



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

238753

(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴

A 01 N 43/36

(22) Přihlášeno 22 09 83
(21) PV 6899-83

(40) Zveřejněno 15 05 85

(45) Vydáno 15 04 87

(75)
Autor vynálezu

MORAVEC JOSEF ing., TEPLICE, RUPEŠ VÁCLAV RNDr. CSc., PRAHA,
PRACHAŘ OTAKAR RNDr., LITOMĚŘICE, FIKER SOBĚSLAV RNDr. CSc.,
PRAHA

(54) Insekticidní prostředek pro hubení vši dětské a ektoparazitů
domácích zvířat

Vynález řeší zvýšení reziduálních účinků fixací účinných insekticidních látek pomocí makromolekulárních polymerů s vysokou substantivitou k vlasům a pokožce. Fixace účinných látek je dána jednak uvedenou substantivitou polyvinylpyrrolidonu nebo jeho kopolymerů nebo jeho derivátů k polypeptidům a jednak schopností těchto polymerů tvořit adukty s řadou organických sloučenin. Dalším přínosem použití těchto polymerů jsou jejich protetivní účinky.

Vynález se týká insekticidní vlasové vody s prodlouženým reziduálním účinkem pro použití v humánní a veterinární oblasti.

Starší, ne zcela bezpečné insekticidy, jako je DDT a gamma HCH, byly proti vši dětské aplikovány většinou ve formě 1% vodní emulze, kterou bylo nutné po značně dlouhé expoziční době (6 až 24 hodin) opět vymýt mýdlem nebo šamponem (u nás Nerakain).

Vysoce účinné a rychle působící pyrethroidy umožnily výrobu insekticidních šamponů, které jsou často formulovány jako spreje. Jejich použití je z hlediska hygienického a kosmetického nejméně nebezpečné. Předpokladem jejich plné a trvale úspěšného použití je vyšší úroveň hygieny a zamezení reinfestací.

Pro oba typy výše uvedených přípravků proti pedikulóze jsou charakteristická velmi krátká rezidua účinnosti, která většinou limitují k nule v důsledku následného vymytí a odplavení účinných látek dříve než dojde k jejich navázání na vlasy, respektive v důsledku jejich rychlé degradace v případě málo stabilních účinných látek (např. na světle se rozkládajících typů pyrethroidů).

Proti ektoparazitům domácích zvířat, kromě postřiku a koupelí používaných ve velko- a středních chovech, jsou používány rovněž šampóny a pyrethroidy bez reziduální účinnosti nebo polosuché spreje s organofosfáty.

Nyní bylo nalezeno, že nevýhody současného stavu, tj. krátké reziduální účinky, odstraňují prostředky pro hubení vši dětské a ektoparazitů domácích zvířat na bázi insekticidně účinných látek (pyrethroidů, organofosfátů a chlorovaných insekticidů), monoglykolů nebo polyglykolů, nižších alkoholů C_2 až C_4 , parfému a vody, obsahující podle vynálezu 0,1 až 5 % polymerů nebo kopolymerů nebo derivátů vinylpyrrolidonu o střední molekulové hmotnosti 10 000 až 1 000 000.

Výhodou přísad podle vynálezu je, že při použití makromolekulárních polymerů s vysokou afinitou k vlasům nebo srsti (tj. k polypeptidům) a dobrou rozpustností resp. schopností tvořit adukty s řadou organických sloučenin, dojde k výraznému prodloužení reziduálních účinků. Zvláště vhodné je proto použití polyvinylpyrrolidonu o střední molekulové hmotnosti 10 000 až 1 000 000 nebo kopolymerů polyvinylpyrrolidonu, např. kopolymerů vinylimidazoliummethochloridu a vinylpyrrolidonu. Substantivita k vlasům a pokožce dává v podstatě peptidickou vazbu pyrrolidonu umožňuje dlouhodobou fixaci těchto polymerů na vlasu či srsti a zároveň též fixaci insekticidně účinných látek a tím pod- míněnou prodloužení biologické účinnosti. Dalším přínosem použití polyvinylpyrrolidonu a jeho kopolymerů jsou jeho protektivní účinky, žádoucí zejména vzhledem k použití organických rozpouštědel a aplikaci na pokožku, zvláště u dětské populace. Jestliže jsou v takovéto formulaci použity bezpečné, účinné látky (zejména pyrethroidy), nedochází ke zvyšování toxikologického rizika.

P ř í k l a d 1

Vlasová voda obsahující 0,5 dílu permethrinu, 1 díl polyvinylpyrrolidonu PVP K 30, 20 dílů monopropylenglykolu, 78,5 dílů bezvodého ethylalkoholu byla naplněna do aerosolové nádoby a doplněna dichlordifluormethanem v poměru 7:3.

Přípravek byl aplikován rozprašovačem s prodlouženou tryskou do vlasů žáků zvláštní školy stříkem po dobu 0,5 až 1 s. na 8 až 10 místech účesu. Ihned po aplikaci byl přípravek rozetřen prsty po celém povrchu pokožky pokryté vlasy. Zároveň byla stejným způsobem u jiných probantů testována stejná formulace bez polyvinylpyrrolidonu.

Při použití formulace s polyvinylpyrrolidonem byl po 50 dnech po aplikaci zjištěn nový výskyt vši u necelých 10 % dětí. Při použití formulace bez polyvinylpyrrolidonu se vši začaly objevovat zřetelně dříve, po 10 dnech u 10 % dětí. Ve dvou případech byl zjištěn 10. den výskyt larev, což ukazuje na přežívání hnid.

