

MONTECATINI-T.318



287531

P A T E N T E
D E
I N V E N C I Ó N

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE UNA COMPOSICIÓN INSECTICIDA O LARVICIDA PARA USAR CONTRA LOS MOSQUITOS", a favor de la firma italiana MONTECATINI, Società Generale per l'Industrie Mineraria e Chimica, domiciliada en MILANO (Italia), Largo G. Donegani 1-2.

MEMORIA DESCRIPTIVA

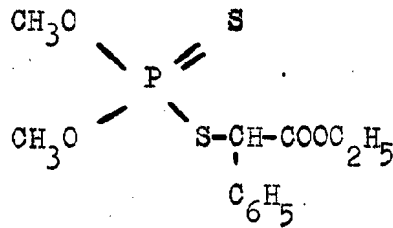
En la memoria de la patente británica Nº 834 814 se ha descrito la acción insecticida de los ésteres alquílicos de los ácidos O,O-dialkilditiofosforilfenilacéticos.

Este invento se refiere a la aplicación específica para destruir larvas de mosquitos de un compuesto incluido dentro de la clase general de compuestos reivindicada en la patente británica citada, a saber, el éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético, de la fórmula:

287531⁹ ABR



5.



10.

Por este invento se proporciona una composición insecticida o larvicida para usar contra los mosquitos, que comprende una solución del éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético.

15.

Se sabe que, para que sea eficaz, la lucha contra los mosquitos debe efectuarse sobre todo contra las larvas. En efecto, destruyendo los mosquitos adultos únicamente puede disminuirse, pero nunca eliminarse, el perjuicio para los seres humanos y los animales, puesto que, evidentemente, solo se extermina al insecto después que ya ha picado. En tiempos pasados se usaban para destruir las larvas aceites minerales que contenían compuestos aromáticos insaturados y fenólicos, los cuales se rociaban sobre la superficie de las aguas infestadas, o productos arsenicales o cuproarsenicales. Se realizó un progreso importante con el uso del DDT, que es activo tanto contra las larvas como contra los mosquitos adultos; pero la eficacia de esa sustancia, y de otras sustancias semejantes empleadas para este fin, disminuye continuamente en el tiempo, a causa de la "resistencia" que desarrollan los insectos.

20.

25.

287531²⁹



Ahora hemos descubierto sorprendentemente que el éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético tiene actividad descollante tanto contra las larvas como contra los insectos adultos que se han vuelto resistentes a la acción del DDT y otros compuestos larvicidas empleados hasta aquí.

La notable actividad larvicida de dicho compuesto se asocia con una destacada actividad contra los adultos, de modo que el éster etílico de ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético constituye un agente completo contra los mosquitos, tanto cuando se le usa solo como cuando se le usa asociado con otros insecticidas.

Los valores indicativos de la actividad contra los insectos adultos figuran en la Tabla 1. Estos valores se obtuvieron mediante pruebas efectuadas con adultos de Culex pipiens, según el método de Busvine (Bull. Entom. Res., 44, 371, 1953) ligeramente modificado; el método particular que se empleó es el siguiente:

En vasos trancocónicos, hechos de papel parafinado y cuyas paredes laterales estaban forradas con rectángulos de papel Whatman para cromatografía, previamente tratados con soluciones acetónicas de las sustancias activas en ensayo (cantidades determinadas por unidades de superficie), se introdujeron adultos de Culex Pipiens, criados en el laboratorio en condiciones estandarizadas.

La lectura de la mortalidad se efectuó al cabo de 16 horas de iniciado el contacto.

Para cada producto se ensayaron varias dosis en la proporción de 1:2, para tener una escala de las mortalidades con la que fuera posible trazar la línea de acción y deducir



287531

luego las correspondientes dosis letales 50 (DL 50) y 95 (DL 95).

T A B L A I

5. DL 50 y DL 95 en mg/m² obtenidas por evaluaciones comparativas sobre adultos de Culex pipiens

	Producto	DL 50 (mg/m ²)	DL 95 (mg/m ²)
10.	Ester etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético	0,4	1,5
15.	Lindano	0,12	1,6
	Monometilamida del ácido O,O-dimetilditiofosforilacético	10	30
20.	DDT	10	1200
	Malation	1,2	5
25.	Aldrina	1,2	17



287531

La actividad sobre las larvas de mosquito se determinó sobre el Culex pipiens de la manera siguiente:

5. En vasos de papel parafinado que contenían 100 cc de la dispersión acuosa de los productos en ensayo, apropiadamente formulados, se introdujeron larvas de Culex pipiens de tres días de edad, criadas en el laboratorio.

