

322996

12 FEB



322996

MEMORIA DESCRIPTIVA

correspondiente a la solicitud de concesión de un...a

PATENTE DE INVENCION

SOLICITANTE: STAUFFER CHEMICAL COMPANY

RESIDENCIA: 380 Madison Avenue, NEW YORK, EE.UU.

ENUNCIADO: " METODO DE CONTROL DE ACAROS "

Prioridad: Patente estadounidense n. 435.678 del 26-2-65

RM.

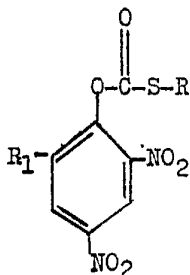
322996



1

Esta invención se relaciona con una nueva clase de compuestos orgánicos, tiocarbonatos aril-sustituídos, y con un método de utilización de los mismos. Más específicamente, la invención se relaciona con el compuesto de fórmula general:

5



10

en la que R es un miembro seleccionado del grupo consistente en alquilo, cicloalquilo, bencilo, fenilo y halofenilo, y R₁ es un alquilo inferior, que contiene de 1 a 6 átomos de carbono inclusive.

15

Estos compuestos han resultado ser útiles y particularmente eficaces contra organismos de ácaros pertenecientes a la clase de los acarinos. En término ácaros se emplea aquí para incluir tanto a los ácaros propiamente dichos como a las garrapatas, que están biológicamente relacionados e incluidos en el grupo taxonómico de los acarinos. Los ácaros constituyen un serio problema en la agricultura y en la horticultura. Los ácaros están profusamente distribuidos por todo el mundo y en los Estados Unidos se sabe que atacan una amplia variedad de plantas, aves y ganado. Pocas son las plagas que causan mayor daño a una variedad tan amplia de huéspedes como lo hacen los ácaros.

20

25

Se ha sugerido e investigado una considerable variedad de materiales acaricidas para el control de los organismos de los ácaros. Entre los biocidas orgánicos que han resultado ser eficaces en el control de una gran variedad de plagas, figuran los compuestos órgano-fosforados. Los ésteres órgano-fosforados han resultado ser eficaces en la destrucción de insectos. Varios de los insecticidas comerciales actualmente empleados para este fin incluyen como ingrediente tóxico uno o más de los ésteres órgano-fosforados. Ciertas especies de los

30

322996

12



1 ácaros fitófagos de la clase acarinos han mostrado un grado desusa-
do de resistencia a muchos de los insecticidas comúnmente empleados.
Es sabido que ciertos organismos son capaces de desarrollar resisten-
cia a ciertas clases de insecticidas y acaricidas; especialmente des-
5 tacable son los materiales órgano-fosforados. Por consiguiente, exis-
te una continua búsqueda de nuevos materiales para controlar las pla-
gas antes mencionadas, en los que se disminuya la capacidad de esta-
blecer resistencia y pueda realizarse un satisfactorio control. Se ha
descubierto que algunos de la nueva clase de tiocarbonatos alquil-
10 (alquildinitrofenílicos) aquí considerados son especialmente eficaces
en el control de los acáridos. La provisión de un método para comba-
tir las citadas plagas por medio de dichos tiocarbonatos y la provi-
sión de tales tiocarbonatos como nueva composición de materia, cons-
tituyen los objetos principales de esta invención. Otros objetos re-
sultarán evidentes a lo largo del resto de la invención.

15 Generalmente, los compuestos de la presente invención fue-
ron preparados mediante la reacción de un alquil-4,6-dinitrofenol y
una amina terciaria, tal como trietilamina, para formar la correspon-
diente sal. Esto iba seguido de la condensación de la sal así obteni-
da con el adecuado clorotioformato S-sustituido. La reacción progre-
sa fácilmente en la fase líquida. La incorporación de un disolvente
20 orgánico es también útil, facilitando el procedimiento, así como la
agitación de los reactivos. Las temperaturas que permiten operar en
fase líquida y comprendidas entre la temperatura ambiente y la tempe-
ratura del disolvente, si se emplea alguno, son utilizables. Típica-
mente, el siguiente ejemplo ilustra la preparación de los compuestos.

