

374154

P - 43.353  
Nº 57431/68 AJA.



**Memoria descriptiva**

SECCION TECNICA	
CLASIFICACION I. P. C.	
CLASE <u>A-01</u>	_____
SUBCLASE <u>N</u>	_____

para solicitar PATENTE DE INVENCION por 20 años

a nombre de FISONS LIMITED

entidad / ~~de nacionalidad~~ británica

con domicilio en Harvest House, Felixstowe, Suffolk,  
Inglaterra.

por: "UN PROCEDIMIENTO DE PREPARAR UNA COMPOSICION  
PARA COMBATIR ROEDORES INDESEABLES"  
(Clase Internacional AOIn CO7a)



La presente invención se refiere a un procedimiento mejorado y una composición para la destrucción de roedores, en particular ratas y ratones y plagas parecidas.

5 Las serias depredaciones resultantes de la infestación de las ratas son bien conocidas; aparte del consumo de hecho y del desperdicio de alimentos en almacenes y en el campo, las ratas representan un serio peligro para la salud debido a las enfermedades de que son portadoras. La destrucción de las ratas es en consecuencia un serio requerimiento de salud pública y cualquier procedimiento para la destrucción de ratas, ratones y otros roedores da como resultado una mejoría de las instalaciones de almacenamiento y las regiones agrícolas, librándolas de la infestación de las ratas.

15 Existen muchos compuestos que son tóxicos para las ratas y los ratones; el problema que ha tenido que ser superado es proveer un compuesto tóxico que sea consumido por el roedor. Así pues, los roedorticidas normalmente se formulan como un cebo alimenticio. Hay muchas sustancias tóxicas repelentes para los roedores, de manera que en circunstancias normales el roedor no tiene inclinación a consumir el cebo envenenado. La sustancia tóxica en consecuencia, además de ser tóxica para el roedor, debe también ser aceptable por el sabor y el olor, o cuando menos no repelente, para el roedor, de manera que el cebo envenenado sea consumido por el roedor.

20 Hemos descubierto ahora que los trifluorometilbencimidazoles substituídos a que se hace referencia más adelante además de ser altamente tóxicas para los roedores, en particular las ratas y los ratones, tienen también buen

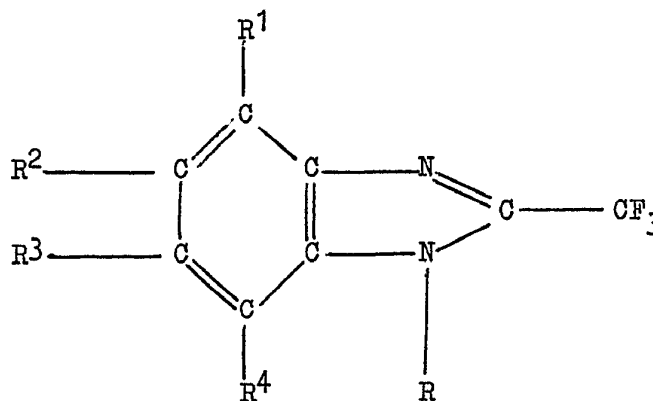


sabor al paladar para los roedores.

En consecuencia, la presente invención se refiere a una composición roedorticida que contiene una cantidad efectivamente tóxica por los roedores de un bencimidazol sustituido de la fórmula

5

10



15

en donde R es hidrógeno o un grupo alquilo (por ejemplo de 1 a 12 átomos de carbono, como metilo, etilo, propilo, butilo, decilo o dodecilo), y en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son iguales o diferentes y se eligen de hidrógeno, halógeno, (por ejemplo cloro, bromo, fluor o yodo) y pseudohalógeno (por ejemplo ciano), siendo no más de tres de los grupos R<sup>1</sup>-R<sup>4</sup> hidrógeno, o sales o derivados funcionales del mismo, en un vehículo sólido o líquido que puede ser consumido por el roedor. Convenientemente no más de uno de los grupos R<sup>1</sup> a R<sup>4</sup> será de hidrógeno. De acuerdo con una modalidad preferida de la invención R será un grupo alquilo de 1 a 3 átomos de carbono.

20

25

Los compuestos en los que R es hidrógeno forman sales como por ejemplo sales metálicas y de amina. Estas pueden usarse en la forma de sales solubles en agua como las sales de metal alcalino, pero usualmente se prefiere

30

3.12.69

- 3 - 374 154



usarlas como sales insolubles, como por ejemplo sales de bario o de calcio.

5 La presente invención se refiere también a un procedimiento para liberar en particular ratas y ratones de edificios o zonas de roedores, que comprende introducir a los edificios o zonas una composición roedortícida como la arriba identificada.

