



360638

CASE 6318/E

AGENCIA TECNICA
BASEL-LION, S. A.
N.º E. <u>A 01</u>
N.º S. <u>N</u>

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

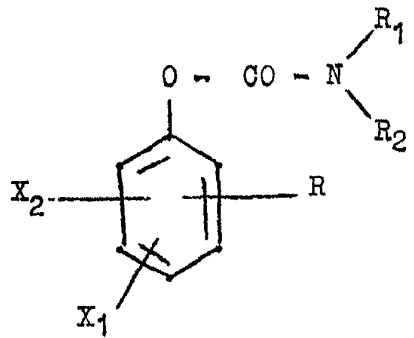
por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE INSECTICIDAS", a favor de la firma suiza CIBA SOCIETE ANONYME, residente en BASEL-LEA (Suiza).

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

Los compuestos de la fórmula

5.



en la que

10. R_1 y R_2 son iguales o diferentes y significan hidrógeno, alquilo inferior o alqueno inferior;

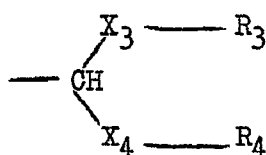
**POOR
QUALITY**



X_1 y X_2 son iguales o diferentes y significan hidrógeno, radicales alifáticos inferiores, saturados o insaturados, halógeno o grupos nitro; y

R representa una agrupación (situada en posición orto o meta respecto al radical carbamoiloxílico) de la fórmula

5.



10.

donde

X_3 y X_4 son iguales o diferentes y significan O o S; mientras que

R_3 y R_4 son iguales o diferentes y significan radicales alquílicos, alquenílicos o alquinílicos o, junto con todo el radical R, pueden formar también un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros, saturado o insaturado y que contiene X_3 y X_4 como heteroátomos; además de que R_3 y R_4 pueden también estar substituídos por radicales alifáticos inferiores, halógeno, nitro y el grupo hidroxílico,

15.

20.

son conocidos como materias activas en los agentes antiparasitarios. Tienen interesantes acciones biocidas, en particular insecticidas y acaricidas. Además, actúan también en sentido bactericida, fungicida y molusquicida. Acción particularmente ven-

25.



tajosa presentan estos carbamatos contra los parásitos de las provisiones y contra los insectos fitopatógenos, como los pulgones, la Prodenia, etcétera.

5. Sorprendentemente se ha descubierto ahora que las materias activas definidas por la fórmula general I tienen fuerte acción contra los insectos del terreno y las termitas.

10. Para combatir a los insectos del terreno, las materias activas de la fórmula I pueden emplearse en una de las formulaciones usuales y descritas en detalle en la patente holandesa nº 6 513 024.

15. De ordinario se pueden regar las plantas en crecimiento o ya cercanas a la madurez con una dispersión acuosa, o también se puede regar el suelo, antes de la siembra o de la plantación, con una dispersión acuosa de una de las materias activas, o aún incorporarse la simple materia activa al terreno por los métodos mecánicos acostumbrados.

20. Las termitas son los parásitos animales de mayor importancia que afectan a los materiales en los climas cálidos. A diferencia de otros parásitos, no sólo destruyen los materiales que les sirven de alimento, o sea las substancias celulósicas, sino también gran número de otros materiales de la más diversa composición química. Así, además de la madera, el papel y los géneros textiles, las termitas atacan y deterioran también las materias plásticas, el caucho, las lacas, el cuero y las masas



de bitumen y de cemento. Por otra parte, las roeduras más ínfimas pueden resultar catastróficas, porque de esta manera se inutilizan completamente, por ejemplo, aparatos eléctricos, cables de conducción, piezas de maquinaria, etcétera.

5. Puesto que el combatimiento directo de las termitas es inconducente, el método más seguro para evitar la destrucción de los bienes técnicos consiste en el tratamiento protector de los materiales que han de resguardarse del ataque de las termitas. Aquí debería desempeñar cierto papel, para las materias activas aptas según este invento, la acción en fase gaseosa además de la acción por contacto.
- 10.