- Ejemplo -

Preparación de tiocarbonato (2-butilo secundario-4,6-dinitrofenil)-
S-bencílico.

30 Se disolvieron 16,9 g de 2-butilo secundario-4,6-dinitrofe-

322996

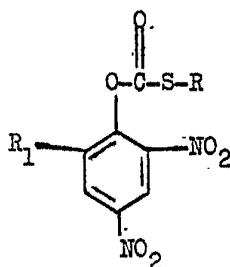
12



1 nol en 55 ml de acetona en un matraz de reacción provisto de agita-
 2 dor, condensador de reflujo y embudo cuentagotas. Se añadieron 7,1g
 3 de trietilamina a la solución para formar la sal adecuada. Seguida-
 4 mente se añadieron gradualmente y con agitación efectiva 13,1 g de
 5 S-bencilclorotioformato. Tuvo lugar una reacción moderadamente exotér-
 6 mica, que se completó refluendo la mezcla durante 2 horas. Después de
 7 enfriarse la mezcla a temperatura ambiente, se vertió en 200ml de
 8 agua y se extractó con 60 ml de cloruro de metileno. La capa orgánica
 9 fue separada, secada sobre sulfato magnésico anhidro, filtrada y
 10 despojada de componentes volátiles a presión reducida. Se obtuvieron
 11 25 g (91,5% del valor teórico) de un producto sólido amarillo que
 12 fundió a 81-85°C. El análisis coincidió bien con el esperado compues-
 13 to del epígrafe.

14 Lo que sigue es una tabla de los compuestos preparados de
 15 acuerdo con el procedimiento anteriormente descrito. Los números de
 16 los compuestos han sido asignados a cada uno de ellos y se utilizan
 17 para identificarlos a lo largo del resto de la solicitud.

- Tabla 1 -



25

Compuesto nº	R ₁	R	n _D ²¹ ó p.f.
1	butilo secundario.	n-butilo.	1,5400
2	butilo secundario.	bencilo.	81°C.
3	butilo secundario.	fenilo.	85°C.
4	butilo secundario.	metilo.	1,5451
30	5 butilo secundario.	etilo.	1,5320

322996



1	Compuesto nº	R ₁	R	n _D ²¹ ó p.f.
	6	butilo secundario	n-propilo.	1,5250
	7	butilo secundario	i-propilo.	1,5216
	8	butilo secundario	butilo terciario.	1,5184
5	9	butilo secundario	n-octilo.	1,5096
	10	butilo secundario	p-clorofenilo.	79°C.
	11	metilo.	bencilo.	87°C.
	12	butilo secundario	cicloexilo.	85°C.

■ preparado en el ejemplo.

10

En la utilización de los compuestos de la presente invención puede emplearse cualquiera de las diversas técnicas y métodos para poner a los compuestos tiocarbonatos tóxicos en contacto con los ácaros. Por ejemplo, las formulaciones pulverizables pueden prepararse disolviendo el tiocarbonato en adecuados disolventes orgánicos, tales como tolueno, xileno, benceno y similares y ulterior dispersión de esta solución en agua y en presencia de un agente de acción superficial, humectante o emulsionador. Otro método mediante el cual pueden aplicarse los agentes acaricidas de la presente invención es en forma de polvos dispersables, preferiblemente polvos homogéneos y libremente flúidos, comúnmente formulados mediante mezclado del componente activo con sólidos o vehículos finamente divididos, tales como talco, arcillas naturales, tierra de diatomeas, varias harinas, tales como de cáscara de nuez, trigo y similares. Los detalles de la composición y aplicación son bien conocidos de los expertos en el arte.

15

20

25

Los compuestos de la presente invención fueron ensayados como acaricidas de acuerdo con los siguientes métodos.