10 La actividad de los bencimidazoles substituídos aumenta al disminuir el tamaño de partícula. Así pues, de acuerdo con una modalidad preferida de la invención el bencimidazol substituído es micronizado, por ejemplo con azúcar, caolín o talco, y el polvo micronizado resultante se usa en las composiciones roedortícidas. De acuerdo con una modalidad de la invención, el bencimidazol substituído será de un tamaño de partícula de aproximadamente 15 una a 20 micras y de preferencia de aproximadamente 5 a 10 micras. Usualmente es necesario moler o micronizar el bencimidazol substituído mezclado con un diluyente sólido (por ejemplo que comprenda de 10 a 20% por peso del bencimidazol substituído). Esto se debe a que el calor de la 20 molienda puede causar la fusión del bencimidazol substituído cuando se microniza solo.

25 La composición roedortícida adecuadamente tendrá la forma de una composición agradable al paladar que contenga el bencimidazol substituído. La composición roedortícida contendrá adecuadamente de 0,025 a 5% y de preferencia de 0,1 a 2%, por peso, del bencimidazol substituído.

30 La composición roedortícida contendrá adecuadamente un "cebo" para el roedor en la forma de una sustancia sólida comestible para el roedor; esas sustancias in



cluyen harina de avena, cereales, productos de cereales, azúcar, melaza, pan de aceite, harina de lucerna, hongos secos, legumbres, productos vegetales, salvado, bizcochos y similares. Además, la composición puede contener también vehículos inertes como talco, yeso y similares. En esos casos, la composición se formulará adecuadamente como píldoras o gránulos, que pueden esparcirse en los edificios u otras zonas infestadas por las ratas.

El roedor normalmente se alimentará varias veces de la composición roedortícida y el efecto del veneno de bencimidazol sustituido es acumulativo. Debido a la baja concentración del bencimidazol sustituido en esas composiciones, estas no son peligrosas para los niños o los animales domésticos.

Si bien se prefiere usar el bencimidazol sustituido en la forma de una composición agradable al paladar, puede también presentarse como composición líquida, por ejemplo como jarabe, se puede introducir en el agua de beber usada por las ratas; esas composiciones líquidas, si se desea, pueden incluir un agente humectante.

Otros tipos de composición incluyen los "polvos para piso" que comprenden un polvo finamente dividido por ejemplo de talco, que contiene el bencimidazol sustituido. El polvo para piso se espolvorea en el piso sobre el cual caminan los roedores y los roedores consumen la composición cuando se asean. Esas composiciones adecuadamente contienen de 0,1 a 5% por peso del bencimidazol sustituido. Estas composiciones pueden contener también un agente de actividad de superficie para evitar la aglomeración de polvo y pueden contener también colorantes, para



hacer el polvo menos conspicuo en los pisos.

El bencimidazol substituído de la fórmula indicada arriba en donde R es hidrógeno es sumamente tóxica para los roedores; sin embargo los compuesto en los que R es alquilo, si bien son menos tóxicos son más agradables al paladar, de manera que los roedores consumen rápidamente una dosis tóxica. Además, la lentitud de establecimiento de los síntomas tóxicos asegura que los roedores consuman una dosis tóxica antes de que los efectos secundarios reduzcan su deseo de alimento. El sabor agradable es mejorado todavía más usando sales insolubles y/o presentando el bencimidazol en forma de cápsulas o de microencapsulados, por ejemplo, en gelatina. Los compuestos preferidos que pueden mencionarse incluyen los siguientes:

4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol, 1-metil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol, 1-normalpropil-4,7-dibromo-5,6-dicloro-2-trifluorometil bencimidazol, 1-normalpropil-6-bromo-4,5,7-tricloro-2-trifluorometil bencimidazol, 1-normalpropil-4,6-dibromo-5,7-dicloro-2-trifluorometil bencimidazol, 1-metil-4-bromo-5,6,7-tricloro-2-trifluorometil bencimidazol y 1-metil-5-ciano-4,6,7-tricloro-2-trifluorometil bencimidazol.

El compuesto especialmente preferido, particularmente como veneno para los ratones, es la 1-normalpropil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol. Otro compuesto especialmente preferido, en particular como veneno para las ratas es la 1-metil-4-bromo-5,6,7-tricloro-2-trifluorometil bencimidazol.

Si se desea, la composición roedorticida de acuerdo con la presente invención puede contener además



del bencimidazol substituido otro roedorticida como por ejemplo un roedorticida del tipo anticoagulante, como por ejemplo warrarina u otros tipos de roedorticidas, por ejemplo norbomida o alfacloralosa.