- Hoy se está capacitado para pertrechar contra las termitas, con substancias y procedimientos apropiados, también otros materiales no textiles, por impregnación con las materias activas de la fórmula I o por incorporación de tales materias activas a las masas de partida, con lo cual se pretende y se consigue, no sólo estrictamente el exterminio de los parásitos, sino más bien hacer resistentes los materiales.
- 15.

- A los agentes contra las termitas se plantean en diversos aspectos exigencias especiales. Deben resistir, por ejemplo, a la carga térmica necesaria para la preparación y la elaboración de los materiales no textiles que se hayan de proteger y, eventualmente, a la influencia de materias extrañas, como plastificantes o materias de espuma, sin merma de la acción con-
- 20.

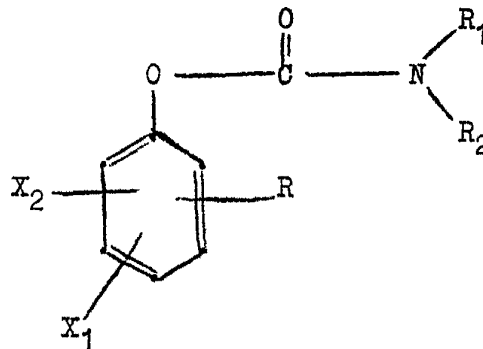


- tra las termitas. Además, los agentes deben proteger de modo duradero los materiales respectivos, mantenerse estables aún en climas tropicales, pero sin afectar por otra parte a la calidad y a las propiedades de dichos materiales, y por último deben ser inofensivos para el hombre y los animales útiles.
- 5.

Estas condiciones las cumplen las materias activas de la fórmula I.

El invento que aquí se expone se refiere por lo tanto al empleo de los carbamatos de la fórmula general

10.



15.

en la que

20. R_1 y R_2 son iguales o diferentes y significan hidrógeno, alquilo inferior o alquonilo inferior;

X_1 y X_2 son iguales o diferentes y significan hidrógeno, radicales alifáticos inferiores, saturados o insaturados, halógeno o grupos nitro;

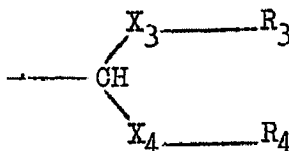
y

25. R representa una agrupación (situada en posición



orto o meta respecto al radical carbamoiloxílico) de la fórmula

5.



en la que

X_3 y X_4 son iguales o diferentes y significan O o S, mientras que

10.

R_3 y R_4 son iguales o diferentes y significan radicales alquílicos, alquenílicos o alquínílicos o, junto con todo el radical R, pueden formar también un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros, saturado o insaturado y que contiene X_3 y X_4 como

15.

heteroátomos, además de que R_3 y R_4 pueden también estar substituidos por radicales alifáticos inferiores, halógeno, nitro y el grupo hidroxílico,

20.

contra los insectos del terreno y las termitas, junto con un vehículo apropiado y, eventualmente, en mezcla con otros agentes conocidos contra los insectos del terreno o respectivamente las termitas.

