

331649

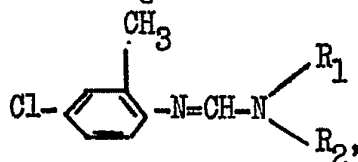


MEMORIA DESCRIPTIVA
de una Patente de Introducción a nombre de:
SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT, de nacionalidad
alemana, domiciliada en 1 BERLIN 65, Müller-
strasse, 170-172 (Alemania); por: "PROCEDI-
MIENTO DE PREPARACION DE AGENTES ANTIPARASI-
TARIOS ACTIVOS CONTRA CIERTOS ACARIANOS PARA-
SITOS DE LAS PLANTAS".

-----ooo000ooo-----

El presente invento se refiere a un agente de lucha
contra los tetránicos en todas las fases de su desarrollo.

La solicitante ha comprobado que los compuestos que
responden a la fórmula general:



en la cual R_1 y R_2 son restos alquilo que poseen hasta 4 átomos
de carbono, o bien R_1 es hidrógeno y R_2 es un resto alquilo tal



como se define anteriormente, así como sus sales, presentan buenas propiedades acaricidas y, en particular, buenas propiedades acaricidas-ovicidas.

5 La mayor parte de los acaricidas conocidos, que pertenecen por ejemplo al grupo de los hidrocarburos clorados o al grupo de las difenilsulfonas sustituidas, presentan el inconveniente de ser esencialmente o bien adulticidas o bien ovicidas, de tal suerte que, para luchar eficazmente contra todas las fases de desarrollo, es necesario repetir el tratamiento a intervalos
10 aproximados o utilizar preparaciones mixtas.

 En cambio, los compuestos relativos al presente invento actúan tanto contra las fases en que los tetránicos están dotados de movimiento (adulticida) como contra sus huevos (ovicida), con lo cual permiten luchar eficazmente contra todos los estados de
15 desarrollo. Esta acción notable se encuentra con intensidad particular en estos compuestos especiales, puesto que es evidente que las modificaciones, incluso poco importantes, aportadas al núcleo fenilo, provocan una fuerte disminución de la acción acaricida, que llega hasta la pérdida total de la actividad.

20 Los compuestos según el invento se caracterizan además por el hecho de que no ejercen acción alguna sobre los insectos, de tal suerte que pueden clasificarse en el grupo de los acaricidas selectivos, que son muy indicados en particular cuando conviene no dañar a los insectos útiles presentes, mientras son parásitos
25 de los tetránicos.



279

Una ventaja particular de los agentes de acuerdo con el presente invento es que poseen una acción reforzada contra los huevos ya evolucionados, de forma que pueden obtenerse buenos resultados incluso cuando se les utiliza en el caso de infestación ya establecida.

5

Pueden prepararse los compuestos de acuerdo con el presente invento según los procedimientos conocidos, por ejemplo por reacción de una mono- o dialquilamina formilada sobre el átomo de nitrógeno con cantidades equivalentes de oxiclورو de fósforo, eventualmente en presencia de un disolvente orgánico inerte, a temperaturas comprendidas entre 20 y 100°C, y adición posterior de una cantidad equivalente de 2-amino-5-clorotolueno. Cuando ha terminado la reacción, la cual varía desde los puntos de vista de duración y temperatura según las diferentes amidinas, se aísla de la forma habitual la amidina base libre.

10

15

La tabla siguiente muestra las constantes de algunos compuestos (punto de fusión no corregido).

N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-metilformamidina..F:85-87°C (en hexano)

20

N-(2-metil-4-clorofenil)-N'.N'-dimetilformamidina..... Acete: $n_D^{25} = 1,5885$

$d_4^{25} = 1,105$

N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-n-propilformamidina F:73-75°C (Hexano)

25

N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-isobutilformamidina F:81-82°C (Hexano)

N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-seg.butilformamidina F:42-44°C (Hexano)



Los compuestos pueden utilizarse ya sea solos ya mezclados con otros agentes pesticidas, esto por ejemplo en forma de agente de espolvoreado o incluso de emulsión o de suspensión para ser proyectado por pulverización. Tambien pueden utilizarse soluciones acuosas de las sales de los compuestos citados.

Estos agentes se ponen bajo una de las formas corrientes para las composiciones destinadas a la protección de las plantas, utilizando materias soportes sólidas o líquidas. Pueden citarse como soportes sólidos apropiados por ejemplo la cal, el caolín, el yeso, el talco, el attaclay y otras arcillas. Las composiciones pueden igualmente contener eventualmente, como aditivos, compuestos tensoactivos.

Los ejemplos que siguen proporcionan una imagen más precisa de la acción acaricida y de ciertas posibilidades de utilización de los compuestos según el presente invento, por comparación con compuestos químicamente cercanos a éstos. Estos ejemplos ilustran el invento sin limitar en absoluto el alcance del mismo.

EJEMPLO 1.- Acción sobre las fases postembrionarias y sobre los huevos.

