



C. 1964

Case 5449/E/I/So

307525

P A T E N T E  
D E  
I N V E N C I O N

por "Procedimiento para preparar una composición pesticida"  
a favor de la firma suiza CIBA SOCIETE ANONYME y de la  
firma japonesa SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LTD., residentes  
en BASILEA (Suiza) y OSAKA (Japón), respectivamente.

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

- Este invento se refiere a composiciones pesticidas que contienen, como ingrediente activo, una mezcla de 0,0-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato y 0,0-dimetil-O-(2,2-diclorovinil)-fosfato. Se refiere también
5. a composiciones pesticidas preparadas mezclando entre sí 0,0-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato, 0,0-dimetil-O-(2,2-diclorovinil)-fosfato y por lo menos un vehículo, en algunos casos preferentemente aceite de terpeno o aceite
10. de pino.

**POOR  
QUALITY**



- 2 -

307525

- Un objeto de este invento es proporcionar nuevas composiciones pesticidas que puedan destruir, por ejemplo, insectos nocivos, ácaros, nemátodos y gástrópodos y que puedan emplearse, verbigracia, para proteger las plantas, los materiales y los alimentos y para fines higiénicos generales y veterinarios, en forma de veneno por contacto, veneno gaseoso o veneno gástrico. Otro objeto de este invento es proporcionar nuevas composiciones pesticidas que tengan menor toxicidad respecto a las plantas, en especial respecto a las plantas frutíferas, con mayor actividad pesticida. Otros objetos se desprenden de la descripción que sigue.
- 5.
- 10.

- Para la preparación de estas composiciones pesticidas, se mezcla 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato con 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato en una amplia gama de proporciones ponderales. De ordinario se prefiere una proporción ponderal de 1:1 a 10:1 del primero respecto al último.
- 15.

- Las composiciones de este invento tienen efecto rápido ("knock-down effect"), sobre todo en la aplicación como veneno gaseoso (por ejemplo, en forma de aerosol), en comparación con uno de los componentes, el 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato, solo. Aunque las composiciones manifiestan poca toxicidad para los animales de sangre caliente, tienen un efecto irreversible perdurable,
- 20.
- 25.



es decir, los parásitos no pueden sobrevivir ni regenerarse gradualmente al aplicarse la composición por primera vez.

Sobremodera sorprendente es el efecto sinérgico, o sea la eficacia, de estas composiciones; por ejemplo, el efecto insecticida excede notablemente a la suma de los efectos de los componentes individuales. Cuando se usan contra insectos y ácaros, estas composiciones son eficaces para diversas fases del desarrollo, como huevos, larvas y adultos.

10. Ejemplos de los objetos que pueden protegerse son, por ejemplo los líquidos como el agua de los depósitos, toda clase de objetos en aposentos deshabitados, en cavas, en áticos, en establos y además pieles de adorno, plumas lana y análogos, así como organismos vivientes de los reinos vegetal y animal en sus diversas fases de desarrollo.

15. La lucha pesticida con las composiciones aquí expuestas sigue el procedimiento convencional, por ejemplo sometiendo los objetos que han de protegerse a un tratamiento con estas composiciones en forma de un preparado en polvo o nebulizable, por ejemplo una solución o suspensión en agua o en un disolvente orgánico apropiado, como alcohol, petróleo, destilado de alquitrán y análogos. Asimismo pueden emplearse para la protección de los objetos, por el método de nebulización o inmersión, soluciones acuosas o emulsiones acuosas obtenidas de solución orgánica que contenga la com-
- 20.
- 25.



posición activa aquí expuesta, Se obtienen resultados particularmente favorables, cuando esta composición se emplea en forma de aerosol.

5. Las preparaciones nebulizables y en polvo pueden contener en mezcla vehículos inertes convencionales, como caolín, yeso o bentonita, u otros aditivos, tales como lejía residual de celulosa sulfítica, derivados de celulosa y análogos, así como agentes humectantes y adhesivos convencionales destinados a mejorar las propiedades de humectación y adherencia.
- 10.