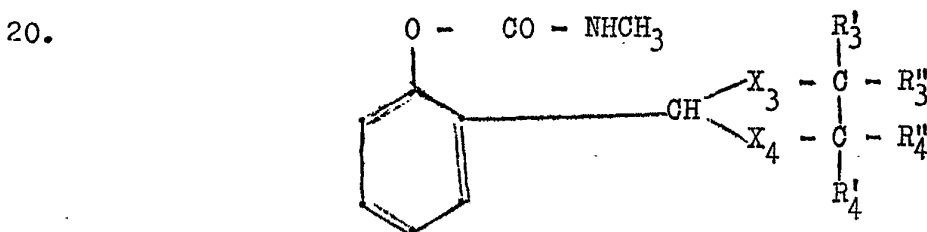
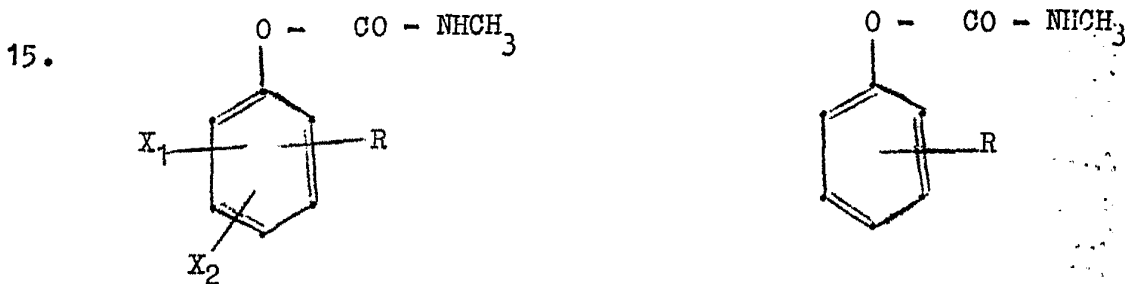
25.

Los radicales alquílicos, alquenílicos y alquínílicos inferiores indicados para R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , X_1 y X_2 presentan normalmente de 1 a 4 átomos de carbono. Los radicales alifáticos



- inferiores posibles como sustituyentes para R_3 y R_4 presentan normalmente de 1 a 4 átomos de carbono; de preferencia se trata de radicales alquílicos respectivos, que eventualmente pueden estar interrumpidos por heteroátomos, como oxígeno, azufre o nitrógeno, o sustituidos por sustituyentes como los que se han indicado para R_3 y R_4 . Pero se prefieren en especial los compuestos en los que R_1 , X_1 y X_2 representan hidrógeno, R_2 significa metilo y R_3 y R_4 están unidos entre sí, por lo cual R se convierte en un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros (en particular, de 5 miembros) en el que X_3 y X_4 denotan azufre y/o oxígeno (de preferencia, oxígeno).

Se hallan en primer término, por tanto, los tipos siguientes de compuestos:



25. donde



X_1, X_2, X_3, X_4 y R tienen el mismo significado que se ha indicado antes,

mientras que

5. R'_3, R''_3, R'_4 y R''_4 representan hidrógeno, hidrocarburos inferiores insaturados, o en particular saturados, de 1 a 4 átomos de carbono, que a su vez pueden estar substituídos por halógeno, hidroxilo, alcoxilo inferior o alquenciloxilo inferior, o constituyen, juntos, un enlace múltiple.

10.

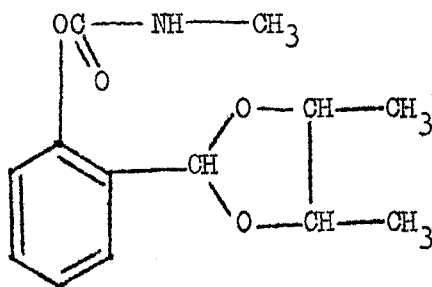
Ejemplo 1

- a) (Combatimiento de la mosca de la col;
Phorbia brassicae Bouché)

15.

Se plantó coliflor el 2 de mayo y se regaron las plantas, el 8 de mayo, con 1 dl por planta de una formulación acuosa de la materia activa de la fórmula

20.



25.

El 15 de junio se efectuó la evaluación, contando las cresas vivas y tasando con las notas 0 a 5 los daños por roc-



dura en las raíces lavadas.

Se obtuvieron los resultados siguientes:

Trata- miento	Número de plantas	Distribución porcentual de los daños por roedura						Número de cresas
		0	1	2	3	4	5	
sin tratar	36		3	47	47	3		30
A, 0,05 % WP	36	36	53	11				0

- b) Se plantaron repollos el 7 de julio y se regaron las plantas, el 14 de julio, con 1 dl por planta de la materia activa A (como se ha indicado en a); la evaluación se efectuó el 15 de agosto de la manera indicada en a).

