



344.879

344879

MEMORIA DESCRIPTIVA
de una Patente de Invención a nombre de:
SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT, de naciona-
lidad alemana, domiciliada en BERLIN, Mü-
llerstrasse 170-172 (Alemania); por:
"PROCEDIMIENTO DE FABRICACION DE UN ME-
DIO DE EFECTO INTENSIFICADO CONTRA LOS
ACAROS RESISTENTES AL ESTER FOSTORICO,
EN PARTICULAR ACARIDOS PARASITOS DE LAS
PLANTAS".

-----ooo000ooo-----

El presente invento se refiere a un procedimiento de fabricacion de un medio de efecto intensificado para combatir los ácaros resistentes al éster fosfórico, en particular los acáridos parásitos de las plantas.

5 Es sabido que los ácaros (Acarina) y, sobre todo, los acáridos (Tetranychidae) pueden llegar a ser resistentes contra los agentes químicos que se utilizan para combatirlos. Esta re-



sistencia es producida principalmente por medios a base de ésteres fosfóricos que se encuentran en los acaricidas más conocidos y eficaces. Una de las principales dificultades al respecto es debida a que tal resistencia de los parásitos no existe solamente
5 frente a la propia sustancia activa empleada, sino generalmente también frente a todas las demás sustancias activas que pertenecen a la misma clase de compuestos que aquélla. Aparte de esto, también puede observarse una resistencia frente a sustancias activas de otras clases de compuestos, siempre que las mismas desarrollen su efecto lo mismo que la sustancia activa causante de tal resistencia, a base de una inhibición de la enzima
10 de colinesterasa en el cuerpo del insecto.

Se señalaron oportunamente varios procedimientos de combatir parásitos que se han vuelto resistentes. En particular
15 se sugirió la fabricación y aplicación de nuevos compuestos con diferente actividad, lo cual no descartaba, sin embargo, el que pudiese producirse también una resistencia, paralela a la mencionada en primer lugar, frente a estas nuevas sustancias activas.

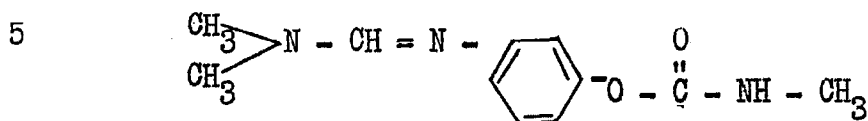
Hace unos años se sugirió también el buscar unos compuestos que fuese activos principalmente contra los parásitos
20 resistentes que tienen mayor sensibilidad que los insectos normales no resistentes, a lo cual se llama "resistencia negativa cruzada" (mayor sensibilidad inducida por resistencia). Hasta ahora se han encontrado en ese sentido sólo unos pocos compuestos
25 con tales propiedades, los cuales no lograron sin embargo



344879

generalizarse en la práctica porque no satisfacía su efecto como medio antiparasitario.

Se ha descubierto ahora que los medios conteniendo 3-dimetilamino-metileniminofenil-N-metilcarbamato de la fórmula



10 y/o sus sales con ácidos inorgánicos u orgánicos tienen, además de su efecto ya conocido contra insectos y ácaros normalmente sensibles, una actividad intensificada contra acáridos resistentes al éster fosfórico, sobre todo contra acáridos parásitos de las plantas, y que por lo mismo son apropiados para combatir estos parásitos aplicando una cantidad más pequeña que la que se necesita corrientemente para ácaros de sensibilidad normal.

15 El efecto insecticida y acaricida del compuesto mencionado así como de sus sales es ya conocido por la patente alemana nº 1.169.194 (patente inglesa nº 987.381). Pero de este efecto conocido no se pudieron sacar conclusiones acerca de una actividad principalmente contra ácaros resistentes al éster fosfórico, puesto que en los compuestos de efecto insecticida y acaricida de 20 análoga constitución no se pudo hallar hasta ahora ningún efecto de esta clase. Además es sorprendente, y ha de considerarse como un fenómeno particularmente raro, el hecho de que el efecto encontrado contra ácaros resistentes al éster fosfórico se desarro-

344879

- 8 SEP 1951



lla ya en concentraciones de aplicación que son inferiores a las cantidades corrientemente utilizadas en la práctica para combatir ácaros no resistentes, es decir normalmente sensibles. El hecho de que los ácaros resistentes al éster fosfórico se pueden 5 combatir ya con cantidades menores, y por tanto más económicas, de la sustancia a emplear según el invento, que para los ácaros no resistentes, tiene que considerarse como una aportación especial del invento.

Por cantidades corrientes deben entenderse aquí concentraciones de aplicación de unos 20 a 50 gramos por 100 litros de 10 caldo para pulverizar, que al emplear acaricidas conocidos a base de ésteres fosfóricos para combatir parásitos que se han vuelto resistentes, tienen incluso que aumentarse con frecuencia varias veces para conseguir una exterminación de resultados seguros.