10. De la línea de acción obtenida a base de las mortalidades halladas al cabo de 20 horas, se establecieron la DL 50 y la DL 95, que permiten la comparación de los diversos productos larvicidas.

T A B L A II

DL 50 y DL 95 en partes por millón, obtenidas en evaluaciones comparativas sobre larvas de Culex pipiens

15.

Producto	DL 50 p.p.m./s.a.	DL 95 p.p.m./s.a.
20. Ester etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforil-fenilacético	0,0015	0,006
Lindano	0,15	1
DDT	0,075	0,5
25. Melation	0,03	0,15
Aldrina	0,02	0,5

30.



29 ABR

287531

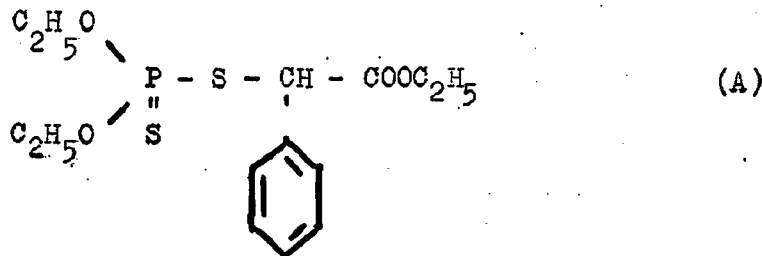
De los datos antes expuestos resulta claro que

5. el éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético es, respecto a la DL 50, cincuenta veces más activo que el DDT, cien veces más activo que el Lindano, trece veces más activo que la Aldrina y veinte veces más activo que el Malation; y respecto a la DL 95, cien veces más activo que el DDT, ciento sesenta y seis veces más activo que el Lindano, cien veces más activo que la Aldrina y veinticinco veces más activo que el Malation. También se

10. ha comprobado que ninguno de los productos mencionados manifiesta una relación entre su actividad contra los adultos y su actividad contra las larvas tan favorable como la del éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético.

15. La peticionaria ha observado también, sorprendentemente, que la actividad del éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético es muy superior a la de otros compuestos más análogos que los ya mencionados; así, por ejemplo, dicho compuesto muestra contra el Culex pipiens una DL 50 que es 11,6 veces mayor que la

20. del compuesto de la fórmula



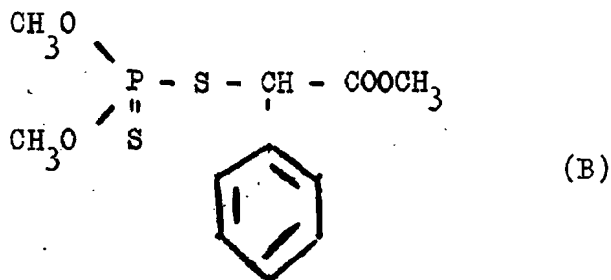
25.



287531

7,5 veces mayor que la del compuesto de la fórmula

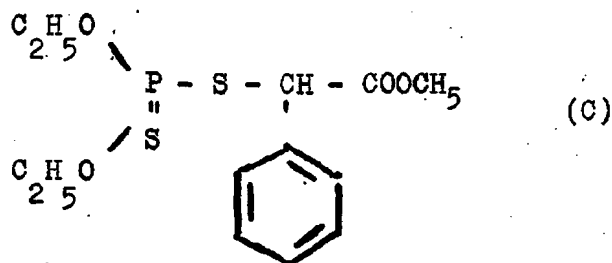
5.



10.

y 18,13 veces mayor que la del compuesto

15.



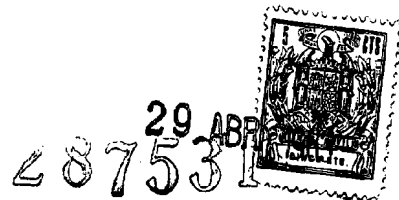
20.

25.

Comparando ahora la DL 95 de dichos compuestos, hemos comprobado que el compuesto a que se refiere esta solicitud es 8 veces más activo que el compuesto (A), 4 veces más activo que el compuesto (B) y 12 veces más activo que el compuesto (C).

30.

La composición de este invento puede usarse sin dificultad para exterminar las larvas y los adultos de los mosquitos en las aguas estancadas disolviéndola, por



- ejemplo, en mezclas de petróleo y aceites minerales como las que se usan generalmente para rociar sobre la superficie de las aguas o inyectándola directamente en las aguas infestadas en forma de una composición que se disperse fácilmente en el agua, y con este fin la composición del invento contiene un agente dispersante, por ejemplo dodecilen-sulfonato cálcico. Por su notable acción contra los adultos, las mismas composiciones que contienen el éster mencionado antes y que se usan contra las larvas, pueden usarse para exterminar, por aspersion, los mosquitos en las cercanías de las aguas estancadas.
- 5.
- 10.

