



C.G.

- 1 - 255524

Memoria Descriptiva

para

una patente de Invención
por veinte años en España

a -favor de

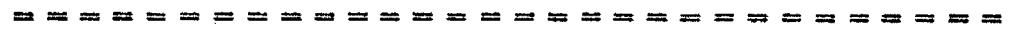
- 1) Dr. Jorge Esteban Biro
 - 2) D. Federico Fernández Pita
- ambos de nacionalidad argentina -

residente en

- 1) Buenos Aires (Argentina) 1763 Avenida Forest
- 2) Buenos Aires (Argentina) 1238 Calle Alsina

por:

• PROCEDIMIENTO PARA LA PRODUCCION DE UN INSECTICIDA •



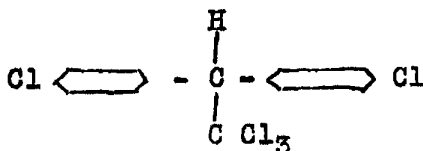


2.-

255524

El presente invento tiene por objeto un procedimiento para obtener un insecticida cuya eficacia alcance la de los insecticidas cuya molécula contiene fósforo o al menos seis átomos de cloro, siendo no obstante inocuo para el hombre y generalmente para los animales de sangre caliente, de modo que puede aplicarse y manipularse sin precauciones especiales.

El Dr. Pablo Mueller, en el año 1940, descubrió las excelentes propiedades insecticidas del compuesto 1,1-bis-(p-clorofenilo)-2,2,2-tricloro-etano, que bajo la denominación DDT alcanzaba una aplicación mundial. Sin embargo, ese compuesto era ineficaz contra numerosas plagas de la agricultura y ganadería, mientras que una gran parte de los insectos, los cuales inicialmente exterminaba, sucesivamente adquirieron una inmunidad progresiva. En consecuencia se iniciaron numerosos ensayos con el objeto de aumentar y ampliar la eficacia del DDT por varias alteraciones de la composición de la molécula del compuesto de la fórmula



El mismo Dr. Mueller ya consideró la posibilidad que en lugar de los radicales fenílicos podrían encontrarse cualesquier radicales alifáticos, aro-alifáticos, aromáticos o heterocíclicos, mas sólo los compuestos difenílicos



3.-

255524

alcanzaban aplicación práctica. Aún conservando los radicales
fenílicos, se hicieron numerosos ensayos para alcanzar el me-
joramiento del DDT modificando la estructura de su molécula,
mas si le extrajeron una molécula de ácido clorhídrico o eli-
5 minaron el cloro del uno o de ambos radicales fenílicos, o
sustituyeron el único átomo de hidrógeno del etano con cloro,
o intrujeron un radical NO_2 en ambos radicales cloro-feníli-
cos, la acción insecticida desapareció prácticamente y se con-
servó sólo, si uno de los átomos cloro se transfirió del car-
10 bono 2 al carbono 1 del etano. Se ensayó también la nitración
posterior de la molécula del DDT, más sólo se pudo alcanzar
que la precipitación de cristales de la emulsión acuosa se
retardase, sin que la acción insecticida del DDT se hubiere
mejorado.

15 En todos los ensayos para mejorar el DDT,
su radical etil se conservaba, pero de este modo no se pudo
obtener éxito. Pues empezaron otro camino. Así pudieron obte-
ner productos con eficacia superior al DDT mediante compues-
tos cuya molécula contiene fósforo o al menos seis átomos de
20 cloro, pero la acción tóxica contra el hombre y el ganado au-
mentó en un grado, que a pesar de la prescripción de las más
rigurosas precauciones, se produjeron envenenamientos morta-
les en masa entre las personas que los manipulaban, de modo
que los dichos productos no se pueden emplear en hogares y
25 corrales.