Por el contrario, el medio sugerido por el invento permite ya con concentraciones más reducidas, y por tanto más económicas, 15 combatir con seguridad ácaros resistentes al éster fosfórico, lo cual representa un considerable progreso técnico. Por acaridos resistentes que pueden combatirse según la idea del invento, deben entenderse principalmente los que frente a ésteres fosfóricos de acción acaricida tienen valores de mortalidad LC_{50} de por 20 lo menos 50 ppm (partes en peso de sustancia activa por millón).

El medio sugerido por el invento puede aplicarse solo, mezclado o juntamente con otros medios antiparasitarios, tales como acaricidas, insecticidas o fungicidas. Su preparación se efec-

túa en una forma habitual para preparados fitosanitarios empleando sustancias de soporte líquidas o sólidas. Sustancias de soporte apropiadas son, además de agua, entre otros aceites minerales o disolventes; sustancias de soporte sólidas adecuadas son, por ejemplo bentonita, tierras decolorantes, yeso, cal, kieselgur, pirofilita, dióxido de silicio, talco o harinas de procedencia vegetal, tales como de semillas de algodón o de cáscara de nuez. Los preparados pueden contener aditivos, tales como emulgadores, humectantes, aglutinantes, estabilizadores, gases impelentes, sustancias aromáticas, atractivas o repelentes. Los medios pueden aplicarse, entre otros, como líquidos atomizables, pulverizables o inyectables, tales como suspensiones, emulsiones o soluciones.

La sustancia activa, como ya se dijo anteriormente, es de por sí conocida, y puede prepararse por métodos conocidos.

La sustancia activa a emplear según la idea del invento puede emplearse como tal y/o en forma de sus sales con ácidos inorgánicos u orgánicos, por ejemplo de clorhidratos solubles en agua:

El contenido en sustancia activa de los distintos preparados puede variar dentro de amplios límites. Entre otras cosas depende de la clase de formulación y del procedimiento de aplicación, y asciende aproximadamente del 0,1 al 90 por ciento en peso del producto. Como ya se ha dicho, para combatir ácaros resistentes al éster fosfórico bastan ya unas concentraciones de aplicación por debajo de lo corriente, por ejemplo 2 gramos de



sustancia activa por 100 litros de caldo para pulverizar - como se desprende del ejemplo 3, en donde un aumento hasta 10 gramos de sustancia activa por 100 litros de caldo para pulverizar comprende ya un margen de seguridad corriente en la práctica.

Los siguientes ejemplos de ensayo muestran la eficacia del medio sugerido por el invento en comparación con acaricidas conocidos.

EJEMPLO 1

La siguiente tabla incluye los valores LC_{50} (concentración letal con 50 % de mortalidad) que se obtuvieron con acáridos hembra por el método de trozos de hoja. A este fin, de unas hojas de judía se cortaron trozos redondos de 18 mm de diámetro, se colocaron con la parte de atrás hacia arriba sobre bases redondas de materia esponjosa en cubetas de Petri llenas de agua y se ocuparon cada una con 10 acáridos hembra. El tratamiento se hizo con 4 mg de caldo para pulverizar por cm^2 , a cuyo fin cada cuatro concentraciones disminuídas hasta la mitad fueron aplicadas en proximidad del valor LC_{50} previsto. Por concentración se emplearon 4 trozos de hoja con un total de 40 insectos, se calcularon los valores de mortalidad después de 3 a 4 días en tantos por ciento de animales muertos con relación a la suma total de animales experimentales y se registraron sobre el denominado papel Log-Probit (red de probabilidades). Se trazó una recta por los



puntos respectivos y se leyeron los valores del 50% de mortalidad en % de sustancia activa. Como acáridos se emplearon

- 5 a) una cepa normalmente sensible de laboratorio del acárido de invernadero (*Tetranychus urticae* Koch) = N,
- b) una cepa corriente resistente al éster fosfórico del acárido cariofileo (*Tetranychus dinathica* Dosse) = SR,
- 10 c) una cepa resistente obtenida por selección con O,O-dimetil-S-2-(etilsulfinil)-etiltiliofosfato = MR.

