(19) **RU** (11) **2 101 005** (13) **C1**

(51) МПК[6] **A 61 K 7/40**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: **95107917/14, 16.05.1995**

(46) Дата публикации: **10.01.1998**

(56) Ссылки: **SU, авторское свидетельство, 1544431, кл. A 61 K 7/40, 1987.**

(71) Заявитель:
Акционерное общество открытого типа "Щелковское предприятие "Агрохим"

(72) Изобретатель: **Тарасова С.В., Хасаньянова Э.Ш., Наумов Ю.А., Маркина В.В., Юрченко В.В., Шашина Н.И., Рысина Т.З., Чернышев В.П.**

(73) Патентообладатель:
Акционерное общество открытого типа "Щелковское предприятие"

(54) СРЕДСТВО ДЛЯ ЗАЩИТЫ ОТ УКУСОВ КРОВОСОСУЩИХ ЧЛЕНИСТОНОГИХ

(57) Реферат:

Изобретение относится к средствам защиты от укусов кровососущих членистоногих, а именно, к инсектоакарорепеллентам, обладающим специфическим отпугивающим действием. Предлагается средство защиты от укусов кровососущих членистоногих, включающее смесь репеллентов, содержащих диметилфталат и масло базилика, смесь эмульгаторов, состоящую из триэтаноламина, стеариновой кислоты, аммиака водного 25%-ного и эмульгатора N 1 (сплавленной смеси, содержащей 70-73% высших жирных спиртов C_{16}-C_{21} и 27-30% натриевых солей сульфоэфиров этих же спиртов) и воду. В средство дополнительно вводят в качестве действующего вещества N-(α -гексилоксиметил)капролактам при массовом соотношении репеллентов N-(α -гексилоксиметил)капролактама, диметилфталата и масла базилика соответственно 0,9-1,1 : 0,9-1,1 : 0,02-0,03 и в качестве вспомогательной добавки поливиниловый спирт. 2 табл.

RU 2101005 C1

RU 2101005 C1

(19) **RU** (11) **2 101 005** (13) **C1**

(51) Int. Cl.[6] **A 61 K 7/40**

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: **95107917/14, 16.05.1995**

(46) Date of publication: **10.01.1998**

(71) Applicant:
Aktsionernoe obshchestvo otkrytogo tipa "Shchelkovskoe predprijatie "Agrokhim"

(72) Inventor: **Tarasova S.V., Khasan'janova Eh.Sh., Naumov Ju.A., Markina V.V., Jurchenko V.V., Shashina N.I., Rysina T.Z., Chernyshev V.P.**

(73) Proprietor:
Aktsionernoe obshchestvo otkrytogo tipa "Shchelkovskoe predprijatie"

(54) AGENT FOR PROTECTION FROM BLOOD-SUCKING ARTHROPOD BITE

(57) Abstract:

FIELD: insectoacarorepellents.

SUBSTANCE: agent has a mixture of repellents containing dimethylphthalate and basil essential oil, a mixture of emulgators consisting of triethanolamine, stearic acid, 25% an aqueous ammonia and emulgator N 1 (melted mixture containing 70-73% higher aliphatic C_{16}-C_{21}-alcohols and 27-30% sulfoester sodium salts of the same alcohols) and water. Agent has additionally N-(α-hexylhydroxymethyl)-caprolactam as an active component at the following mass ratio of repellents,

N-(α-hexylhydroxymethyl)-caprolactam, dimethylphthalate and basil essential oil = (0.9-1.1):(0.9-1.1):(0.02-0.03),

respectively, and polyvinyl alcohol is used as an auxiliary addition. EFFECT: enhanced effectiveness of agent. 2 tbl

RU 2101005 C1

RU 2101005 C1

Изобретение относится к средствам защиты от укусов кровососущих членистоногих, а именно к инсектоакарорепеллентам, обладающим специфическим отпугивающим действием.

Наиболее известными репеллентами в нашей стране и за рубежом являются диметилфталат и N, N-диэтил-м-толуамид (ДЭТА). Однако диметилфталат считается недостаточно эффективным репеллентом. По сравнению с ним ДЭТА гораздо более эффективен и до настоящего времени является международным эталоном репеллентов. Однако объем производства ДЭТА в России ограничен, что делает его дефицитным.

Современные средства защиты от укусов кровососущих насекомых представляют собой сложные композиции, включающие наряду с действующими веществами эмульгаторы и добавки, усиливающие действие репеллентов и улучшающие потребительские свойства.

Среди них известны композиции, включающие в качестве действующего вещества ДЭТА, ДЭТА и диметилфталат, ДЭТА, диметилфталат и третий репеллент. Однако, как уже было отмечено, данные средства включают дефицитный компонент ДЭТА, что затрудняет их выпуск.