Contrariamente a los ensayos anteriores,
según el presente invento se alcanzó la eficacia insecticida

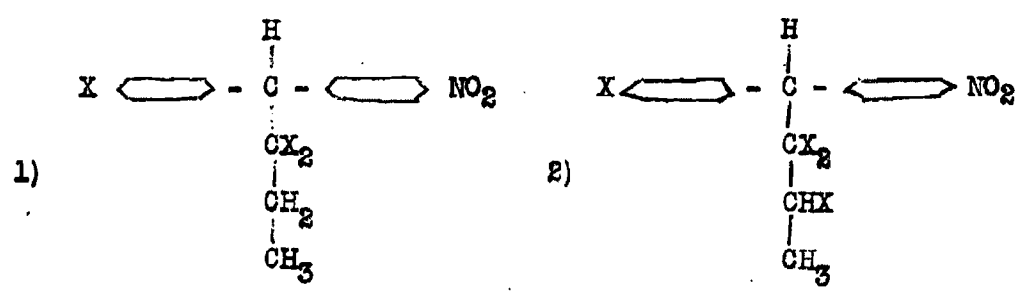


4.-

23352

de los productos de alta toxicidad y evitar al mismo tiempo su toxicidad para el hombre y los animales de sangre caliente, manteniendo el tipo básico de la molécula del DDT, pero sustituyendo el radical etílico por el radical butílico halogenado y sustituyendo el átomo cloro del uno de los radicales fenílicos por el radical NO₂.

El nuevo compuesto constituye pues la base activa del insecticida según el invento que tiene la fórmula 1-halofenil-1-nitrofenil-2-dihalo-butano, o preferentemente un átomo de halógeno más, en el carbono 3 del butano. Las fórmulas correspondientes son:



En las fórmulas la X significa un halógeno, preferentemente cloro, en cuanto que la eficacia insecticida del bromo y del yodo es menor que la del cloro, mientras que la toxicidad del fluoro para el hombre y los animales de sangre caliente supera la del cloro.

En el caso de que X es cloro, los compuestos arriba mencionados se producen por la condensación de un mol de butilcloral o butilcloralhidrato con un mol de clorobenzol y un mol de nitrobenzol mediante un deshidrante, p.e. ácido sulfúrico concentrado. Se libera un mol de agua formado



5.-

255524

por el oxígeno del cloral y por los hidrógenos del clorobenzol y del nitrobenzol. Empleando butilcloralhidrato se libera un mol más de agua.

5 Suponiendo materias primas completamente puras, el compuesto según la fórmula 3) es un líquido transparente sin color de densidad 1.215 y con punto de ebullición casi 167°, insoluble en agua, pero fácilmente soluble en benceno. Mezclado con un detergente forma emulsiones estables con agua.

10 Por supuesto se podrían emplear en lugar de los compuestos de cloro arriba mencionados los compuestos correspondientes de los otros halógenos.

15 En lugar del butilaldehído se podría emplear un derivado del mismo, en el cual el oxígeno del radical carbonil está sustituido por radicales de hidróxilo o de alcohol, por ejemplo C_4H_9O- , como dibutilacetal al menos dihalogenado en su radical butil. Los radicales hidroxilo y alcohol se alejan por la condensación con ácido sulfúrico.

20 Por supuesto, terminada la condensación con ácido sulfúrico, este ácido se eliminará en manera conocida por lavado con agua, mientras el residuo del ácido puede neutralizarse con alcalis, o carbonato, por ejemplo, de calcio o de bario.

25 La acción insecticida de los compuestos arriba mencionados se puede aumentar sustancialmente y se reduciría la posibilidad hasta cero de que los insectos consiguieran sucesivamente una resistencia por agregado de uno o



6.-

255524

varios de los compuestos del grupo bencilo, dioxano, difenilmetano y xantona, en cantidades de una fracción del compuesto básico, p.e. de 10%.