Ensayo de evaluación acaricida.— En los ensayos de actividad acaricida, se empleó el ácaro de dos manchas, *Tetranychus telarius* (Linn.); se usaron como plantas huéspedes unas de judías pintas jóvenes, en la etapa de foliación primaria. Estas plantas fueron infesta-

30

322996

12



1 das con varios centenares de ácaros. Se prepararon dispersiones de los
 materiales seleccionables disolviendo 0,1 g en 10ml de un adecuado
 disolvente, ordinariamente acetona. Se suspendieron partes alícuotas
 de las soluciones tóxicas en agua que contenía un 0,0175% v/v de Spon-
 5 to 221^R, agente emulsionador comercial. La cantidad de agua empleada
 fue suficiente para producir concentraciones de ingrediente activo
 del orden del 0,25 al 0,0005%. Las suspensiones de ensayo fueron lue-
 go pulverizadas sobre las plantas de judías pintas infestadas. Al ca-
 bo de siete días, se determinó la mortalidad de las formas post-embrío
 10 naria y ovular. Se determinó el porcentaje de exterminio mediante com-
 paración con plantas de control que no habían sido pulverizadas con
 los compuestos de ensayo. El valor de LC-50 se calculó utilizando pro-
 cedimientos bien conocidos. Los valores de LC-50 se indican bajo las
 columnas PE (post-embrionario) y E (huevos) en la Tabla II

15

TABLA II

Actividad acaricida

Compuesto nº	Acaro de dos manchas (LC-50)	
	<u>PE</u>	<u>E</u>
1	0,03	0,03
20 2	0,003	0,03
3	0,007	0,03
4	0,03	0,03
5	0,005	0,05
6	0,01	0,03
25 7	0,01	0,05
8	0,03	0,05
9	0,05	0,05
10	0,05	0,05
11	0,05	0,05
30 12	0,008	0,05



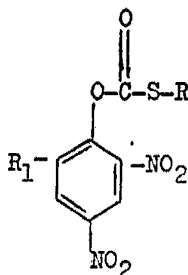
322996

1 Pueden efectuarse varios cambios y modificaciones sin apartarse del espíritu y ámbito de la invención aquí descrita, como resultará evidente para los expertos en el arte con el que aquélla se relaciona. Se pretende por consiguiente que la presente Invención sea
5 sólo limitada por el ámbito de las adjuntas reivindicaciones.

En resumen, la Patente de Invención que se solicita recaerá sobre las siguientes:

- REIVINDICACIONES -

10 1.- Método de control de ácaros, que comprende la aplicación a los mismos de una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula



15 en la que R es un miembro seleccionado del grupo consistente en alquilo, cicloalquilo, bencilo, fenilo y halofenilo, y R₁ es un alquilo, que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, inclusive.

20 2.- Método de control de ácaros, que comprende la aplicación a los mismos de una cantidad efectiva del compuesto tiocarbonato (2-butilo secundario-4,6-dinitrofenil)-S-n-Butílico.

25 3.- Método de control de ácaros, que comprende la aplicación a los mismos de una cantidad efectiva del compuesto tiocarbonato(2-butilox secundario-4,6-dinitrofenil)-S-bencílico.

4.- Método de control de ácaros, que comprende la aplicación a los mismos de una cantidad efectiva del compuesto tiocarbonato (2-butilo secundario-4,6-dinitrofenil)-S-etílico.

30 5.- Método de control de ácaros, que comprende la aplicación a los mismos de una cantidad efectiva del compuesto tiocarbonato (2-

12 FEB 1966



322996

1 metil-4,6-dinitrofenil)-S-bencílico.

6.- Método de control de ácaros, que comprende la aplicación a los mismos de una cantidad efectiva del compuesto tiocarbonato (2-butilo secundario-4,6-dinitrofenil)-S-cicloexílico.

5 7.- Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: "METODO DE CONTROL DE ACAROS".

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente Memoria descriptiva que consta de ocho páginas mecanografiadas.

10

Madrid, 12 Febrero 1.966

BERNARDO UNGRIA
P.P.

(Fdo. Juan Pedraza)

15

20

25

30