raza áltamente resistente al octacloro, fueron introducidas en las cámaras, las cuales fueron cubiertas con gasa. Las cámaras fueron volteadas en sentido de arriba a abajo y sostenidas en esta posición sobre apoyos de madera. Se efectuó la observación periódicamente durante 24 horas y se introdujo alimento durante este lapso para las moscas sobrevivientes, donde las había.

20.

Se encontró que, al cabo de 24 horas, la mortalidad fué de un 20 por ciento. Efectuando las mismas experiencias bajo las mismas condiciones y con la misma técnica, y utilizando soluciones bencénicas de DDT mezclado con un 10 por ciento de p-cloro-benzolsulfón-p-cloroanilida, se comprobó una mortalidad de un 97 por ciento.

25.

EJEMPLO 2.

30.

Con individuos de Muesa doméstica L, seleccionados sobre octacloro y expuestos a depósitos de 0,04 g/m<sup>2</sup> de DDT, ba



206031

jo las condiciones del Ejemplo 1, la mortalidad fué de un 20 por ciento al cabo de 24 horas; con individuos del mismo tipo puestos en contacto con un depósito igual de DDT, conteniendo un 25 por ciento de p-clorobenzolsulfon-anilida, la mortalidad alcanzó un 86 por ciento.

5.

EJEMPLO 3.

Con individuos de Musca doméstica L., seleccionado so bre octacloro, expuestos a depósitos de 0,04 g/m<sup>2</sup> de DDT, bajo las condiciones del ejemplo 1, la mortalidad fué de un 20 por ciento después de 24 horas; con individuos del mismo tipo, puestos en contacto con un depósito igual de DDT, conteniendo un 10 por ciento de benzolsulfon-p-cloroanilida, alcanzó la mortalidad un 90 por ciento.

10.

EJEMPLO 4.

Con individuos de Musca doméstica L., seleccionados so bre octacloro, expuestos a depósitos de 0,04 g/m<sup>2</sup> de DDT, bajo las condiciones del ejemplo 1, la mortalidad fué de un 20 por ciento después de 24 horas; con individuos del mismo tipo, puestos en contacto con un depósito igual de DDT, conteniendo 10% de p-clorobenzolsulfon-p-toluidida, la mortalidad alcanzó un 89 por ciento.

15.

20.

EJEMPLO 5.

El interior de una cámara de cristal de 2 m de largo y 6 metros de anchura fué rociado con 1 cm<sup>3</sup> de solución querosénica, conteniendo un 2 por ciento de DDT, con aire comprimido y a presión constante, mediante un rociador calibrado fijado a una distancia de 1, 25 m. de una pequeña jaula cúbica de hilo metálico de 11 cm. de costado, conteniendo alrededor de 250 moscas altamente resistentes al DDT y al octacloro. Al cabo de un minuto de presencia en la cámara tratada, fueron trasladadas las

25.

30.

2631



moscas a las jaulas de onserbación, provistas de alimento. Bajo estas condiciones se comprobó una mortalidad de un 30 por ciento

5. Efectuando el mismo experimento, rociando con 1 cm<sup>3</sup> de solución conteniendo un 2 por ciento de DDT y un 2 por ciento de p-cloro-benzol-sulfón-p-cloroanilida, se encontró después de 20 horas que la mortalidad era de un 96 por ciento.

EJEMPLO 6.

10. Siguiendo la misma técnica del ejemplo 5, y utilizando una solución querosénica conteniendo un 2 por ciento de DDT y un 0,4 por ciento de lindano, se comprobó un derribo de un 95 por ciento después de 20 minutos, y una mortalidad de un 12 por ciento al cabo de 20 horas.

15. Por otra parte, empleando una solución conteniendo un 2 por ciento de DDT, 0,4% de lindano, y un 0,4 por ciento de p-clorobenzolsulfón-p-cloroanilida, se comprobó un abatimiento de un 95 por ciento después de 20 minutos y una mortalidad de un 95 por ciento al cabo de 20 horas.

EJEMPLO 7.

201. Sobre placas de cartón se formó depósitos equivalentes a 2 g/m<sup>2</sup> de DDT, mediante un rociador calibrado, utilizando una emulsión de una parte de un preparado (conteniendo un 30 por ciento de DDT y 10 de emulsión en toluol) con tres partes de agua. 24 horas después de la rociadura, se puso grupos de moscas al tamente resistentes a todos los insecticidas (DDT, octacloro, 25. metoxicloro, dieldrina, aldrina, lindano, etc.) en contacto con las superficies tratadas.

30. Después de tres horas de presencia, las moscas fueron trasladadas en cajas de observación, provistas de alimento y, al cabo de 20 horas, se erectub el recuento de mortalidad. Se encontró de este modo que la mortalidad importó un 5 por oiento.

20031<sup>30</sup>



5. Teniendo las moscas bajo las mismas condiciones, en contacto con depósitos formados, empleando una preparación de toluol, conteniendo un 30 por ciento de DDT, un 3 por ciento de p-clorobenzolsulfon-p-clorocanilida y un 10 por ciento de emulgen te, siempre que una relación de dilución de una parte sobre tres partes de agua, se comprobó una mortalidad de un 96 por ciento.

