



ORAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

226422
(11) (B2)

(51) Int. Cl.³
A 61 K 31/025

(22) Přihlášeno 25 02 81

(21) {PV 1351-81}

(32) {31} {33} Právo přednosti od 26 02 80
{430/80} Maďarská lidová republika

(40) Zveřejněno 29 07 83

(45) Vydáno 15 05 86

(72)

Autor vynálezu

ERDŐS GYULA dr., KONCZ ÁGNES dr., BUDAPEŠT, KECZKEMÉTI
ISTVÁN, VÁC (MLR)

(73)

Majitel patentu

BIOGAL GYÓGYSZERGYÁR, DEBRECEN (MLR)

(54) Prostředek k odlišování

1

Vynález se týká prostředku k odlišování se synergickým účinkem. Prostředek podle vynálezu má lepší účinek než dosud známé prostředky a vůbec nedráždí kůži.

Dětské vši a mušky jsou v poslední době bohužel stále více rozšířené. Prostředky k odlišování nacházející se nyní v obchodě [nejvíce roztoky, jako například ERGO a NEOCIKLOTOX, výrobce podniky Biogal, Debrecen, Maďarsko] mají nevýhodu, že se po použití, to jest po vetření do vlasů nebo těla musí odstranit smytím. Mytím vlasů, popřípadě lázni mizí současně účinek a ošetřená osoba může být během krátké doby znovu zavšivena.

Úkolem vynálezu je opatřit prostředek k odlišování, který by při nízké koncentraci účinné látky zaručeně, rychle, pokud možno během několika minut, usmrcoval vši a hnídy (vajčka vši), nanesený na vlasech nebo tělesném ochlupení, popřípadě na částech oděvu, aby zůstal dlouho účinný, nedráždil kůži a oči a nemusel se po použití smývat.

Jako účinná látka se musí volit sloučeniny, které nejsou v použité koncentraci toxické a nemohou se kůží vstřebávat.

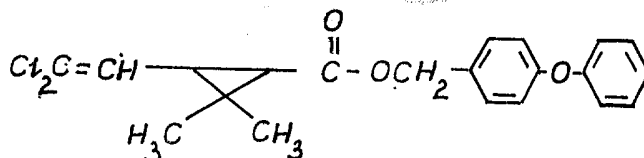
2

Těmto požadavkům vyhovují pyrethroidy. Pyrethroidy jsou syntetické analogy pyrethrinů. Jejich insekticidní účinek je známý [viz M. Elliott, N. F. Janes: „Pyrethroids — A New Class of Insecticide“, Chem. Soc. Review, sv. 7, sešit 4 [1978]].

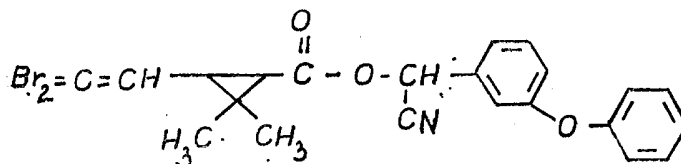
Překvapivě bylo nyní nalezeno, že se účinek pyrethroidů může podstatně zvýšit, když se použijí spolu s rostlinnými oleji a/nebo s detergenty.

Předmětem vynálezu je tedy prostředek k odlišování. Pro prostředek podle vynálezu je charakteristické, že obsahuje 0,1 až 5,0 % fotostabilních pyrethroidů a jako synergizující substanci 0,2 až 10 % rostlinných olejů a/nebo 0,6 až 60 % kationických nebo neionických detergentů, dále jako organické rozpouštědlo 25 až 80 % nízkých alkoholů, popřípadě 13 až 40 % destilované vody a popřípadě 0,1 až 1,0 % látek dodávajících vůni.

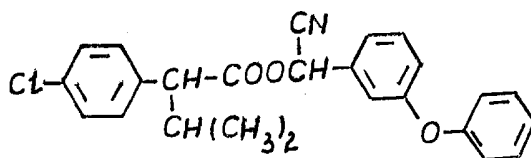
Z fotostabilních pyrethroidů jsou zvláště výhodnými 3-fenoxibenzyl(1RS)-cis,trans-3-(2,2-dichlorovinyl)-2,2-dimethylcyklopropankarboxylát, zvaný permethrin, vzorce



(S)-alfa-kyano-3-fenoxybenzyl(1R)-cis-3-(2,2-dibromovinyl)-2,2-dimethylcyklopropankarboxylát, zvaný dekamethrin, vzorce



a (RS)-alfa-kyano-3-fenoxybenzyl-(RS)-2-(4-chlorofenyl)-3-methylbutyrát, zvaný fenvalerát, vzorce



Prostředek podle vynálezu obsahuje alespoň jeden pyrethroid v množství 0,1 až 5,0 proc., výhodně přibližně 0,5 %, přičemž % jsou míněna vždy hmotnostně.

