

**"COMPOSICIONES QUÍMICAS QUE PRESENTAN EFECTO SINÉRGICO PARA REPELENCIA DE INSECTOS EN PRODUCTOS DE HIGIENE PERSONAL, COSMÉTICOS PARA USO HUMANO, EN ANIMALES Y EN SUPERFICIES INANIMADAS EN GENERAL"**

**[01]** Este proceso de patente cumple con requisitos en el área de actividad inventiva, presentando avances tecnológicos sobre los productos repelentes de insectos en general, actualmente comercializados en el mercado mundial, pudiéndose aplicarlo en la industrialización en ancha escala.

**[02]** Son aquí descritas composiciones químicas o mezcla de componentes que, en conjunto y en diversas proporciones entre sí, presentan efecto sinérgico, potencializando el poder de repelencia de insectos, tiempo de acción protectora y otorgando nueva acción insecticida, en productos de higiene personal de entre otros, como repelente de insectos de entre otros.

**[03]** La mezcla sinérgica se compone por 1-piperidinecarboxylic acid 2(2-hidroxyethyl) - 1-methylpropylester (Icaridina - CAS 119.515-38-7), N,Ndimethyl-3-methylbenzamide (DEET - Dietiltoluamida - CAS 134-62-3) combinados con 3-Phenoxybenzyl 3-(2,2-dichlorovinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (Permetrina - CAS 52.645-53-1) y/o 5-[2(2-butoxyetoxy)etoximethyl]-6-propyl-1,3-benzodioxol (Butóxido de Piperonila - CAS 51-03-6).

**[04]** Esas mezclas de compuestos químicos en diversas proporciones, considerando dos o más de estos componentes citados, presentan capacidad de repeler insectos sobre la

piel humana, en animales o cualquier otra superficie inanimada, superior a la capacidad de repelencia ya conocida de la Icaridina y DEET individualmente y, atribuye nueva característica insecticida a los productos repelentes de insectos.

### **ANTECEDENTES Y BENEFICIOS DE LA INVENCION**

[05] En muchas regiones del mundo, enfermedades peligrosas, como malaria, fiebre amarilla, microcefalia de entre otras, son transmitidas por mosquitos, zancudos y otros insectos. Estadísticas demuestran que una persona muere todo día en el mundo a cada 30 segundos debido a complicaciones generadas por picadas de insectos. Solamente la malaria causa cerca de 3 millones de muertes por año en el mundo entero.

[06] En los Estados Unidos y Europa, insectos transmisores de enfermedades son más raros, pero, el movimiento de turistas en esos países, transporta los virus y eleva la tasa de riesgo de contraer una enfermedad típica de países más tropicales.

[07] Diversos intentos de controlar o eliminar la proliferación de insectos no vienen logrando éxito. Otros métodos como vacunación vienen siendo la herramienta más utilizada, sin embargo, la prevención a través del uso de repelentes viene creciendo rápidamente en todo mundo.

[08] Los insectos machos superviven sólo consumiendo el néctar de las plantas. Solamente las hembras de los insectos pican humanos y animales debido a su necesidad de obtener proteína para generar un óvulo y posteriormente, el embrión.

**[09]** Con intuito de localizar sus potenciales fuentes de sangre o proteína, los insectos hembras poseen un complejo sistema sensorial para identificación de sus potenciales donadores. Estos sensores detectan la presencia de humedad, calor, gas carbónico y componentes químicos como aminoácidos, ácido láctico, amonio, entre otras sustancias excretadas por la piel humana.

**[010]** Los insectos son atraídos a sus donadores potenciales de proteína a través del olor de esos componentes que son detectados por sus sensores. Cuando localiza el donador, el insecto posa sobre la piel e introduce su probóscide (aguja) para inyectar una secreción que dilata los vasos sanguíneos, mientras al mismo tiempo, chupa la sangre a través de un segundo canal.

**[011]** Los productos repelentes de insectos, una vez depositados sobre la piel, forman una capa con olores que actúan directamente en el sistema sensorial de la hembra del insecto, confundiendo las señales que identifican una fuente de proteína como la sangre.

**[012]** Químicamente, los compuestos repelentes son derivados de amidas, alcoholes, esteres y éteres que presentan una baja tasa de evaporación a temperatura ambiente, permaneciendo más tiempo en la piel, otorgando una protección mayor al usuario del producto repelente.