La composición aquí expuesta puede prepararse en forma de polvo, de emulsión acuosa, de pasta o de aceite de dispersión espontánea.

15. El O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato es un compuesto que tiene una toxicidad extremadamente baja para los animales de sangre caliente, presenta amplia eficacia y gran actividad pesticida y se utiliza extensamente. Sin embargo, este compuesto es relativamente tóxico para los vegetales y los árboles frutales; esta tendencia se manifiesta sobre todo en el caso de las plantas crucíferas. En consecuencia, este compuesto tiene la desventaja de que no se le puede emplear en las plantas crucíferas a pesar de la intensa acción pesticida sobre las plagas nocivas de las plantas crucíferas, tales como el gusano común de la col (*Pieris rapae*), la esciara de la col (*Barthia brassicae*) y la oruga agrotis ("clay backed
- 20.
- 25.



307525

cutworm")

La composición pesticida aquí expuesta es menos tóxica respectó a las plantas antes descritas y tiene excelentes actividades pesticidas.

5. Como resultado extensa labor de investigación, los inventores han descubierto que la composición preparada mezclando cantidades más o menos equivalentes de 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato y 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato y 40 a 85% en peso de aceite de terpeno o de aceite de pino en relación al peso de la mezcla de las dos substancias activas, no solo es capaz de disminuir el perjuicio químico antes expuesto del 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato a los vegetales y a los árboles frutales, y sobre todo a las plantas crucíferas, sino que tiene propiedades pesticidas extraordinariamente altas a causa del efecto sinérgico, en comparación con el efecto de cada componente solo.

10. En este caso, se prefiere mezclar 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato con 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato en la proporción de 1:1 aproximadamente.

15. En cuanto a la cantidad de aceite de terpeno o de pino que ha de mezclarse, se prefiere 10 a 100% en peso, y en especial 40 a 85% en peso, en relación al peso de la mezcla de 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato y 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato.



307525

Cuando la mezcla obtenida es una emulsión, precisa añadir un coadyuvante, como el xileno, y un emulgente. En concepto de emulgente puede emplearse un agente tensioactivo aniónico o un agente tensioactivo no iónico, o una mezcla de ambos.

5.

La mezcla de los ingredientes se efectúa lo más preferiblemente por el orden que se expone en los ejemplos.

- Esta composición es extraordinariamente ventajosa desde el punto de vista del coste, por cuanto parte del
10. 0,0-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato, que es caro, se sustituye por el 0,0-dimetil-O-(2,2-diclorovinil)-fosfato, que es barato, y por cuanto se despliega la misma alta acción pesticida aún en concentración mucho menor que en el caso del 0,0-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato solo y asimismo puede reducirse el perjuicio
15. químico a las plantas crucíferas y similares

Los ejemplos que siguen se dan simplemente a modo de ilustración y no implican limitación.



# 307525

## E J E M P L O 1

En una sala de 35 m<sup>3</sup> se rocian respectivamente con un nebulizador, a 2 atmósferas de presión, 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosfordiioato (A), 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato (B) y una mezcla de ambos en proporciones variables, en forma de una emulsión acuosa o de solución acetónica. Para cada experimento se emplearon 250 moscas domésticas. Los resultados figuran en las tablas que siguen.

10.