Jako synergizující rostlinný olej se uvádí ricinový olej, jako synergizující detergent 10% alkoholický roztok cetylpyridiniumbromidu (sterogenol). Zvlášť dobrého účinku se dosahuje při současném použití obou synergizujících látek, znatelný je však i účinek jednotlivě použitých synergizujících látek.

Aby se zabránilo alergii a dráždění pokožky, je v kompozici podle vynálezu značně vysoký podíl vody a organického rozpouštědla. Zvlášť se osvědčila rozpouštělová kombinace z 96% ethanolu, isopropanolu a vody v poměru asi 54:25:13. (U

všech pozdějších příkladů, směsí a důkazů účinku byl používán 96% ethylalkohol Spiritus concentratissimus podle Ph.Hg. VI.)

Sterogenol má sám nepatrný insekticidní účinek, který však na účinek kompozice podle vynálezu nemá žádný vliv.

Synergizující účinek rostlinného oleje a detergentu byl dokázán následujícím pokusem. Bylo nasazeno 5 různých roztoků, z nichž vedle rozpouštědel obsahoval první ricinový olej a sterogenol, druhý pouze permethrin, třetí permethrin a ricinový olej, čtvrtý permethrin a sterogenol a pátý permethrin, ricinový olej a sterogenol. Receptury těchto roztoků jsou uvedené v následující tabulce

Součást	1	2	3	4	5
permethrin (g)	—	0,5	0,5	0,5	0,5
ricinový olej (g)	1,0	—	1,0	—	1,0
sterogenol (g)	0,6	—	—	0,6	0,6
96% ethylalkohol (ml)	59,4	61,0	60,0	55,0	54,0
isopropanol (ml)	25,0	25,0	25,0	25,0	25,0
destilovaná voda (ml)	13,0	13,0	13,0	13,0	13,0

[Sterogenol je v obchodě jako 10% alkoholický roztok cetylpyridiniumbromidu].

Do těchto roztoků byly ponořeny kousky sukna, na které vši šatní (Pediculus humanus vestimentis) nakladly hojně hnid. Potom byly kousky sukna usušeny při teplotě místnosti a inkubovány osm dnů v termostatu při 30 °C. Potom byl na každém kousku sukna spočítán celkový počet hnid, ja-

kož i zničené hnidy (hnidy jsou soudečkovité a u usmrčených hnid není víčko soudečku otevřené). Stupeň usmrčení se vyjádří jako poměr usmrčených hnid k celkovému počtu. Výsledky jsou obsažené v následující tabulce 1.

TABULKA 1

Roztok č.	Celkový počet hnid	Usmrčené hnidy	Úmrtnost %
1	213	32	15,0
2	186	96	51,0
3	197	117	59,4
4	225	182	80,9
5	196	191	97,4

Z tabulky je zřejmé, že jak ricinový olej, tak také sterogenol podstatně zlepšují stupeň usmrčení dosažitelný permethrinem. Nejlepšího účinku se však dosáhne, když se obě synergizující látky použijí dohromady.

Při pokusech na živých vších bylo zjištěno, že synergizující přísady také podstatně zvyšují tak zvaný knock-down účinek pyrethroidů. Knock-down účinek byl zkoušen následovně. Do zabroušených Petriho misek o průměru 9,5 cm byl dán roztok 0,1 mg, popřípadě 0,0333 mg permethrinu ve 2 ml me-

thylethylketonu. Dále byly připravené Petriho misky, které mimo permethrin obsahovaly ještě různá množství sterogenolu. Testované byly poměry permethrin : sterogenol = 1 : 0,5, 1 : 1, 1 : 2, 1 : 4 a 1 : 8.

Do Petriho misek bylo vždy umístěno 20 samiček mouchy domácí (*Musca domestica*) a každých 5 minut byl zjišťován počet usmrčených much. Z grafického znázornění úmrtnosti byla stanovena hodnota KD_{50} , tj. doba potřebná k usmrcení poloviny much. Každý pokus byl dvakrát opakován. Výsledky jsou uvedené v následující tabulce 2.

TABULKA 2

Permethrin mg/Petriho miska	KD ₅₀ (min) při poměru permethrin : sterogenol					
	1 : 0	1 : 0,5	1 : 1	1 : 2	1 : 4	1 : 8
0,1	10,2	7,7	6,8	8,3	9,4	10,7
0,0333	14,2	11,9	9,5	10,5	12,1	15,3

Z tabulky vyplývá, že doba pro KD_{50} byla podstatně zkrácena, tj. knock-down účinek byl při přidavku sterogenolu rychlejší. Při poměru 1 : 1 činilo zkrácení doby asi 30 %. Stejný pokus byl proveden s dekamethrinem místo s permethrinem a výsledky byly podobné. To je tím překvapivější, jak ukázaly vlastní pokusy, že nízký knock-down účinek permethrinu nebylo možno ani jednou zvýšit přidavkem druhého pyrethroidu s dobrým knock-down účinkem.