Se obtuvieron los resultados siguientes:

Trata- miento	Número de plantas	Distribución porcentual de los daños por roedura						Número de cresas
		0	1	2	3	4	5	
sin tratar	38	8	18	47	21	3	3	26
A, 0,05 % A	39	44	46	10				3
Diacinona, 0,1 % EG 25	38	39	50	11				6



Ejemplo 2

a) (Combatimiento de la mosca del rábano;
Phorbia floralis Fallén)

5. Se roció una especie de rábanos (Ostergrass) el 26 de julio, cuando empezaba el engrosamiento de las raíces, con 2 litros/m² de una preparación acuosa al 0,05 % de la materia activa A. La evaluación se efectuó el 24 de agosto, examinando el ataque de cada 20 rábanos.

	% de ataque	% de acción	0,1 % de diacina
10.	<u>sin tratar</u>	<u>0,05 % WP 50 sustancia A</u>	<u>EC 25</u>
	70	100	79

15. b) En otra prueba se procedió de la misma manera que se ha descrito en a). El tratamiento se efectuó el 29 de agosto y la evaluación el 25 de septiembre, por examen del ataque en 50 rábanos (sin tratar, 100). Se obtuvieron los resultados siguientes:

	% de ataque	% de acción
	<u>sin tratar</u>	<u>0,05 % A WP 50</u>
	72	83



Ejemplo 3

Combatimiento de los gusanos blancos
(larvas de *Melolontha melolontha* L.)

5. En un campo de patatas, poco antes de la aporcadura, se dividieron en 4 repeticiones según la variante de bloque unas parcelas de 5 m². Los preparados se regaron a razón de 2 litros/m² y la dosificación fue de 5 kg de sustancia activa por hectárea.

10. El 7 de septiembre se cosecharon las patatas y se contaron los daños por roedura de los gusanos blancos. Se trataba de gusanos blancos en el tercer estadio larval (1 año después del año del vuelo).

Se obtuvieron los resultados siguientes:

	<u>Bulbos dañados</u>	<u>en porcentaje por unidades</u>	<u>en porcentaje de peso</u>
15.	sin tratar	7,5	10
	A	2,7	1,5
	Aldrin	2,2	1,3

Ejemplo 4

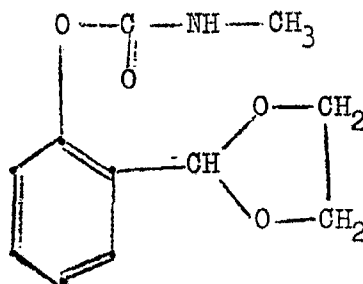
(Combatimiento de las termitas;
Kaloterms flavicollis)

20.



Sobre tablas de madera de pinabete que medían 20 x 5 mm se aplicó la substancia activa de la fórmula

5.



(B)

en cantidad de 2 g/m²; la comprobación se efectuó tres semanas después de aplicarse las substancias.

10.

Las muestra de control no tratadas resultaron muy fuertemente dañadas en la prueba de compulsión y la prueba de repelencia.

Las muestras tratadas con la substancia (B) tuvieron una actuación ahuyentante y tóxica. No fue posible descubrir ningún daño por roedura.

15.

Muestra	Roedura en el curso de 30 días		Toxicidad		
	compulsión	repelencia	compulsión	repelencia	toxicidad
sin tratar	++++	++++	normal	normal	0
20. compuesto B	0	0	tóxico	toxico	++++



<u>Muestra</u>	<u>Acción repelente % de termitas ahuyentadas de la muestra</u>
sin tratar	2,6 %
compuesto (B)	100 %

5.

Ejemplo 5

(Combatimiento de larvas de elatéridos; wire worms)

Los ensayos se dispusieron en variancia de bloques con tres repeticiones y en parcelas de 25 m². El terreno se regó con unos 400 litros por hectárea, o bien se esparció granulado por él, y a continuación se le lavó ligeramente. Algunos días más tarde se sembró maíz en hileras. Cuando las plantas surgidas tuvieron a lo menos 10 cm de altura, se determinó en cada parcela (con excepción de las partes marginales) el número de plantas. El ataque de los elatéridos reduce el número de las plantas.