EJEMPLO 8.

10. Siguiendo la misma técnica indicada en el Ejemplo 7, con una emulsión de 3 partes de agua y 1 parte de una prepara- ción conteniendo un 30 por ciento de DDT, un 15 por ciento de clorodano, y un 10 por ciento de emulgente en toluol, se formó sobre cartón depósitos equivalentes a 2 g de DDT y 1 g. de clo rodano por metro cuadrado.

15. Exponiendo a las superficies así tratadas moscas áltamen te resistentes a los insecticidas indicados en el Ejemplo 7, se comprobó una mortalidad de un 20 por ciento.

20. Siempre a base de los mismos métodos, pero utilizando un preparado conteniendo un 30 por ciento de DDT, un 15 por ciento de clorodano, un 5 por ciento de benzolsulfon-p-clorocanilida en toluol, se comprobó una mortalidad de un 98 por ciento.

25. La invención, dentro de su esencialidad, puede llevarse a la práctica en otras variantes de realización que difieran en detalle de las indicadas a título de ejemplo, pudiendo emplearse en su realización los medios, proporciones, temperaturas y tiem pos más convenientes a cada caso: por quedar todo ésto comprendi do dentro del espíritu de las reivindicaciones.

N O T A

206031

Hecha la descripción del presente invento, se hace constar que la presente solicitud se acoge a los derechos de prioridad de la patente italiana nº 8.695, depositada el día 5 de noviembre de 1951, y se declararán como nuevas y de propia invención, las siguientes reivindicaciones:

1. Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal, nº 203.051, por "Procedimiento para la preparación de insecticidas orgánicos de síntesis, activados", o de mezclas de insecticidas orgánicos de síntesis, con o sin adición de insecticidas inorgánicos, caracterizados por la presencia de sustancias activadoras de la clase de las anilinas de los ácidos arilsulfónicos, substituidas en, a lo menos, uno de los anillos.

2. Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas por el hecho de que los grupos substituyentes son los indicados para la fórmula I.

3. Mejoras según las reivindicaciones 1 o 2 caracterizadas por el hecho de que las sustancias activadoras son determinadas entre las clasificadas en la relación facilitada a título de ejemplo en la descripción.

4. Mejoras intrudicidas en el objeto de la patente principal, nº 203.051, caracterizadas por el hecho de ser activadas la preparación insecticida a base de DDT, preferentemente por adición de alrededor de un 10 por ciento de p-clorobenzolsulfon-p-cloroanilida sobre el peso del DDT.

5. Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal, nº 203.051, caracterizadas por el hecho de ser activada la preparación insecticida a base de DDT, por la adición,



206031

con preferencia, de alrededor de un 25 por ciento de p-cloroben-  
zol-sulfonanilida, sobre el peso del DDT.

5. 6ª.- Mejoras introducidas en el objeto de la patente prin-  
cipal, nº 203.031, paracterizadas por el hecho de activada la pre-  
paración insecticida a base de DDT, de preferencia, por la adición,  
aproximadamente, de un 10 por ciento de benzolsulfón-p-cloroanili-  
da sobre el peso del DDT.

10. 7ª.- Mejoras introducidas en el objeto de la patente prin-  
cipal, nº 203.051, caracterizadas por el hecho de ser activada la  
preparación insecticida a base de DDT, por la adición, de preferen-  
cia, de más o menos un 10 por ciento de p-clorobenzolsulfon-p-  
-toluida, sobre el peso del DDT.

15. 8ª.- Mejoras según la reivindicación 4ª, caracterizadas  
por el hecho de ser compuesta la preparación insecticida de una  
solución querosénica, conteniendo un 2 por ciento de DDT y un 0,2  
por ciento de p-cloro-benzol-sulfón-p-cloroanilida.

20. 9ª.- Mejoras según la reivindicación 4ª, caracterizadas  
por el hecho de ser compuesta la preparación insecticida de una  
solución querosénica conteniendo un 2 por ciento de DDT, un 0,4  
por ciento de lindano y un 0,4 por ciento de p-clorobenzolsulfón-  
-p-cloroanilida.

25. 10ª.- Mejoras según la reivindicación 4ª, caracterizadas  
por el hecho de ser compuesta la preparación insecticida de una  
emulsión de cerca de una parte de un preparado conteniendo un 30  
por ciento emulgente en toluol, con cerca de tres partes de agua.

30. 11ª.- Mejoras según la reivindicación 6ª, caracterizadas  
por el hecho de ser compuesta la preparación insecticida de una  
emulsión de cerca de una parte de un preparado conteniendo un 30  
por ciento de DDT, un 15 por ciento de clorodano, un 5 por ciento  
de benzol-sulfón-p-cloroanilida y un 10 por ciento de emulgente en  
toluol, con cerca de tres partes de agua.



206031

12ª.- Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal, nº 203.051, por "Procedimiento para la preparación de insecticidas orgánicos de síntesis, activados".

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 29 de octubre de 1952.

p.a.

JAIMESERN