Prostředek podle vynálezu byl také vyzkoušen za reálných podmínek použití, tj. na lidech žijících v zavšiveném prostředí. Ve čtyřech skupinách bylo celkem ošetřeno 66 osob. Jednorázovým použitím prostředku podle příkladu 1 bylo ihned dosaženo úplného od všivení, které, když si ošetřené osoby po ošetření chvíli nemýly hlavu, vydrželo několik týdnů, i když osoby žily v prokazatelně zavšiveném prostředí.

Složení prostředků podle vynálezu se vysvětluje následujícími příklady.

Příklad 1

Permethrin techn.	0,5 %
Ricinový olej	1,0 %

Sterogenol	0,6 %
96% ethanol	54,4 %
Isopropanol	25,0 %
Destilovaná voda	13,0 %
Vonná látka Bodietta	0,5 %

Příklad 2

Dekamethrin	4,0 %
Podzemnicový olej	10,0 %
Laurylpyridiniumsulfát	20,0 %
96% ethanol	50,0 %
Voda	15,0 %
Vonná kompozice	1,0 %

Příklad 3

Fenvalerát	1,0 %
Ricinový olej	5,0 %
Glycerinmonostearát	10,0 %
96% ethanol	20,0 %
Isopropanol	25,0 %
Vonná kompozice	1,0 %
Destilovaná voda	38,0 %

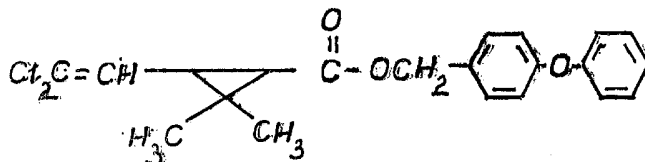
Přípravky jsou ve tmavé láhvi a v chladu skladovatelné dva roky.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Prostředek k odvíšivování zejména ve formě spraye se synergickým účinkem, vyznačený tím, že obsahuje jako účinnou látku 0,1 až 5,0 % fotostabilních pyrethroidů a jako synergizující substanci 0,2 až 10,0 % rostlinných olejů a/nebo 0,6 až 60,0 % kationického nebo neionického detergentu a dále 25 až 80 % nízkých alkanolů a popří-

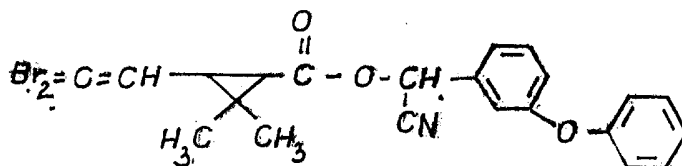
padě 13 až 40 % destilované vody a popřípadě 0,1 až 1,0 % vonných látek.

2. Prostředek nebo spray podle bodu 1, vyznačený tím, že jako fotostabilní pyrethroid obsahuje 3-fenoxybenzyl(1R)cis,trans-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyklopropankarboxylát vzorce



3. Prostředek nebo spray podle bodu 1, vyznačený tím, že jako fotostabilní pyrethroid obsahuje (S)-alfa-kyano-3-fenoxy-

benzyl(1R)-cis-3-(2,2-dibromvinyl)-2,2-dimethylcyklopropankarboxylát vzorce



4. Prostředek nebo spray podle bodů 1 až 3, vyznačený tím, že obsahuje fotostabilní pyrethroidy v množství 0,3 až 0,6 .

5. Prostředek nebo spray podle bodů 1 až 4, vyznačený tím, že jako rostlinný olej obsahuje ricinový olej v množství 0,5 až 2,0 procent.

6. Prostředek nebo spray podle bodů 1 až 5, vyznačený tím, že jako kationický detergent obsahuje 10% alkoholický roztok ce-

tylpyridiniumbromidu v množství 0,5 až 1,0 procenta.

7. Prostředek nebo spray podle bodů 1 až 6, vyznačený tím, že jako nízké alkanoly obsahuje ethanol a/nebo isopropanol.

8. Prostředek nebo spray podle bodů 1 až 7, vyznačený tím, že jako rozpouštědlo obsahuje 96% ethylalkohol, isopropanol a vodu v poměru 2,0 až 3,0 : 0,5 až 1,5 : 0,1 až 0,5.