

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 403 597**

51 Int. Cl.:

A01N 1/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.07.2004 E 04763576 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **03.04.2013 EP 1651034**

54 Título: **Compuestos orgánicos**

30 Prioridad:

29.07.2003 EP 03017131

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

20.05.2013

73 Titular/es:

**NOVARTIS AG (100.0%)
LICHTSTRASSE 35
4056 BASEL, CH**

72 Inventor/es:

**RAKOCZI, FERENC, JOZSEF y
HUG, JEAN-LOUIS**

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

ES 2 403 597 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Compuestos orgánicos.

Esta invención se dirige a un cebo granulado listo para su uso, para el control de moscas domésticas dentro de las casas y los establos para animales, los almacenes de forraje y las instalaciones sanitarias.

5 Las moscas domésticas son insectos que no solo son molestos sino también perjudiciales para el hombre y los animales, en particular a causa de los gérmenes patógenos que llevan, tales como tripanosomas, rickettsiae, bacilo de la tuberculosis, bacilo de la lepra, el cólera, bacilo tifoideo, disentería bacilar, bacteria del tipo ántrax, bacilo diftérico, amebas, diversos protozoarios y el virus de la fibra eruptiva, y las larvas de las cuales, adicionalmente, pueden causar miasis intestinal o cutánea. Por lo tanto, se entiende bien que las moscas domésticas, en particular
10 Diptera de las familias Muscidae, Sarcophagidae y Tachinidae, son objetivo en todo el mundo.

Tradicionalmente, los cebos de pesticidas se formulan con agentes activos de control de insectos, y opcionalmente atrayentes y agentes tensoactivos sobre un sustrato inerte que es del gusto de la plaga objetivo. Por ejemplo, US Patent No. 4,205,066 revela una composición cebo libre de azúcar que comprende un éster de un ácido carbámico N-sustituido o un compuesto organofosforado como agente insecticida.

15 La presente invención se relaciona con un cebo granulado para el control de moscas domésticas dentro de las casas y los establos para animales, los almacenes de forraje y las instalaciones sanitarias, caracterizado porque abarca uno o más agentes de control de insectos seleccionados del grupo que consiste de imidacloprid, tiametoxam, una piretrina natural, aletrina, tetrametrina, resmetrina, fenotrina, permetrina, deltametrina, tralometrina y fipronil; uno o más señuelos, seleccionados del grupo que consiste de muscalure, hexalure, medlure, vainillina, terpineol, farnesol,
20 geraniol, feniletanol y cis-9-tricoseno; uno o más alimentos, seleccionados del grupo que consiste de lactosa, maltosa y glucosa; y uno o más materiales de relleno, seleccionados del grupo que consiste de sacarosa, fructofuranosa y glucopiranososa.

El modo de acción insecticida de los agentes de control de insectos no tiene importancia; los agentes pueden ser inhibidores de la síntesis de la quitina, reguladores de crecimiento, hormonas juveniles o adulticidas. También
25 pueden ser insecticidas de banda ancha.

Se ha especificado que varias sustancias juegan el papel de señuelo en las composiciones de cebo insecticida. En particular, estos son muscalure, hexalure, medlure, malta, aceite de cáscara de naranja, vainillina, terpineol, farnesol, geraniol, feniletanol, productos de hidrólisis de células vivas, formaldehído, combinaciones de aminas terciarias y ácidos carboxílicos, alquenos clorinados, extractos a partir de fruta de aucuba, monoésteres alifáticos de polioles y cis-9-tricoseno.
30

Estos experimentos también demostraron que la efectividad del señuelo de estos atrayentes se aumenta, si el cebo es de color amarillo. Los colorantes de color amarillo aplicables son insolubles en agua; ejemplos típicos son los colorantes de dispersión de color amarillo disponibles comercialmente tales como el Hansa Brilliant Yellow 4GX.