TABLA I

Forma de aplicación: emulsión acuosa				
componente activo	A	B	mezcla A : B = 10 : 1	
15. concentración (mg/cm <sup>3</sup> )	2	0.2	2.2	
20. moscas domésticas exterminadas en	15 - 30 min.	8	10	63
	30 - 45 min.	8	25	93



24

307525

TABLA II

Forma de aplicación: emulsión acuosa				
5.	Componente activo	A	B	mezcla A : B = 1 : 1
10.	Concentración (mg/cm <sup>3</sup> )	1	1	2
15.	moscas domésticas ex- terminadas en 0 - 15 min.	0	73	108

307525



TABLA III

Forma de aplicación: solución acetónica				
5.	Componente activo	A	B	mezcla A : B = 1 : 1
	concentración (mg/cm <sup>3</sup> )	2	0.2	2.2
10.	moscas domésticas exterminadas en			
	0- 15 min.	1	1	5
	13- 30 min.	3	33	76
15.				

La mezcla de A y B manifiesta también toxicidad claramente menor respecto a los animales de sangre caliente, en comparación con B.



307525

E J E M P L O 2

Se preparó una solución generatriz al 1% en metanol, respectivamente. de: 0,0-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato (A), 0,0-dimetil-O-(2,2-diclorovánil)-fosfato (b) y de una mezcla de ambos, y se diluyó cada solución generatriz con metanol hasta la concentración deseada.

Con un bucle de alambre de platino se aplicó alrededor de 1 mg de la solución al torax de cada uno de los 10 animales de ensayo, que luego se colocaron en una caja de Petri sin alimento.

Se mide la limitación activa, o sea la concentración mínima en que todavía se despliega el 100% de eficacia respecto a los animales de experimentación.

Los resultados figuran en las tablas que siguen.

24



307525

TABLA IV

5.

Eficacia respecto a la mosca doméstica (Musca domestica)			
Componente activo	A	B	mezcla A:B = 3:7
limitación activa ( $\gamma$ )	0,15	0,03	0,015

10.

TABLA V

15.

Eficacia respecto a la cucaracha americana (Periplaneta americana)			
Componente activo	A	B	mezcla A:B = 3:7
limitación activa ( $\gamma$ )	5,0	2,5	2,0



307525

E J E M P L O 3

5. Se combinan entre si y se agitan vigorosamente el primer concentrado emulsionable, preparado por mezcla de 25 g de 0,0-dietil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato, 22 g de xileno y 4 g de un agente tensioactivo (Agrisol PA, marca comercial registrada en la Kao Soap Co., Ltd), y el segundo concentrado emulsionable, preparado por mezcla de 25 g de 0,0-dietil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato, el g de aceite de pino y 3 g del mismo agente tensioactivo.
10. El concentrado emulsionable asi preparado se diluye con 1000 a 2000 veces su volumen de agua y se aplica a una planta crucifera. La emulsion manifiesta excelente actividad pesticida respecto al insecto nocivo y no produce ningun perjuicio quimico a la planta.

15. E J E M P L O 4

20. Se combinan entre si y se agitan vigorosamente el primer concentrado emulsionable, preparado por mezcla de 20 g de 0,0-dietil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato, 22 g de xileno y 10 g de un agente tensioactivo (Agrisol PA, marca comercial registrada de la Kao Soap Co. Ltd.) y el segundo concentrado emulsionable, preparado por mezcla de 20 g de 0,0-dietil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato, 21 g de

307525

24



- aceite de pino y 7 g del mismo agente tensioactivo, El concentrado emulsionable así preparado se diluye con 800 a 1,600 veces su volumen de agua y se aplica a una planta crucífera. La emulsión manifiesta excelente actividad pesticida respecto al insecto nocivo y no produce perjuicio químico a la planta.
- 5.

E J E M P L O 5

- Se combinan entre si y se agitan vigorosamente el primer concentrado emulsionable, preparado por mezcla de
10. 25 g de O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato y 3,5 g de un agente tensioactivo (Emulgator W. marca comercial registrada de la Bayer A.G.), y el segundo concentrado emulsionable, preparado por mezcla de 25 g de O,O-dimetil-O-(2,2-diclorovinil)-fosfato, 43 g de aceite de pino y
15. 3,5 g del mismo agente tensioactivo. El concentrado emulsionable así preparado se diluye con 1000 a 2000 veces su volumen de agua y se aplica a una planta crucífera. La emulsión manifiesta excelente actividad pesticida respecto al insecto nocivo y no produce perjuicio químico a la planta.