La composición es apta también para el uso práctico a causa de su escasa toxicidad para los animales de sangre caliente; así, la DL 50, medida en ratones blancos, es igual a 450 mg/kg.

15.

Para mejor ilustrar el invento, se expone a continuación un ejemplo detallado de la actividad de una formulación constituida por aceites minerales y petróleo y que contiene el éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforil-fenilacético, así como un ejemplo del modo de preparación de una formulación.

20.

EJEMPLO 1.

En frascos de vidrio cilíndricos (19 cm de diámetro; altura utilizable, 35 cm) que contenían 10 litros de agua, se introdujeron larvas de Culex pipiens de tres días de edad, criadas en el laboratorio. Por medio de una microjeringa se distribuyeron por la superficie del agua cantidades determinadas de compuesto larvicida por unidad de superficie.

25.



29

287531

Al cabo de 20 horas se determinó la mortalidad de las larvas. Esta mortalidad figura en la Tabla 3.

T A B L A 3.

5. Porcentaje de mortalidad de las larvas de Culex pipiens por tratamiento con formulaciones del éster etílico del ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético.

10.	Producto	l/ha T.q.	Altura del agua en cm.	p.p.m. de éster etílico del á- cido O,O-dime- tilditiofosfo- rilfenilacético en agua	Mortali- dad al cabo de 20 horas
15.	Aceite mineral	12	35	-	0
		6	35	-	0
		3	35	-	0
20.	Aceite mineral junto con 1% de éster etí- lico del ácido O,O- -dimetilditiofosfo- rilfenilacético	6	35	0,016	100
		3	35	0,008	96
		1,5	35	0,004	78
25.	Aceite mineral y 2% de DDT	12	35	-	0
		6	35	-	0
		3	35	-	0
25.	Aceite mineral más 1% de éster etílico del ácido O,O-dime- tilditiofosforilacé- tico y 2% de DDT	6	35	0,016	100
		3	35	0,008	98
		1,5	35	0,004	81

29 AB



EJEMPLO 2.

287531

A temperatura ambiente, se añadieron agitando
0,5 partes en peso de un agente tensioactivo (un producto
de condensación de óxido de etileno con un alquilfenol) y
5. 1 parte en peso de éster etílico del ácido O,O-dimetilditi-
tiofosforilfenilacético a una mezcla constituida por 45 par-
tes en peso de petróleo y 53,5 partes en peso de aceite
Diesel con p.i. TAG igual a 60º, $d_{20^{\circ}\text{C}} = 0,8792$.

10. Se obtuvo una formulación líquida homogénea,
apta para usar en la exterminación de las larvas de mosqui-
to por aspersión sobre las aguas estagnantes infestadas.

EJEMPLO 3.

15. Se obtuvo una composición según el invento, facil-
mente dispersable en agua, mezclando a temperatura ambien-
te (el orden de introducción no es crítico) 50 partes de
éster etílico de ácido O,O-dimetilditiofosforilfenilacético,
30 partes de xileno, 10 partes de dodecibencen-sulfonato
cálcico y 10 partes del producto de condensación de óxido
20. de etileno con un alquilfenol y con alcoholes alifáticos
de cadena larga (las partes se entienden partes en peso) y
sometiendo la mezcla obtenida a sacudimiento mecánico hasya
la solubilización de los componentes.

Esta composición se empleó con éxito para combatir
y exterminar las larvas de mosquito directamente en las
aguas infestadas.

29 ABR



NOTA

287531

Descrito el objeto de la invención, se declara nuevas las siguientes reivindicaciones, con prioridad italiana nº 8593/62 del 30 de abril de 1962:

5. 1. Procedimiento para la preparación de una composición insecticida o larvicida para usar contra los mosquitos, caracterizado por el hecho de someter en solución al éster etílico del ácido 0,0-dimetilditiofosforilfenilacético.
10. 2. Procedimiento según se ha definido en la reivindicación 1, caracterizado por ser el disolvente petróleo, o un aceite mineral, o una mezcla de ellos.
15. 3. Procedimiento según se ha definido en las reivindicaciones 1 o 2, caracterizado por el hecho de contener la composición el producto de la condensación de óxido de etileno con un alcohol alifático de cadena larga, dodecibencen-sulfonato cálcico o una mezcla de dos o más de estas sustancias.
20. 4. Procedimiento para la preparación de una composición insecticida o larvicida para usar contra los mosquitos.

Según se describe y reivindica en la presente memoria que consta de 11 hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 29 ABR. 1963

p.a.

JAIIME ISERN MIRALLES

P.P.