Opcionalmente, otros adyuvantes se pueden adicionar a la composición de los gránulos que funcionan como portadores así como alimento para moscas tales como lactosa, maltosa o glucosa, estabilizantes de la estructura (pegamento) tales como glucidex o maltodextrina, agentes tensoactivos tales como agrimer o cualquier otro detergente/dispersante no-ionogénico, constituyentes amargos tal como el Bitrex, y material de relleno tal como la sacarosa, la fructofuranosa o la glucopiranososa.
35

Tradicionalmente, los gránulos de pesticidas se formulan sobre una base mineral o celulosa tal como arcilla, tierra de diatomeas, sílica, mazorca de maíz, cáscaras de cacahuete, papel o azúcar. Estos materiales tienden a ser hidrofílicos o higroscópicos que no solo causan la fácil formación de grumos en los contenedores de envase una vez abierto, sino también inducen la degradación química que reduce su vida útil. Por lo tanto, se requiere que una composición no solo sea esencialmente libre de agua, sino que también sea suficientemente hidrofóbica para soportar una larga vida útil.
40

El tamaño de los gránulos no debe ser demasiado pequeño para permitir que el usuario sea capaz de ver la zona tratada y/o permitir su fácil extracción. Por otra parte, para una efectividad óptima del señuelo, los gránulos no deben ser muy grandes. Los experimentos han demostrado que un diámetro de gránulo de aproximadamente 3 - 4 mm es ideal.
45

Estos requisitos demandan de un método de producción que asegure un producto seco, libre de polvo con un rango muy estrecho de tamaño de gránulo.
50

La presente invención ofrece la solución a los problemas mencionados, proporcionando un gránulo de cebo que por un lado tiene un gran efecto de señuelo en las moscas domésticas con una eficacia de larga duración debido a su hidrofobicidad dada por la composición química, y que por otra parte tiene un tamaño de gránulo que hace que sea fácilmente eliminable debido a su buena visibilidad para el usuario.

ES 2 403 597 T3

La invención se relaciona así, con una composición granular, que puede ser utilizada como un cebo para moscas domésticas, que comprende un agente de control de insectos, un alimento, un señuelo, un material de relleno y opcionalmente un constituyente amargo, un colorante atrayente, un estabilizador de la estructura y un agente tensoactivo.

- 5 Preferiblemente, esta composición cebo abarca un agente de control de insectos seleccionado a partir del grupo que comprende imidacloprid y tiametoxam; se prefiere especialmente el agente de control de insectos tiametoxam.

10 El agente de control de insectos está presente en la composición en una proporción de aproximadamente 0.01 por ciento a aproximadamente 5 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de aproximadamente 0.1 por ciento a aproximadamente 2 por ciento, más preferiblemente de aproximadamente 0.5 por ciento a aproximadamente 1.5 por ciento.

Preferiblemente, los alimentos de moscas se seleccionan a partir del grupo que comprende lactosa, maltosa y glucosa.

Se prefiere especialmente la lactosa.

- 15 El alimento para moscas está presente en la composición en una proporción de hasta aproximadamente 25 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de hasta aproximadamente 10 por ciento.

Preferiblemente, el señuelo se selecciona del grupo que comprende muscalure, hexalure, medlure, vainillina, terpineol, farnesol, geraniol, feniletanol y cis-9-tricoseno.

Se prefiere especialmente el cis-9-tricoseno.

- 20 El señuelo está presente en la composición en una proporción de aproximadamente 0.001 por ciento a aproximadamente 0.5 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de aproximadamente 0.01 por ciento a aproximadamente 0.2 por ciento, más preferiblemente de aproximadamente 0.05 por ciento a aproximadamente 0.15 por ciento.

Preferiblemente, esta composición cebo también abarca un constituyente amargo como un repelente contra cualquier otro animal.

- 25 Más preferiblemente, el constituyente amargo es el Bitrex.

El constituyente amargo está presente en la composición en una proporción de hasta aproximadamente 0.1 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de hasta aproximadamente 0.01 por ciento, más preferiblemente de hasta aproximadamente 0.005 por ciento.

- 30 Con el fin de aumentar la eficacia de atracción así como la visibilidad de los gránulos, preferiblemente la composición cebo también contiene un colorante.

Los colorantes preferidos se seleccionan del grupo que comprende los colorantes azo.

Se prefiere especialmente el Hansa Brilliant Yellow 4GX.

El colorante atrayente está presente en la composición en una proporción de hasta aproximadamente 1 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de hasta aproximadamente 0.1 por ciento.

- 35 Preferiblemente, la composición cebo también contiene un estabilizador de la estructura.

Los estabilizadores de la estructura preferidos, se seleccionan del grupo que comprende Glucidex o Maltodextrina.

Se prefiere especialmente la Glucidex.

El estabilizador de la estructura está presente en la composición en una proporción de hasta aproximadamente 25 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de hasta aproximadamente 10 por ciento.