E J E M P L O 6

El perjuicio químico a las plantas crucíferas es como sigue:



307525

TABLA VI

	Nombre de la planta	Composicion	Coeficiente de dilucion		
			X500	X1000	X2000
5.		Una composición preparada en el ejemplo 3.	-	-	-
10.		Una composición preparada en el Ejemplo 4	-	-	-
	Col	Una composición preparada en el ejemplo 5	-	-	-
15.		Un concentrado emulsionable al 50% de O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato	++	+	-
20.		Una composición preparada en el ejemplo 3	-	-	-
	Rábano	Una composición preparada en el ejemplo 4	-	-	-
25.		Una composición preparada en el ejemplo 5	-	-	-



307525

Tabla 6 (continuación)

	Nombre de la planta	Composicion	Coeficiente de dilucion		
			x500	X1000	X2000
5.		Un concentrado emulsionable al 50% de O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato	+	+	-
10.		Una composición preparada en el Ejemplo 3	+	-	-
	Komatsuna (una clase de col china)	Una composición preparada en el Ejemplo 4	-	-	-
15.		Una composición preparada en el Ejemplo 5	-	-	-
20.		Un concentrado emulsionable al 50% de O,O-dimetil-O-(5-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato	+++	++	+

Nota: Las plantas de ensayo se hallaban en el estadio de dos hojas genuinas y 10 de las plantas se habian sembrado en un tiesto de 15 cm.



Se diluyó cada composición hasta la concentración fijada y se la pulverizó en cantidad de 10 cc por tiesto.

En la tabla VI anterior, " - " indica inocuidad y " + " indica nocividad. A medida que aumenta el número de " + ", resulta mayor la nocividad químicas. " ± " indica que la composición es casi inocua.

5.

E J E M P L O 7

A continuación se expone el efecto sinérgico de actividad pesticida contra las orugas agrotis ("clay backed cutworm) en comparación con la actividad del componente 0,0-dietil-O-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato solo y la del componente 0,0-dietil-O-(2,2-diclorovinil)-fosfato solo.

10.



24 Dic

307525

TABLA VII

		Actividad pesticida contra las larvas de 2ª fase de la oruga agrotis ("clay backed cutworm") (%)			
5.		X1000	X2000	X4000	X8000
	Coeficiente de dilución				
	composicion				
	Una composición preparada en el Ejemplo 3	100	100	80	,40
10.	Un concentrado emulsionable al 50% de O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitro-fenil)-fosforotioato	95	80	50	20
15.	O,O-dimetil-O-(2,2-diclorovinil)-fosfato	90	60	20	0

24 DIV



307525

N O T A

Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la solicitud de patentes japonesa 70597/63 del 26 de Diciembre de 1963 y suiza nº 4675/64 del 10 de Abril de 1964, existiendo en ellas unidad de invención.

10. 1. Procedimiento para preparar una composición pesticida, caracterizado por comprender por lo menos un vehículo inerte y, como ingrediente activo fundamental, una mezcla de 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato y 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato.

15. 2. Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque la composición pesticida comprende por lo menos un miembro elegido en el grupo constituido por el aceite de terpeno y el aceite de pino, y, como ingrediente activo fundamental, una mezcla de 0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitrofenil)-fosforotioato y 0,0-dimetil-0-(2,2-diclorovinil)-fosfato.

20. 3. Procedimiento para preparar una composición pesticida.

307525

24



Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 19 hojas foliadas y escritas a máquina por una solado sus caras.

Madrid, a 24 Diciembre de 1964

5;

CIBA SOCIETE ANONYME

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LTD;

p.a.

J A I M E I S E R N  
p. p.  
*[Handwritten signature]*