	Sustancias activas	LC ₅₀ en ppm		
		N	SR	MR
	3-dimetilaminometilenimino-fenil-N-metilcarbamato	2,9	0,21	0,34
15	<u>Ester fosfórico:</u>			
	O,O-dimetil-S-2-(etilsulfinil)-etiltiliofosfato	0,6	250	330
20	O,O-dietil-O-(2-isopropil-4-metilpirimidil-(6)-tionofosfato + O,O-dietil-2,5-diclorofenilmercaptometil-ditiofosfato (5:1)	10		500
	O,O-dimetil-N-metilcarbamoilmetilditiofosfato	1		68
25	O,O-dietil-S-(3,4-dihidro-4-oxo-(1,2,3-benzotriazinil-(3))-ditiofosfato	1	80	
	O,O-dimetil-S-(3,4-dihidro-4-oxo-(1,2,3-benzotriazinil-(3))-ditiofosfato	6	100	
30	O,O-dietil-N-isopropilcarbamoilmetilditiofosfato	0,8	600	
	O,O-dimetil-S-(5-metoxi-1,3,4-tiadiazol-2-on-il-(3)-metil)-ditiofosfato	0,6	80	
35	<u>Carbamatos:</u>			
	4-metilmercapto-3,5-dimetilfenilmetilcarbamato	13	122	55
	4-dimetilamino-3,5-dimetilfenilmetilcarbamato	25		140

344879

- 8 SEP



EJEMPLO 2

En esta tabla se han recopilado los valores LC_{50} que se obtienen por tratamiento de huevos de acárido recién puestas, debido a la matanza de las larvas que se deslizan fuera de ellas (efecto ovolarvicida). A este fin se pusieron acáridos hembra sobre los trozos de hoja y se los dejó 24 horas para que pusieran las huevas. De 30 hembras se obtuvieron en 3 trozos de hoja unas 100 a 150 huevas. Después de retirar las hembras se hizo el tratamiento con 4 mg de caldo para pulverización por cm^2 , a cuyo fin cada cuatro concentraciones reducidas a la mitad se aplicaron en proximidad del calor LC_{50} previsto. La observación de la mortalidad de las larvas jóvenes se hizo 2 días después de comprobado el deslizamiento fuera de las huevas en los controles sin tratamiento y 7 días después del tratamiento. La apreciación general continuó haciéndose lo mismo que se ha descrito en el ejemplo 1.

Sustancias activas	LC_{50} en ppm		
	N	SR	MR
3-dimetilaminometileniminofenil-N-metilcarbamato	21	3	3,7
O,O-dimetil-S-2-(etilsulfinil)-etil-tiolfosfato	7 unos	4000	unos 5000
O,O-dietil-S(3,4-dihidro-4-oxo-(1,2,3-benzotriazinil-(3)-ditiofosfato	7,4	40	

= 8 SEP.



344879

EJEMPLO 3

Unas matas de judía en maceta que se encontraban en el 2º estadio de hojas se infestaron con todos los estados de acáridos, y después de 2 días se rociaron por todas partes hasta empa-
 5 parlas con una solución o emulsión del agente a probar. A conti-
 nuación se pusieron las matas en el invernadero y después que
 hubo salido la primera hoja tripartita, lo que sucedió al cabo de
 10 días, se examinó el ataque (B) de estas hojas a base del porcen-
 taje de manchas blancas de inhibición con relación a la superficie
 total de la hoja. Los valores estimados se calcularon convirtiéndolos en efecto (W) ($W\% = 100 - B\%$).

		Efecto en %			
Sustancias activas	Conc.	N	MR	SR	
15	3-dimetilaminometilenimino- fenil-N-metilcarbamato- clorhidrato	0,004 %	96	100	100
		0,002	70	100	100
		0,001	41	97	99
		0,0005	12	94	99
		0,00025	-	51	82
20	0,0-dimetil-S-2-(etilsulfi- nil)-etiltiolfosfato	0,000125	-	-	78
		0,4 %	-	-	96
		0,2	-	-	90
		0,1	-	-	10
		0,05	-	-	0
25		0,002	98	-	-
		0,001	97	-	-
		0,0005	90	-	-
		0,00025	23	-	-



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

Se reivindica como nuevo y de propia invención:

1.- Procedimiento de fabricación de un medio de efecto intensificado contra ácaros resistentes al éster fosfórico, en particular acáridos parásitos de las plantas, caracterizado por-
5 que con 3-dimetilaminometilenimino-fenil-N-metilcarbamato de la fórmula

10



como sustancia activa y sustancias sólidas o líquidas de soporte, y en caso dado sustancias surfactivas, se prepara una mezcla con una concentración de sustancia activa preferentemente de 0,1 a 90 por ciento en peso, la cual se agrega al caldo de pulverizar en
15 cantidades de hasta 10 g, referido a la sustancia activa.

2.- PROCEDIMIENTO DE FABRICACION DE UN MEDIO DE EFECTO INTENSIFICADO CONTRA LOS ACAROS RESISTENTES AL ESTER FOSFORICO, EN PARTICULAR ACARIDOS PARASITOS DE LAS PLANTAS.

20

Tal como se describe y reivindica en la presente Memoria Descriptiva, que consta de diez hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 8 SEP. 1967

J. M. J.