- 40 Preferiblemente, la composición cebo también contiene un material de relleno.

Los materiales de relleno preferidos se seleccionan del grupo que comprende sacarosa, fructofuranosa y glucopiranososa.

Se prefiere especialmente la sacarosa.

- 45 El material de relleno está presente en la composición en una proporción de hasta aproximadamente 90 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de hasta aproximadamente 80 por ciento.

Preferiblemente, la composición cebo también contiene agentes tensoactivos.

Un agente tensoactivo especialmente preferido es el Agrimer.

El agente tensoactivo está presente en la composición en una proporción de hasta aproximadamente 0.1 por ciento, con respecto al peso de la composición, preferiblemente de hasta aproximadamente 0.05 por ciento.

Otras modalidades de la presente invención son:

- 5 (i) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que comprende también un constituyente amargo, en donde el agente de control de insectos se selecciona del grupo que comprende imidacloprid y tiametoxam y fipronil; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; y el constituyente amargo es el Bitrex.
- 10 (ii) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que también contiene un colorante, en donde el agente de control de insectos se selecciona del grupo que comprende imidacloprid y tiametoxam y fipronil; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; y el colorante se selecciona del grupo de los colorantes azo.
- (iii) Un cebo granulado de acuerdo con la modalidad (ii), en donde el colorante es el Hansa Brilliant Yellow 4GX.
- 15 (iv) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención, en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; y el material de relleno es la sacarosa.
- (v) Un cebo granulado de acuerdo con la anterior modalidad (i), en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; y el constituyente amargo es el Bitrex.
- 20 (vi) Un cebo granulado de acuerdo con la anterior modalidad (ii), en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; y el colorante es el Hansa Brilliant Yellow 4GX.
- (vii) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que también contiene un estabilizador de la estructura, en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; y el estabilizador de la estructura es el Glucidex.
- 25 (viii) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que también contiene un agente tensoactivo, en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; y el agente tensoactivo es el Agrimer.
- (ix) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que también contiene un constituyente amargo, un colorante y un estabilizador de la estructura, en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; el constituyente amargo es el Bitrex; el colorante es el Hansa Brilliant Yellow 4GX; y el estabilizador de la estructura es el Glucidex.
- 30 (x) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que también contiene un constituyente amargo, un colorante y un estabilizador de la estructura, en donde el agente de control en la composición está presente en una proporción de aproximadamente 0.01 por ciento a aproximadamente 5 por ciento, el señuelo en una proporción de aproximadamente 0.001 por ciento a aproximadamente 0.5 por ciento, el alimento en una proporción de hasta aproximadamente 25 por ciento, el material de relleno en una proporción de hasta aproximadamente 90 por ciento, el constituyente amargo en una proporción de hasta aproximadamente 0.1 por ciento, el colorante atrayente en una proporción de hasta aproximadamente 1 por ciento, y el estabilizador de la estructura en una proporción de hasta aproximadamente 25 por ciento, con respecto al peso de la composición.
- 35 (xi) Un cebo granulado de acuerdo con la presente invención que también contiene un constituyente amargo, un colorante y un estabilizador de la estructura, en donde el agente de control en la composición está presente en una proporción de aproximadamente 0.5 por ciento a aproximadamente 1.5 por ciento, el señuelo en una proporción de aproximadamente 0.05 por ciento a aproximadamente 0.15 por ciento, el alimento en una proporción de hasta aproximadamente 10 por ciento, el material de relleno en una proporción de hasta aproximadamente 80 por ciento, el constituyente amargo en una proporción de hasta aproximadamente 0.005 por ciento, el colorante atrayente en una proporción de hasta aproximadamente 0.1 por ciento, y el estabilizador de la estructura en una proporción de hasta aproximadamente 10 por ciento, con respecto al peso de la composición.
- 40 45

La invención también se relaciona con la fabricación de la composición del cebo. La preparación de la composición cebo en general se realiza mediante las siguientes etapas:

- 50 a) premezcla del material constituyente, excepto el constituyente amargo;
- b) opcionalmente atomización de una solución del constituyente amargo sobre la premezcla;
- c) atomización de agua sobre la mezcla final durante el proceso de granulación;

d) estandarización; y finalmente

e) secado y tamizado en seco del granulado.