EJEMPLO I

5 Una molécula de clorobenceno y una molécula de nitrobenzeno se condensan con una molécula de butilcloral o de cloralhidrato de butilo agitando enérgicamente la mezcla con un exceso de una sustancia absorbente del agua, por ejemplo ácido sulfúrico concentrado (de 98% de pureza). Durante
10 la condensación un átomo de oxígeno del radical del butilaldehído y un átomo de hidrógeno de cada uno de los radicales de benzeno forman una molécula de agua. En esta reacción exotérmica se continúa la agitación y refrigeración hasta que la masa de reacción se haya enfriado por bajo de la temperatura ambiente.
15

EJEMPLO 2

112,5 partes de clorobenceno, 122 partes de nitrobenzeno y 257 partes de dicloro-dibutil-acetal se mezclan íntimamente con 200 partes de ácido sulfúrico al 98%. La mezcla se enfría a 5°C y luego se introduce poco a poco, siempre agitando, dentro de 3500 partes de agua a 5°C, enfriando la mezcla, teniendo cuidado de que su temperatura se mantenga entre 30° y 40°C. Después de reposar la mezcla durante media hora próximamente, el líquido se separará en dos capas. La superior está constituida por ácido sulfúrico diluido y algo de alcohol butílico, mientras que la inferior está constituida esen
20
25



7.-

255524

cialmente por la sustancia activa del insecticida. Se separa cuidadosamente la capa superior en cuanto sea posible, en tanto que la capa inferior se lava con agua pura.

Se repite este procedimiento lavador hasta que el líquido resulte aproximadamente neutro. Las trazas de ácido remanente se neutralizan con carbonato bórico.

Se prepara otra mezcla con 35 partes de xantona, 65 partes de benceno y 456 partes de un emulgente, por ejemplo el producto conocido con el nombre de "Tween 20", fabricado por la Atlas Powder Company of Wilmington 99, Delaware, U.S.A.

Esta mezcla se mezcla con el producto de reacción neutralizado y a continuación se agrega la cantidad de agua necesaria para que el contenido de agua de la mezcla total sea de unas 1000 partes, dando por resultado una emulsión que contiene aproximadamente 40% de sustancia activa.

El insecticida se puede aplicar en forma de emulsión acuosa por pulverización o mezclado con minerales, p.e. caolina o talco, en polvo, dispersándolo.

El insecticida obtenido según el invento, es eficaz contra toda clase de parásitos de sangre fría, como moscas, mosquitos, gusanos de toda clase, coleópteros, hormigas, comejenes, caracoles y sus estados de evolución.

- - -



8.-

255524

N O T A.-
=====

255524

La presente patente de Invención comprende las siguientes reivindicaciones:

5 1.- Procedimiento para la producción de un insecticida, caracterizado por el hecho de que se condensa una mezcla de monohalobenzol, mononitrobenzol y butilaldehído al menos dihalogenado.

10 2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de que la condensación se produce con un butilaldehído trihalogenado.

3.- Procedimiento según la reivindicación 2, caracterizado por el hecho de que se condensa una mezcla de clorobenzol, nitrobenzol y butilcloral en proporciones moleculares mediante una sustancia deshidratante.

15 4.- Procedimiento según la reivindicación 2, caracterizado por el hecho de que se condensa una mezcla de clorobenzol, nitrobenzol y butilcloralhidrato en proporciones moleculares mediante una sustancia deshidratante.

20 5.- Procedimiento según cualesquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado por el hecho de que en lugar del butilaldehído halogenado se emplea un hidrato del butilaldehído al menos dihalogenado.

25 6.- Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado por el hecho de que se emplea un butilacetalo al menos dihalogenado.

7.- Procedimiento según cualquiera de las rei-



9.-

255524

vindicaciones precedentes, caracterizado por el hecho de que la condensación se produce de manera conocida con ácido sulfúrico concentrado y, terminada la condensación, el ácido se elimina.

5

8.- Procedimiento para la producción de un insecticida.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva.

10

Consta esta memoria de nueve hojas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 3 de Febrero de 1960.

GUILLEMO ROLL
SA