Especies ensayadas: Donja Kupčina (DK) y Veleševac (V).

Lugar del ensayo: Yugoslavia.

Siembra: el 30-4-68 (V) y el 11-5-68 (DK)

20.

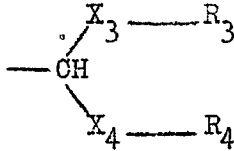
Resultados (todos los preparados se aplicaron en cantidad de 5 kg de substancia activa por hectárea):



Preparado	Número relativo de plantas	
	DK 28.6	V 29.6
sin tratamiento	100	100
B WP 50	121	104
A WP 50	124	104
A G 6	127	109
Endosulfan WP 35	115	107
Bromophos (agente de esparcimiento)	-	98



co) de la fórmula



5.

en la que

X_3 y X_4 son iguales o diferentes y significan O o S, mientras que

R_3 y R_4 son iguales o diferentes y significan alquilo,

10.

alquenilo o alquinilo inferiores o, junto con todo el radical R, pueden formar también un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, que contiene X_3 y X_4 como heteroátomos, además de que R_3 y R_4 pueden también estar substituídos por radicales alifáticos inferiores, halógeno, nitro y el grupo hidroxílico,

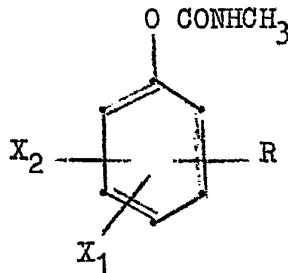
15.

utilizados como materia activa contra los insectos del terreno y las termitas, se disponen junto con materiales de soporte y/o vehículo, constituyendo un conjunto homogéneo

20.

2.- Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado por utilizar en calidad de materia activa de la fórmula general

25.





en la que

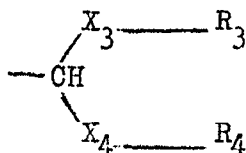
X_1 y X_2 son iguales o diferentes y significan hidrógeno, radicales alifáticos inferiores, saturados o insaturados, halógeno o nitro,

5.

mientras que

R representa una agrupación (situada en posición orto o meta respecto al radical carbamoiloxílico) de la fórmula

10.



en la que

X_3 y X_4 son iguales o diferentes y significan O o S, mientras que

15.

R_3 y R_4 son iguales o diferentes y significan alquilo, alquenilo o alquinilo inferiores o, junto con todo el radical R, pueden constituir también un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, que contiene X_3 y X_4 como

20.

heteroátomos, además de que R_3 y R_4 pueden también estar substituídos por radicales alifáticos inferiores, halógeno, nitro y el grupo hidroxílico.

3.- Procedimiento, según la reivindicación 1, caracteri-

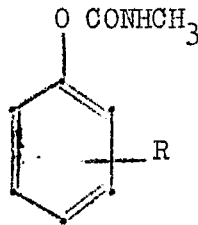
25.

zado por utilizar en calidad de materia activa de la fórmula ge-



neral

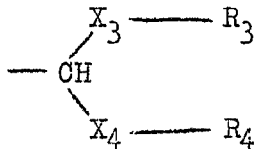
5.



en la que

R representa una agrupación (situada en posición orto o meta respecto al radical carbamoiloxílico) de la fórmula

10.



15.

en la que

X_3 y X_4 son iguales o diferentes y significan O o S, mientras que

R_3 y R_4 son iguales o diferentes y significan alquilo, alquenilo o alquinilo inferiores o, junto con

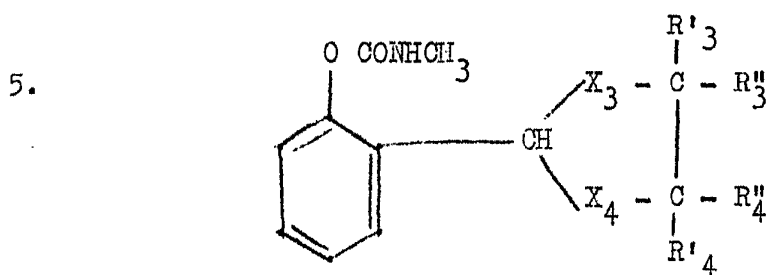
20.

todo el radical R, pueden constituir también un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, que contiene X_3 y X_4 como heteroátomos, además de que R_3 y R_4 pueden estar también substituídos por radicales alifáticos inferiores, halógeno, nitro y el grupo hidroxílico.