Известны также средства защиты от укусов кровососущих насекомых, которые не содержат в своем составе ДЭТА. Например, известны средства, включающие в качестве действующего вещества репелленты диметилфталат и оксамат (смесь алифатических C_5-C_9 эфиров N, N-диэтилоксаминовой кислоты). Из них наиболее близким к заявляемому является средство Оксафтал, которое содержит в качестве действующего вещества репелленты диметилфталат, оксамат и головную фракцию масла эвгенольного базилика. Кроме действующих веществ средство включает смесь эмульгаторов, состоящую из триэтаноламина, стеариновой кислоты, аммиака водного 25%-ного и эмульгатора N 1 (сплавленной смеси, содержащей 70-73% высших жирных спиртов C_{16}-C_{21} и 27-30% натриевых солей сульфоэфиров этих же спиртов), вспомогательную добавку - глицерин и воду.

Недостатком указанных средств является их низкая эффективность. Одно из известных средств обеспечивает защиту от укусов комаров на протяжении 2,8 ч, другое соответственно до 3,8 ч.

Кроме того, установлено, что оксамат, входящий в средства, обладает кожнораздражающим действием, поэтому его содержание в средствах не может превышать 4-6% что сказывается на эффективности препаратов и на потребительских свойствах.

К недостаткам указанных препаратов можно также отнести ограниченный спектр их действия, так как они проявляют активность только к летающим кровососущим насекомым (т.е. являются инсектерепеллентами) и не проявляют активности по отношению к клещам (не являются акарорепеллентами).

Задача изобретения создание препарата с акаро- и инсекторепеллентной активностью, высокой продолжительностью действия и стабильностью рабочей эмульсии на основе доступного сырья, выпуск которого может быть осуществлен в России.

Предлагается средство защиты от укусов кровососущих членистоногих, включающее смесь репеллентов, содержащих диметилфталат (ДМФ) и масло базилика, смесь эмульгаторов, состоящую из триэтаноламина, стеариновой кислоты, аммиака водного 25% -ного и эмульгатора N 1 (сплавленной смеси, содержащей 70-73% высших жирных спиртов C_{16}-C_{21} и 27-30% натриевых солей сульфоэфиров этих же спиртов) и воду.

В средство дополнительно вводят N-(α -гексилоксиметил)капролактам (акреп), обладающий акаро- и инсекторепеллентной активностью при массовом соотношении репеллентов акрепа, ДМФ и масла базилика соответственно 0,9-1,1: 0,9-1,1: 0,02-0,03 и в качестве вспомогательной добавки поливиниловый спирт при следующем соотношении ингредиентов состава, мас.

Смесь репеллентов 36,4-44,6
Триэтаноламин 0,2-0,4
Стеариновая кислота 1,7-2,3
Аммиак водный 25%-ный 0,2-0,4
Эмульгатор N 1 0,5-0,7
Поливиниловый спирт 0,7-5
Вода Остальное

Предложенное средство получило название Акрофтал.

Введение в предлагаемое средство Акрофтал в качестве действующего вещества акрепа расширяет спектр применения средства. Средство эффективно защищает не только от укусов летающих кровососущих насекомых, но и клещей (является акаро- и инсекторепеллентом).

В отличие от Оксамата акреп не обладает кожнораздражающим действием. Этот продукт разработан и предполагается к выпуску в России на базе доступного сырья.

Предложенное соотношение репеллентов акрепа, ДМФ и масла базилика соответственно 0,9-1,1:0,9-1,1:0,02-0,03 является по результатам испытаний наиболее оптимальным, так как только при этом соотношении достигается наилучшая эффективность средства.

Очень важным фактором для создания средства является введение в него вспомогательной добавки поливинилового спирта, который способствует улучшению потребительских свойств: уменьшается всасываемость препарата в кожу и одновременно увеличивается продолжительность акаро- и инсекторепеллентного действия.

Следует отметить, что из целого ряда испытанных полимерных соединений с целью уменьшения всасываемости препарата в кожу только поливиниловый спирт оказался пригодным для получения стабильной эмульсии.

Например, введение в эмульсию полиэтиленгликоля, поливинилпирролидона, натриевой соли карбоксиметилцеллюлозы в количестве 0,7-5% приводит к быстрому необратимому разрушению эмульсии (табл.1, примеры 6-11).

Пример 1. В стакан, снабженный мешалкой, заливают 53,3 мл воды и 0,3 г триэтаноламина, после чего смесь нагревают до 70°С. Затем при перемешивании после предварительного плавления добавляют 2 г стеариновой кислоты и 0,6 г эмульгатора N 1, после чего добавляют 3 г поливинилового

RU 2101005 C1

RU 2101005 C1

спирта и смесь перемешивают до полного растворения поливинилового спирта при 65-70°С. Затем добавляют 0,3 г 25%-ного водного раствора аммиака, перемешивают 5-10 мин. Затем при перемешивании вводят 20 г диметилфталата, 20 г N-(а -гексилоксиметил)капролактама и 0,5 г масла базилика. Нагревание прекращают и продолжают перемешивание до охлаждения эмульсии до 20-25°С. Получают водную эмульсию типа "масло в воде".

Аналогичным образом готовят другие эмульсии (табл.1).

Проводят проверку стабильности приготовленных эмульсий в условиях "Тропики" при температуре 45 ± 5°С в течение 48 ч. Результаты проверки стабильности эмульсий показали, что все приготовленные эмульсии (примеры 1-5) в интервале заявленных значений ингредиентов стабильны. Эти эмульсии оказались стабильными и при длительном хранении в течение 0,5 года.