Otro aspecto de la invención es el tamaño del granulado, el cual se logra utilizando un tamaño de malla apropiado del tamiz del raspador en el proceso de granulación. Un tamaño del granulado preferido está entre aproximadamente 1 y aproximadamente 5 mm, más preferiblemente entre aproximadamente 3 y aproximadamente 4 mm.

Un aspecto adicional de la invención es el hecho de que mediante las mencionadas etapas de preparación del granulado, el producto final es esencialmente libre de polvo en que mediante la etapa de tamizado en seco las partículas pequeñas se filtran de manera que la cantidad de partículas más pequeñas de aproximadamente 0.63 mm, es menor de aproximadamente 5%.

La importancia de las composiciones de acuerdo con la invención se demuestra mediante el siguiente ejemplo:

Ingredientes	Cantidad por 100 kg
Tiametoxam	1.03 kg
Cis-9-Tricoseno	0.17 kg
Agrimer AL-10 LC	0.05 kg
Glucidex 2	8.50 kg
Bitrex	0.002 kg
Hansa Brillant Yellow 4GX	0.08 kg
Lactosa en polvo	10.00 kg
Polvo de azúcar (Sacarosa)	80.168 kg

Un ejemplo típico de las etapas de preparación del cebo granulado de acuerdo con la invención es el siguiente:

Ejemplo 1: Fabricación del Cebo Granulado

15 a) Composición de la Mezcla de Secado

Una cantidad de 40 kg de Sacarosa se carga en un granulador vertical equipado con una boquilla rociadora, a continuación, se adicionan 1.03 kg de tiametoxam, 0.05 kg de agrimer, 8.5 kg de glucidex, 2 g de bitrex, 80 g de Hansa Brillant Yellow 4GX y 10 kg de lactosa en polvo y la mezcla se homogeniza intensamente, durante 5 minutos, con lo que la velocidad del mezclador principal es 100 rpm y la velocidad del cortador es 1500 rpm. Finalmente, se adicionan otros 40.168 kg de Sacarosa y la homogenización se continúa a la misma velocidad del mezclador y del cortador, durante otros 5 minutos. Al finalizar este primer periodo de homogenización, la mezcla se muestrea para medir el contenido de agua mediante el método de LOD (Pérdida por Secado). El % de LOD determinado (un valor típico es 0.6 %) será utilizado para el cálculo de la cantidad de agua necesaria para la etapa de humectación.

b) Adición del Constituyente Amargo a la Premezcla

25 Mientras que la mezcla se continúa, 170 g de tricoseno se atomizan sobre la premezcla en 2 minutos y la mezcla final se homogeniza por otros 5 minutos. Entonces, la mezcla final está lista para la humectación y granulación.

c) Humectación y Granulación

30 Con la misma velocidad del mezclador y del cortador que la anterior, una cantidad de 7.8 de LOD (en %) kg de agua purificada se atomizan en la mezcla final de 100 kg en 15 minutos (aproximadamente 0.48 kg/min) utilizando una boquilla rociadora con un diámetro interno de 1.2 mm en el mismo granulador vertical a una presión de la boquilla de 4-5 bar. Inmediatamente después de adicionar el agua el mezclador y el cortador se detienen y la mezcla final húmeda, homogénea se transfiere en el tamiz húmedo para la estandarización.

d) Estandarización

35 La mezcla final húmeda se estandariza durante 1-2 horas utilizando un tamiz húmedo apropiado. El tamaño de malla del tamiz raspador utilizado es 3 mm. El producto húmedo estandarizado se transfiere inmediatamente en el secador de lecho fluido.

e) Secado y Tamizado en Seco

5 El producto estandarizado húmedo, como sale del tamiz húmedo, se transfiere continuamente al secador de lecho fluido, precalentado a 30°C, el cual está equipado con una unidad de suministro de aire acondicionado y un sensor de humedad en el aire de escape. El producto se seca durante 10-20 minutos a una temperatura de aire de entrada de 30°C y un caudal de aire de 5000-6000 m³/h. El punto de rocío del aire de entrada es max. 7°C.