**[013]** Los principios activos más conocidos con capacidad de repeler insectos son:

- A) 1-piperidinecarboxylic acid 2-(2-hidroxyethyl)-1-methylpropylester (Icaridina – CAS 119.515-38-7).
- B) N,N-dimethyl-3-methylbenzamide (DEET – Dietiltoluamida – CAS 134-62-3).

[014] El compuesto Icaridina posee ventajas sobre el DEET. El primer presenta reacciones alérgicas más moderadas cuando en contacto con la piel y menor toxicidad al metabolismo humano que el DEET. La Icaridina también demostró ser más biodegradable que el DEET, presentando menor impacto ambiental, principalmente en el ambiente marino.

[015] Analizándose la capacidad de repeler insectos a lo largo del tiempo, el compuesto Icaridina también presenta mejor desempeño que el DEET.

| Concentración del Principio activo en el repelente | Capacidad Repelente<br>Tiempo de Protección (horas) |      |
|----------------------------------------------------|-----------------------------------------------------|------|
|                                                    | Icaridina                                           | DEET |
| 5%                                                 | 1, 5                                                | 1    |
| 10%                                                | 4                                                   | 2    |
| 15%                                                | 7                                                   | 4    |
| 20%                                                | 10                                                  | 6    |
| 50%                                                | -                                                   | 10   |

[016] A pesar de las claras ventajas de la Icaridina sobre el DEET, la disponibilidad mundial para provisión de Icaridina, aún no permite la sustitución completa del DEET en los productos repelentes de insectos. Por este motivo, los de los principios activos aún conviven en el mercado mundial.

[017] La presente invención, a través de la utilización de una mezcla sinérgica de esos dos principios activos con Permetrina y el Butóxido de Piperonila, permite el empleo de concentraciones menores de Icaridina y DEET en los productos repelentes, manteniendo igual o mayor tiempo de protección, agregando la capacidad insecticida de la Permetrina al producto final.

[018] El empleo de menor concentración de principios activos contribuirá para un consumo más racionalizado de Icaridina y DEET, así como llevará a un menor impacto ambiental a largo plazo.

#### **DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LAS MODALIDADES PREFERIDAS DE LA INVENCION**

[019] Para fines de esa invención, "insectos" significan todos los insectos voladores o rastreadores que puedan picar la piel humana o animal para attingir el tejido subepitelial o la corriente sanguínea, al efecto de obtener nutrientes para sus subexistencias.

[020] Para fines de esa invención, "repelente de insectos" significa cualquier producto en la forma líquida, spray, loción, creme, aerosol, polvo, gel o sólida que posee la capacidad de alejar los insectos del contacto con la piel humana o animal.

[021] Para fines de esa invención, "tiempo de protección contra picadas de insectos" significa la cantidad de tiempo que el repelente de insecto, después de aplicado sobre la

piel humana o animal, consigue mantener su capacidad de repeler insectos siendo eficaz en evitar sus picadas.

[022] Para fines de esa invención, "principio activo" significa la sustancia química que compone el repelente de insectos y confiere a éste la mayor o 5/7 menor capacidad de repeler insectos por el tiempo de protección preconizado en el rótulo del producto repelente.

[023] Para fines de esa invención, "agentes potenciadores" significan sustancias químicas que aumentan la capacidad del principio activo de actuar sobre los insectos.

[024] Para fines de esa invención, "mezcla sinérgica" significa una composición de principios activos y agentes potenciadores que, cuando actuando en conjunto, presenta capacidad repelente de insectos mayor que la capacidad individual de sus componentes, determinándola el % del principio activo empleado en la formulación del repelente de insectos cuando comparado con el tiempo de protección contra picadas obtenido.

[025] Los compuestos químicos y sus proporciones que caracterizan la presente invención utilizan diversos principios activos y agentes potenciadores existentes en el mercado, sin embargo se centraliza en la mezcla sinérgica entre ellos en proporciones cuantitativas y cualitativas.

[026] Los compuestos químicos comprendidos en esa mezcla sinérgica para repeler insectos, son:

- A) 1-piperidinecarboxylic acid 2-(2-hidroxyethyl)-1-methylpropylester (Icaridina - CAS 119.515-38-7).
- B) N,N-dimethyl-3-methylbenzamide (DEET - Dietiltoluamida - CAS 134-62-3).
- c) 3-Phenoxybenzyl 3-(2,2-dichlorovinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (Permetrina - CAS 52.645-53-1).
- d) 5-[2-(2-butoxyetoxy)etoximethyl]-6-propyl-1,3-benzodioxol (Butóxido de Piperonila - CAS 51-03-6).