5 Los ejemplos siguientes se dan para ilustrar la presente invención:

Ejemplo 1

Se prepararon píldoras de harina de avena que contenían 1% por peso de 4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol. Estas píldoras se alimentaron a ratas en ausencia de otro alimento. A continuación se indica la mortalidad de acuerdo con el período de horas:

	<u>Horas de exposición al cebo</u>	<u>Porcentaje de mortalidad de las ratas.</u>
	1	0
15	24	30
	48	50
	78	100

Ejemplo 2

20 Se prepararon píldoras de harina de avena que contenían 2% por peso del bencimidazol substituido abajo indicado. Estas píldoras se pusieron al alcance de las ratas junto con proporciones iguales de alimento no adulterado. La mortalidad de las ratas, dentro del período de horas, se ilustra a continuación:

25

374154



Compuesto	% de mortalidad de las ratas. Horas de exposición al cebo.				
	1	24	48	72	96
1-metil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol	0	0	90	100	100
1-n-propil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol.	0	20	100	100	100

Ejemplo 3

Se prepararon píldoras de harina de avena que contenían 0,5%, 0,25% y 0,0125% por peso (ilustrado en la columna que tiene el encabezado "% a.i." en la tabla que sigue) de 4-bromo-1-metil-5,6,7-tricloro-2-trifluorometil bencimidazol. Estas píldoras se pusieron al alcance de las ratas junto con proporciones iguales de alimento no adulterado, continuamente, durante diez días. Las ratas se enjaularon individualmente y cada día se registró la mortalidad de las ratas y se pesó y volvió a completar el alimento no tratado y el tratado. Se usaron diez ratas para cada escala de dosificación. Los resultados se resumen en la tabla que sigue. El total de alimento tratado comido (en gramos) se ha dado en la columna A que se encuentra abajo, y el total de alimento de alternativa comido (en gramos) se indica en la columna B que se encuentra abajo.

% a.i.	Mortalidad acumulativa en porcentaje de ratas. días de alimentación										A	B
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10		
0,5	10	80	100	100	100	100	100	100	100	100	65	81
0,25	0	20	60	90	90	90	90	90	90	100	86	105
0,125	0	0	0	40	60	100	100	100	100	100	111	123

**374 154**



Ejemplo 4

Se prepararon píldoras de harina de avena que  
contenían los compuestos de bencimidazol registrados en  
la primera columna de la tabla que se encuentra abajo a  
5 las escalas, en el porcentaje por peso indicado en la se-  
gunda columna (con el encabezado "% a.i."). Las píldoras  
se pusieron al alcance de los ratones junto con cantidades  
iguales de alimento no tratado, continuamente, durante 14  
días. Cada día, las píldoras tratadas y las no tratadas  
10 se pesaron y se completaron y se registró la mortalidad  
de los ratones. Se usaron 16 ratones para cada escala de  
dosificación, enjaulados en grupos de cuatro. Los resul-  
tados se resumen en la tabla que sigue.

15 Compuesto I = 1-<sub>n</sub>propil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluoro-  
metil bencimidazol.

Compuesto II = 1-<sub>n</sub>propil-4,7-dibromo-5,6-dicloro-2-tri-  
fluoro-metil-bencimidazol.

Compuesto III= 1-<sub>n</sub>propil-6-bromo-4,5,7-tricloro-2-trifluo-  
ro-2-metil-bencimidazol.

20 Compuesto IV= 1-<sub>n</sub>propil-4,6-dibromo-5,7-dicloro-2-trifluo-  
ro-metil-bencimidazol.

Compuesto V= 1-metil-4-bromo-5,6,7-tricloro-2-trifluoro-  
metil-bencimidazol.

Columna A.= Total de alimento tratado comido en gramos.

25 Columna B= Total de alimento de alternativa comido en  
gramos.

374154

374154



Compuesto	% a.i.	Mortalidad de los ratones														acumulativa en porcentaje.	
		días de alimentación														A	B
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	14	A	B			
I	0,25	0	0	75	87	94	100	100	100	100	100	100	100	83	80		
	0,125	0	0	12	50	81	94	94	94	94	94	94	100	111	127		
	0,062	0	0	0	0	12	12	56	81	81	81	81	87	198	231		
II	0,125	0	0	50	81	87	87	87	100	100	100	100	102	112			
	0,062	0	12	12	31	31	38	38	38	38	38	50	124	156			
III	0,125	0	19	63	94	94	94	94	94	94	100	100	91	85			
	0,062	0	12	44	81	87	94	94	94	94	94	94	149	74			
IV	0,125	0	12	56	87	87	94	94	94	94	94	94	114	103			
	0,062	0	0	25	50	75	75	75	75	75	75	75	170	91			
V	0,125	19	69	75	81	81	94	100	100	100	100	100	34	148			
	0,062	0	0	19	25	38	44	75	81	87	94	94	82	318			