10 Después de 10-20 minutos de secado, el secador de lecho de fluido se abre y el producto se transfiere al estandarizador del tamiz seco que tiene un tamaño de malla cuadrada de 5 mm, dónde las partículas de tamaño excesivo se separan. Después de la estandarización en seco, el producto se carga otra vez en el secador de lecho fluido y se seca durante aproximadamente 80-100 minutos a una temperatura de entrada de aire de 60°C y un caudal de aire de aproximadamente 4000 m³/h. El aire utilizado es acondicionado y tiene un punto de rocío de max. 7 °C. Las muestras se toman cada 20 minutos y el LOD del producto se mide. El proceso de secado se completa tan pronto como la LOD del producto ha alcanzado 0.8 %. En este punto, la temperatura del aire de escape es al menos 54°C y la humedad restante del aire de salida ha disminuido por debajo de 0.145 %. A continuación, el producto

15 Los gránulos secos se muestrean y preparan para el envasado.

REIVINDICACIONES

- 5 **1.** Un cebo granulado para el control de moscas domésticas dentro de las casas y los establos para animales, los almacenes de forraje y las instalaciones sanitarias, **caracterizado porque** comprende uno o más agentes de control de insectos seleccionados del grupo que consiste de imidacloprid, tiametoxam, una piretrina natural, aletrina, tetrametrina, resmetrina, fenotrina, permetrina, deltametrina, tralometrina y fipronil;
- uno o más señuelos, seleccionados del grupo que consiste de muscalure, hexalure, medlure, vainillina, terpineol, farnesol, geraniol, feniletanol y cis-9-tricoseno;
- uno o más alimentos, seleccionados del grupo que consiste de lactosa, maltosa y glucosa;
- 10 y uno o más materiales de relleno, seleccionados del grupo que consiste de sacarosa, fructofuranosa y glucopiranososa.
- 2.** Un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado porque** también comprende uno o más constituyentes amargos, uno o más colorantes y uno o más estabilizantes de la estructura.
- 3.** Un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado porque** también comprende uno o más constituyentes amargos, uno o más colorantes, uno o más estabilizantes de la estructura y uno o más agentes tensoactivos.
- 15 **4.** Un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde los agentes de control de insectos se seleccionan a partir del grupo que comprende imidacloprid y tiametoxam y fipronil.
- 5.** Un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam.
- 20 **6.** Un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el agente de control de insectos se selecciona del grupo que comprende imidacloprid y tiametoxam y fipronil; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; y el material de relleno es la sacarosa.
- 7.** Un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el agente de control de insectos es el tiametoxam; el señuelo es el cis-9-tricoseno; el alimento es la lactosa; el material de relleno es la sacarosa; el constituyente amargo es el Bitrex; el colorante es el Hansa Brilliant Yellow 4GX; el estabilizador de la estructura es el Glucidex y el agente tensoactivo es el Agrimer.
- 25 **8.** Un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en donde el agente de control está presente en una proporción de 0.1 por ciento a 2 por ciento.
- 9.** Un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el agente de control en la composición está presente en una proporción de 0.1 por ciento a 2 por ciento, el señuelo en una proporción de 0.01 por ciento a 0.2 por ciento, el alimento en una proporción de hasta 10 por ciento, el material de relleno en una proporción de hasta 80 por ciento, el constituyente amargo en una proporción de hasta 0.01 por ciento, el colorante atrayente en una proporción de hasta 0.1 por ciento, y el estabilizador de la estructura en una proporción de hasta 10 por ciento, con respecto al peso de la composición.
- 30 **10.** Un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en donde el tamaño del granulado está entre 1 y 5 mm.
- 11.** Un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en donde la cantidad de partículas más pequeñas de 0.63 mm es menor del 5%.
- 12.** Método de preparación de un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, **caracterizado porque** comprende las siguientes etapas:
- 40 a) premezcla del material constituyente, excepto el constituyente amargo;
- b) opcionalmente, atomización de una solución del constituyente amargo sobre la premezcla;
- c) atomización de agua sobre la mezcla final durante el proceso de granulación;
- d) estandarización; y
- 45 e) secado y tamizado en seco del granulado.
- 13.** Método de preparación de un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 12, en donde el tamaño del granulado está entre 1 y 5 mm.

14. Método de preparación de un cebo granulado de acuerdo con la reivindicación 12, en donde la cantidad de partículas más pequeñas de 0.63 mm, es menor del 5%.

15. Un cebo granulado, preparado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 14.

16. Uso de un cebo granulado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en la preparación de una composición farmacéutica para controlar moscas domésticas dentro de las casas y los establos para animales, los almacenes de forraje y las instalaciones sanitarias.