[027] Icaridina y DEET son empleados en esa mezcla sinérgica como principio activo. Sus capacidades de repeler insectos son potenciadas por los agentes Permetrina y Butóxido de Piperonila, otorgando tiempo de protección contra picadas de insectos igual o superior a 10 horas después de 6/7 aplicaciones del producto sobre la piel, mismo cuando se emplean esos principios activos en cantidades inferiores a las preconizadas por sus literaturas técnicas. La tabla abajo demuestra los datos obtenidos en las pruebas realizadas.

| Principio Activo                           | % concentración en el repelente de insectos | Tiempo de protección contra picadas de insectos |
|--------------------------------------------|---------------------------------------------|-------------------------------------------------|
| Icaridina                                  | 10%                                         | 4 horas                                         |
|                                            | 20%                                         | 10 horas                                        |
| DEET                                       | 7%                                          | 2 horas                                         |
|                                            | 50%                                         | 10 horas                                        |
| Icaridina +<br>Permetrina<br>+ Butóxido de | 1% al 10%                                   | Mayor que 10 horas                              |

|                                                                 |           |                       |
|-----------------------------------------------------------------|-----------|-----------------------|
| Piperonila                                                      |           |                       |
| DEET +<br>Permetrina +<br>Butóxido de<br>Piperonila             | 1% al 20% | Mayor que 10<br>horas |
| Icaridina + DEET<br>+ Permetrina<br>+ Butóxido de<br>Piperonila | 1% al 20% | Mayor que 10<br>horas |

**SUMARIO DE LA INVENCIÓN**

[028] La presente invención proporciona composiciones químicas para productos repelentes de insectos para uso humano, animal o superficies inanimadas que proporcionan una capacidad de repeler insectos superior a los productos típicos de mercado, exclusivamente formulados con Icaridina o DEET.

[029] La combinación de Icaridina o DEET con la Permetrina en la presencia de Butóxido de Piperonila hace con que el tiempo de protección contra picada de insectos conferido por la capacidad de repeler insectos de esas sustancias sea superior, mismo considerando el % de participación de esos componentes inferiores en las formulaciones de los productos.

[030] El DEET en concentraciones del 10% al 20% presenta la capacidad de repeler insectos durante 1 a 2 horas. Ya la Icaridina en concentraciones entre 20 al 25% consigue proteger el usuario contra picadas de insectos por hasta 10 7/7 horas. Para que el DEET alcance ese mismo tiempo de

protección es necesario que sea aplicado en la concentración de 50%.

**[031]** Cuando la composición de producto repelente de insectos presenta esas sustancias en la presencia del 1% al 10% de Permetrina y Butóxido de Piperonila, para que se alcance el mismo tiempo de protección (10 horas) contra picadas de insectos, son necesarias concentraciones inferiores al 10% de Icaridina o DEET.

**[032]** Las composiciones químicas ora inventadas también pueden recibir adición de compuestos que otorgan la capacidad hidratante para la piel seca, evitando resecar la piel debido al contacto con esos componentes.

**[033]** También pueden añadirse compuestos alcohólicos y miristato de isopropilo para reducir las reacciones alérgicas en el lugar de la picada, minimizando la comezón.

**[034]** Esas mezclas de agentes repelentes de insectos también pueden absorber componentes protectores de la piel contra rayos UVA y UVB como Diethylamino Hidroxybenzoil Hexyl Benzoate, Octiltriazone y Titanio Dioxide, otorgando al producto repelente de insectos características adicionales, convirtiendo el producto final 2 en 1, siendo repelente de insectos y protector solar al mismo tiempo.

**[035]** La presencia de Permetrina en la mezcla sinérgica confiere al repelente de insectos una capacidad insecticida adicional a los productos típicos de ese segmento de mercado.