Se tratan habichuelas enanas que se encuentran en la fase bifoliada tardía, infectadas por tetránicos comunes de la habichuela (*Tetranichus urticae* Koch) en todas sus fases de desarrollo, por medio de suspensiones o de emulsiones acuosas o de soluciones acuosas de las sales, a diversas concentraciones,



de los compuestos A conforme al presente invento y de varios compuestos B químicamente cercanos a los compuestos A. Los líquidos a pulverizar se aplican por medio de pistolas pulverizadoras que tienen en su parte anterior una tobera de vidrio, a una presión

5 de $0,5 \text{ kg/cm}^2$ sobre las plantas colocadas sobre una mesa giratoria en movimiento. La aplicación de una cantidad de líquido que oscila de 50 a 60 ml realiza una humectación completa de las plantas en maceta, que va hasta el escurrimiento. De una manera general, la acción en % sobre las fases postembrionarias

10 y sobre los huevos se determina al cabo de 7 días (para el compuesto 2, al cabo de 14 días).

(Ver tabla página siguiente)



	Concen- tración activa	Fases post- embriona- rias	Huevos
	%	%	%
A. Compuestos según el invento:			
5	1. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-di- metilformamidina	(0,1 (0,05 (0,02 (0,01	100 100 100 95
10	2. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'N'- dimetilformamidina	(0,1 (0,05 (0,02 (0,01	100 100 100 95
	3. Cloruro de N-(2-metil-4-clorofe- nil)-N'N'-dimetilformamidinio	(0,1 (0,05 (0,02	100 100 100
15	4. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'N'- diethylformamidina	(0,1 (0,05	90 -
	5. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'.n-pro- pilformamidina	(0,1 (0,05	90 -
	6. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'N'-di-n-(propilformamidina	(0,1 (0,05	90 -
20	7. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-iso- butilformamidina	(0,1 (0,05	100 -
	8. N-(2-metil-4-clorofenil)-N'-seg. butilformamidina	(0,1 (0,05	80 -
B. Otros compuestos:			
25	N-fenil-N'N'-dimetilformamidina	0,1	0
	Cloruro de N-(2-metil-fenil)-N'N'-di- metilformamidina	0,1	0
	Cloruro de N-(4-metil-fenil)-N'N'dime- tilformamidina	0,1	0
30	Cloruro de N-(3-cloro-fenil)-N'N'-di- metilformamidinio	0,1	0
	N-(3-cloro-4-metil-fenil)-N'.N-dime- tilformamidina	0,1	0
35	Cloruro de N-(3,4-dicloro-fenil)-N'N'- diethylformamidinio	0,1	0



EJEMPLO 2.- Acción sobre huevos de edades diferentes.

El estudio se efectúa por medio de una prueba sobre fragmentos de hoja (cf. S.C. HOYT, Journ. of Econ. Entomol., vol. 54 (1961), f. 1, p. 12-16). Se recortan sobre las hojas de habichuela, por medio de un taladro, fragmentos de 18 mm de diámetro, que se colocan, para guardar su frescor, sobre un soporte de materia espumosa impregnada de agua que descansa en una caja de Petri abierta. Para realizar la postura de los huevos sobre los fragmentos de hoja se depositan sobre cada fragmento 10 hembras adultas de tetránico común de la habichuela (*Tetranychus urticae* Koch) que se retiran cada vez al cabo de un día. El número de los huevos puestos es por término medio de 50 por cada fragmento de hoja. Se efectúa la proyección sobre los huevos por medio de uno de los dispositivos corrientes de dosificación (balance dosimétrico de Ehlers, cf. M. Ehlers, Nachrichtenblatt des Pflanzeschuttdienstes, 5º año, fasc. 4, p. 60-62. 1953), y, en cada caso, se evalúa, 8 días después de la partida, el número de los muertos (es decir, de los huevos no nacidos).



27

5

Cuerpo activo	Concen- tración del cuer po activo	Huevos de un tiempo de				
		0-1	1-2	2-3	3-4	4-5
	p.p.m.					
N-(2-metil-4-clorofe- nil)-N'N'-dimetilfor- mamidina	(2	40	22	49	74	82
	(4	51	55	58	86	99
	(8	59	60	89	93	99
	(12	92	100	96	96	100

-----N O T A-----

10 1.- Procedimiento de preparación de agentes antiparasi-
tarios activos contra ciertos acarianos parásitos de las plantas,
caracterizado porque se hace reaccionar una mono- o dialquilamina
formilada sobre el átomo de nitrógeno con el oxicloriguro de fós-
foro y el 2-amino-5-cloro-tolueno, eventualmente en presencia de
un disolvente orgánico inerte, a temperaturas comprendidas entre
15 20°C y el punto de ebullición del disolvente, y se transforma
eventualmente el compuesto obtenido en una de sus sales.

2.- PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE AGENTES ANTIPARA-
SITARIOS ACTIVOS CONTRA CIERTOS ACARIANOS PARASITOS DE LAS PLANTAS.

20 Tal como se describe y reivindica en la presente Memo-
ria Descriptiva, que consta de ocho hojas escritas a maquina por
una sola cara.

Madrid, 27 SEP. 1966

es J. J. J. J.