374154

374154

Compuesto	% a.i.	Mortalidad de los ratones								acumula	
		días de alimentación								8	9
		1	2	3	4	5	6	7			
I	0,25	0	0	75	87	94	100	100	100	100	
	0,125	0	0	12	50	81	94	94	94	94	
	0,062	0	0	0	0	12	12	56	81	81	
II	0,125	0	0	50	81	87	87	87	100	100	
	0,062	0	12	12	31	31	38	38	38	38	
III	0,125	0	19	63	94	94	94	94	94	100	
	0,062	0	12	44	81	87	94	94	94	94	
IV	0,125	0	12	56	87	87	94	94	94	94	
	0,062	0	0	25	50	75	75	75	75	75	
V	0,125	19	69	75	81	81	94	100	100	100	
	0,062	0	0	19	25	38	44	75	81	87	

374154



es acumulativa en porcentaje.

entación

6	7	8	9	10	14	A	B
00	100	100	100	100	100	83	80
94	94	94	94	94	100	111	127
12	56	81	81	81	87	198	231
-----							
87	87	100	100	100	100	102	112
38	38	38	38	38	50	124	156
-----							
94	94	94	100	100	100	91	85
94	94	94	94	94	94	149	74
-----							
94	94	94	94	94	94	114	103
75	75	75	75	75	75	170	91
-----							
94	100	100	100	100	100	34	148
44	75	81	87	94	94	82	318
-----							

374154

Ejemplo 5

Se preparó un polvo para piso micronizando 20 partes de 1-normal propil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol y 80 partes de talco en un tamaño de partícula promedio de 5 micras y se diluyó éste con talco de un tamaño de partícula promedio de 5 micras para dar un polvo que contenía 1% de 1-normalpropil-4,5,6,7-tetracloro-2-trifluorometil bencimidazol.

Este polvo se espolvoreó sobre los lugares frecuentados por los ratones, al cabo de tres días todos los vestigios de ratones habían desaparecido.

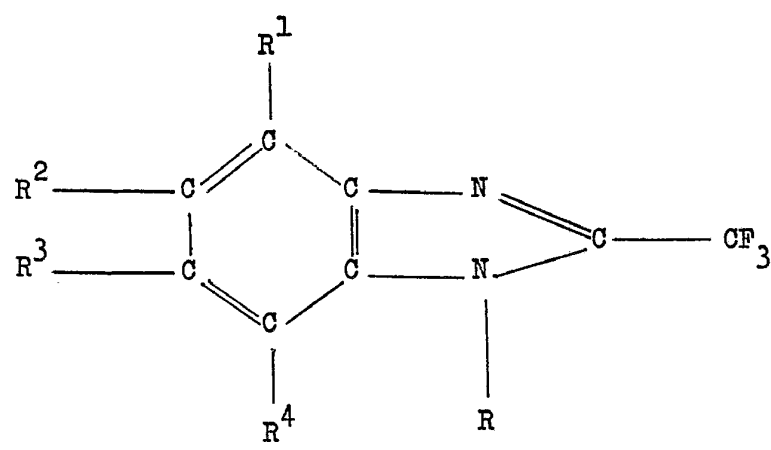
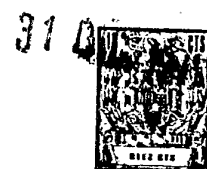
La presente solicitud que corresponde a la presentada en Gran Bretaña, con fecha 3 de Diciembre de 1968, bajo el número 57431/68, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

REIVINDICACIONES

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de la presente solicitud de Patente de Invención en España por VEINTE años, son los siguientes:

1.- Un procedimiento de preparar una composición para combatir roedores indeseables, cuyo procedimiento comprende incorporar un bencimidazol substituído de la fórmula:

**374154**



5

10 en donde R es un grupo alquilo, y en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> se eligen de entre: hidrógeno, halógeno y pseudohalógeno, con no más de tres de los grupos R<sup>1</sup>-R<sup>4</sup> siendo hidrógeno y sus derivados funcionales, en un vehículo sólido o líquido consumible por los roedores.

15 2.- Un procedimiento de preparar una composición para combatir roedores indeseables.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y para los fines que se han especificado.

20 Esta Memoria consta de doce hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 31 DIC. 1971  
P.A.

Alberio *Alberio*  
For Podes

374154