## REIVINDICACIONES

1. "Composición química para repelentes de insectos", para todas las finalidades en uso humano, animal o superficies inanimadas, caracterizado porque contiene la mezcla de los 4 componentes relacionados abajo, en cualquier proporción:

- A) 1-piperidinecarboxylic acid 2-(2-hidroxyethyl)-1-methylpropylester (Icaridina - CAS 119.515-38-7);
- B) N,N-dimethyl-3-methylbenzamide (DEET - Dietiltoluamida - CAS 134-62-3);
- C) 3-Phenoxybenzyl 3-(2,2-dichlorovinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (Permetrina - CAS 52.645-53-1); y
- D) 5-[2-(2-butoxyetoxy)etoximethyl]-6-propyl-1,3-benzodioxol (Butóxido de Piperonila - CAS 51-03-6);

Solubilizándose en vehículos como agua, alcoholes y glicoles, pudiendo contener espesantes, materiales cerosos o resinas, pudiendo contener compuestos para protección de la piel contra rayos solares UVA y UVB, pudiendo contener antialérgicos, siendo que la presentación final de esa mezcla puede estar en las formas líquidas, pastosas, polvos o sólidas.

2. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque contiene componentes:

- A) 0% al 35% en peso de Icaridina (CAS 119.515-38-7);
- B) 0% al 60% en peso de DEET (CAS 134-62-3);
- C) 0% al 10% en peso de Permetrina (CAS 52645-53-1); y

d) 0% al 10% en peso de Butóxido de Piperonila (CAS 51-03-6).

3. "Composición", de acuerdo con las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque presenta sinergia entre sus componentes con relación a la capacidad de repeler insectos; esa mezcla de componentes presenta capacidad superior a las capacidades individuales de cada uno de sus componentes, permitiendo utilizar menor cantidad de cada componente para atingirse el mismo tiempo de protección contra picadas de insectos por parte del usuario de esa composición o producto.

4. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1 y 2, caracterizado porque posee acción insecticida conjuntamente con su poder repelente de insectos, conferido por la composición sinérgica de la Permetrina y Butóxido de Piperonila.

5. "Composición", de acuerdo con las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque es utilizada en repelentes de insectos para piel y ropas, en productos de higiene personal, cosméticos, para uso humano o en animales o en superficies inanimadas.

6. "Composición", de acuerdo con las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque contiene adición de Alcoholes Alifáticos y Miristato de Isopropilo (CAS 110-27-0), llevando la reducción de la comezón generada en el lugar de la piel donde fue picada.

7. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque contiene adición de compuestos

protectores de la piel contra rayos solares UVA y UVB en base al DiethylaminoHidroxybenzoylHexylBenzoate (CAS 302776-68-7), OctylTriazone (CAS 88122-99-0) y Titanium Dioxide (CAS 13463-67-7).

8. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque contiene espesantes en base a carbómeros y poliglicoles.

9. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque contiene materiales cerosos en base a ácidos grasos y sus derivados, aceites minerales, aceites vegetales, parafinas y olefinas.

10. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque contiene resinas acrílicas o extraídas de cualquier vegetal.

11. "Composición", de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque contiene compuestos hidratantes para piel humana o animal, en base a aceites vegetales o minerales, tensoactivos no iónicos, derivados del ácido esteárico, glicoles y otros alcoholes similares que presenten esa capacidad de hidratar la piel.

**RESUMEN**

**"COMPOSICIONES QUÍMICAS QUE PRESENTAN EFECTO SINÉRGICO PARA REPELENCIA DE INSECTOS EN PRODUCTOS DE HIGIENE PERSONAL, COSMÉTICOS PARA USO HUMANO, EN ANIMALES Y EN SUPERFICIES INANIMADAS EN GENERAL".**

Son aquí descritas composiciones químicas o mezcla de componentes que, en conjunto y en diversas proporciones entre sí, presentan efecto sinérgico, potenciando el poder de repelencia de insectos, tiempo de acción protectora y otorgando nueva acción insecticida, en productos de higiene personal de entre otros, como repelente de insectos de entre otros. La mezcla sinérgica se compone de 1-piperidinecarboxylic acid 2-(2-hidroxyethyl)-1methylpropylester (Icaridina - CAS 119.515-38-7), N,N-dimethyl-3methylbenzamide (DEET - Dietiltoluamida - CAS 134-62-3) combinados con 3Phenoxybenzyl 3-(2,2-dichlorovinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (Permetrina - CAS 52.645-53-1) y/o 5-[2-(2-butoxyetoxy)etoximethyl]-6propyl-1,3-benzodioxol (Butóxido de Piperonila - CAS 51-03-6). Esas mezclas de compuestos químicos en diversas proporciones, considerando dos o más de estos componentes citados, presentan la capacidad de repeler insectos sobre la piel humana, en animales o cualquier otra superficie inanimada, superior a la capacidad de repelencia ya conocida de la Icaridina y DEET individualmente y atribuye una nueva característica insecticida a los productos repelentes de insectos.