Проведены испытания репеллентной активности заявленного средства Акрофтал по отношению к природным популяциям гнуса. Результаты испытаний представлены в табл.2.

Из данных табл.2 следует, что средство Акрофтал обеспечивает защиту от комаров в течение 5-7 ч, мокрецов в течение 4,8-5,2 ч, клещей более 4 ч, что на 1-2 ч превосходит длительность защитного действия эталона эмульсии ДЭТА.

Изучена токсичность предлагаемого средства Акрофтал. По острой токсичности при введении в желудок средство отнесено к IV классу опасности (ГОСТ 12.1.007-76), $ЛД_{50}$ для крыс-самок 22 г/кг, для самок-мышей 16 г/кг, для самцов крыс 15 г/кг. При нанесении на кожу минимальный летальный эффект недостижим, кумулятивная способность не выражена.

Средство Акрофтал прошло комплекс испытаний и допущено в 1994 г. к применению Федеральной комиссией по медицинским и иммунобиологическим препаратам, дезинфекционным и парфюмерно-косметическим средствам Россанэпидемнадзора Российской Федерации на одежде и на коже человека.

Формула изобретения:

Средство защиты от укусов кровососущих членистоногих, включающее смесь репеллентов, в том числе диметилфталат и масло базилика, смесь эмульгаторов, состоящую из триэтаноламина, стеариновой кислоты, аммиака водного 25%-ного и эмульгатора 1, вспомогательную добавку и воду, отличающееся тем, что смесь репеллентов дополнительно содержит N-(α-гексилоксиметил), капролактам при массовом соотношении репеллентов N-(а-гексилоксиметил) капролактама, диметилфталата и масла базилика соответственно 0,9 1,1 0,9 1,1 0,02 - 0,03 и в качестве вспомогательной добавки используют поливиниловый спирт при следующем соотношении ингредиентов состава, мас.

Смесь репеллентов 36,4 44,6
Триэтаноламин 0,2 0,4
Стеариновая кислота 1,7 2,3
Аммиак водный 25%-ный 0,2 0,4
Эмульгатор 1 (сплавленная смесь, содержащая 70 73% высших жирных спиртов C_{16} C_{21} и 27-30% натриевых солей сульфоэфиров этих же спиртов) 0,5 0,7
Поливиниловый спирт 0,7 5,0
Вода Остальное0

RU 2101005 C1

RU 2101005 C1

Таблица 1

Примеры приготовления эмульсий репеллентного средства и их стабильность

Показатели	Примеры приготовления эмульсий										
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12
1 Ингредиенты состава, мас.%											
Смесь репеллентов,	40,5	36,4	44,6	40,5	40,5	40,5	40,5	40,5	40,5	40,5	40,5
в том числе акреп (I)	20	18	22	18	22	20	20	20	20	20	20
ДМФ (II)	20	18	22	22	18	20	20	20	20	20	20
масло базилика (III)	0,5	0,4	0,6	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
Триэтаноламин	0,3	0,2	0,4	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3
Стеариновая к-та	2,0	1,7	2,3	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0
Аммиак водный 25%-ный	0,3	0,2	0,4	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3
Эмульгатор № 1	0,6	0,5	0,7	0,6	0,6	0,6	0,6	0,6	0,6	0,6	0,6
Поливиниловый спирт	3	0,7	5	3	3	-	-	-	-	-	-
Полиэтиленгликоль	-	-	-	-	-	0,7	5	-	-	-	-
Поливинилпирролидон	-	-	-	-	-	-	-	0,7	5	-	-
Натриевая соль карбоксиметилцеллюлозы	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0,7	5
Вода	53,3	60,3	46,6	53,3	53,3	55,6	51,3	55,6	51,3	55,6	51,3
2 Соотношение репеллентов											
I:	1:	0,9:	1,1:	0,9:	1,1:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
II:	1:	0,9:	1,1:	1,1:	0,9:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
III	0,025	0,02	0,03	0,025	0,025	0,025	0,025	0,025	0,025	0,025	0,025
3 Стабильность эмульсии при температуре 45±5°С в течение 48 ч	Ста-бильна	Ста-бильна	Ста-бильна	Ста-бильна	Ста-бильна	Неста-бильна	Неста-бильна	Неста-ильна	Неста-бильна	Неста-бильна	Неста-бильна

Таблица 2

Результаты сравнительных испытаний эффективности заявленного средства "Акрофтал" и эталона эмульсии ДЭТА

Название эмульсии	Репеллентная активность при нанесении на кожу						
	Московская обл.		Тверская обл.		Новосибирская обл.		
	комары р.Aedes	мокрецы р. Culicoides	комары р. Malsonia	мошки р. Simulium	комары р.Aedes	мокрецы р. Culicoides	взрослые клещи J. Persulcatus
Акрофтал	5,0±0,5	4,8±0,7	7,2±0,3	2,5±0,5	5,2±0,4	5,2±0,4	>4
ДЭТА	3,5±0,3	3,3±0,5	4,9±0,2	1,2±0,4	4,0±0,2	4,0±0,2	3,0