Formulace	Počet ošetřených	% Napadených osob ve dnech po aplikaci					
		1	10	20	30	50	102
bez PVP	57	0	9,6	25,5	42	-	-
s PVP	104	0	0	1	-	9,4	22,7

Při sledování ovicidních účinků in vitro se při použití formulace s polyvinylpyrrolidonem značné procento hnid nevyklíhlo vůbec a žádná z larev nebyla schopna opustit úplně vaječné obaly. Při aplikaci formulace bez polyvinylpyrrolidonu uhynulo rovněž určité procento hnid, avšak 17 % larev vaječné obaly opustilo.

Příklad 2

Vlasová voda obsahující 2 díly trichlorfonu, 1 díl polyvinylpyrrolidonu, 20 dílů monopropylenglykolu, 77 dílů bezvodého ethylalkoholu byla naplněna do aerosolové nádoby a doplněna dichlor difluormethanem v poměru 7:3.

Přípravek byl aplikován stejně jako v příkladě 1 a zároveň byla stejným způsobem testována formulace bez polyvinylpyrrolidonu.

Při použití formulace s polyvinylpyrrolidonem bylo do 10 dnů po aplikaci znovu zavšíváno 20 % dětí, zatímco při aplikaci stejné formulace bez polyvinylpyrrolidonu bylo do 10 dnů znovu zavšíváno téměř 90 % dětí.

Formulace	Počet ošetřených	% Napadených osob ve dnech po aplikaci		
		1	10	20
bez PVP	8	0	87	100
s PVP	20	0	20	50

Příklad 3

Vlasová voda obsahující 0,5 dílů permethrinu, 1 díl kopolymeru vinylimidazoliummethochloridu a vinylpyrrolidonu, 6 dílů polyethylenglykolu 300, 67 dílů ethylalkoholu, 25 dílů vody a 0,5 dílu parfému byla testována in vitro ve srovnání se stejnou formulací bez výše uvedeného kopolymeru polyvinylpyrrolidonu. Zároveň byly testovány i obě formulace dle příkladu 1, s tím, že byly použity bez propelentu (dichlorodifluormetanu). Insekticidní účinnost byla zjištěna stanovením % mortality samic mouchy domácí, citlivého kmene SRS/WHO za 24 hodin po koupeli ve vodném roztoku uvedené koncentrace:

Koncentrace % přípravku	% Mortality			
	Příklad 1	Příklad 1	Příklad 3	Příklad 3
	bez PVP	s PVP	bez kop. PVP	s kop. PVP
0,000 1	100	100	100	100
0,000 01	93	100	100	100
0,000 001	86	100	100	100
0,000 000 1	6	27	47	86
0,000 000 01	6	6	33	80
0,000 000 001	0	0	0	6

Z porovnání účinků vzorků dle příkladu 1 a dle příkladu 3 na mouchu domácí vyplývá dobrá insekticidní účinnost přípravku dle příkladu 3 i proti vši hlavové. Z výše uvedených výsledků vyplývá rovněž pozitivní vliv polyvinylpyrrolidonu (resp. jeho kopolymerů) i na okamžitou insekticidní účinnost, daná v tomto případě lepší vazbou přípravku na povrchu těla hmyzu.

P ř í k l a d 4

Vlasová voda obsahující 1 díl molathionu, 0,5 dílu kvarterního derivátu PVP (poly-/3-pyrrolidonyl-1-(N,N,N-trimetyl)-1-propylenylamonium chlorid/), 5 dílů polyethylenglykolu 300, 0,5 dílu parfému, 93 dílů izopropylalkoholu byla naplněna do aerosolové nádoby a doplněna dichlordifluormetanem v poměru 7:3.

Přípravek byl aplikován stejně jako v příkladě 1 a zároveň byla opět stejným způsobem testována formulace bez derivátu PVP.

Při použití formulace bez derivátu PVP bylo 18 dnů po aplikaci zavraženo 27 % dětí, zatímco při aplikaci stejné formulace s derivátem PVP k zavražvení po 18 dnech nedošlo.

Formulace	Počet ošetřených	% Napadených osob po dnech aplikace		
		1	8	18
bez der. PVP	41	0	14	27
s der. PVP	45	0	0 x/	0

x/ ve třech případech vyčesány mrtvé vši

P ř í k l a d 5

Vlasová voda obsahující 1 díl methoxychloru, 1 díl polyvinylpyrrolidonu, 6 dílů polyethylenglykolu 300, 92 dílů izopropylalkoholu byla testována in vitro stejně jako v případě 3 a zároveň byla opět stejným způsobem testována formulace bez polyvinylpyrrolidonu. Procento mortality samic mouchy domácí za 24 hodin po koupeli ve vodním suspenzu přípravku bylo opět výrazně vyšší u formulace obsahující PVP:

Koncentrace % přípravku	% Mortality	
	s PVP	bez PVP
0,001	100	100
0,000 1	100	93
0,000 01	100	86
0,000 001	86	47
0,000 000 1	6	0
0,000 000 01	0	0

V příkladech 1 až 5 byly použity polymery s následující molakulovou hmotností:

Příklad 1	cca	40 000
Příklad 2	cca	40 000
Příklad 3	cca	150 000
Příklad 4	cca	1 000 000
Příklad 5	cca	10 000

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Insekticidní prostředek pro hubení vši dětské a ektoparazitů domácích zvířat na bázi insekticidně účinných látek ze skupiny pyrethroidů, organofosfátů, chlorovaných insekticidů, obsahující monoglykoly nebo polyglykoly, alkoholy C_2 až C_4 , parfém a vodu vyznačený tím, že obsahuje 0,1 až 5 % polymerů nebo kopolymerů nebo derivátů vinylpyrrolidonu o střední molekulové hmotnosti 10 000 až 1 000 000.