25.



4.- Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado por utilizar en calidad de materia activa de la fórmula general

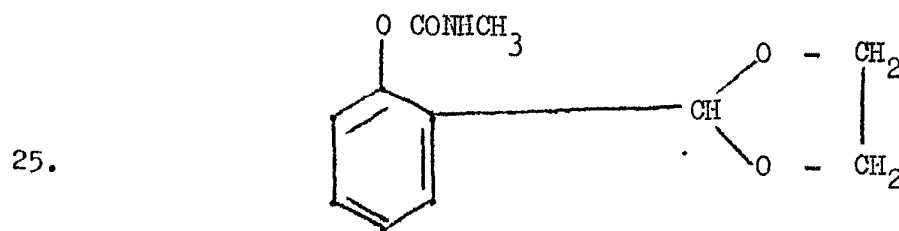


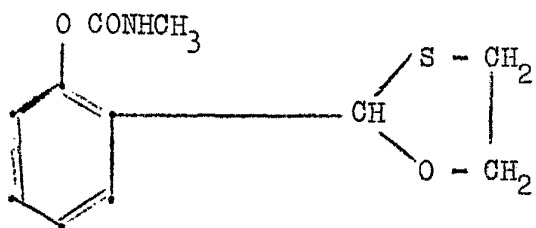
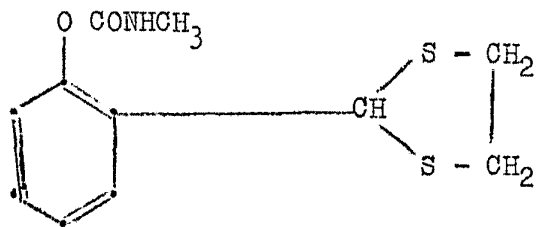
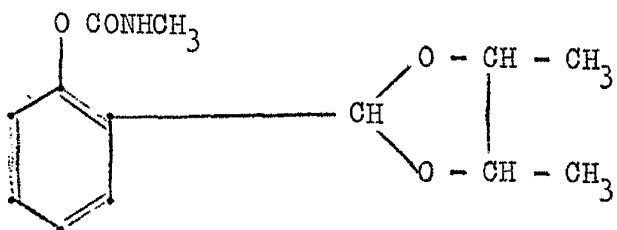
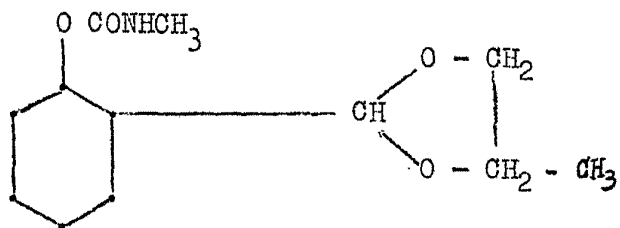
en la que

10. X_3 y X_4 son iguales o diferentes y significan O o S, mientras que

15. R'_3 , R''_3 , R'_4 y R''_4 son iguales o diferentes y significan radicales hidrocarburos alifáticos inferiores, saturados o insaturados, que pueden estar sustituidos por halógeno, hidroxilo, alcoxilo inferior o alqueniloxilo inferior, o, juntos, representan un enlace múltiple.

20. 5.- Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado por utilizar en calidad de materia activa los compuestos de las fórmulas







6.- Procedimiento para la preparación de insecticidas.

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

5.

Madrid, a 23 de noviembre de 1968

p. a.


Firmado: JOSE RODRIGUEZ

mt.