

409641

Case 5-7909/1+2

15



409641

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

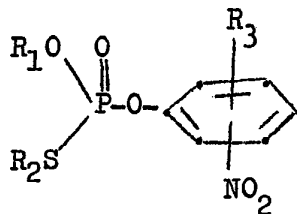
por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE ESTERES DE ACIDO NITROFENILTIOLOFOSFORICO" a favor de la firma suiza CIBA-GEIGY AG, residente en BASILEA (Suiza).

= Int. Cl.²: C07F/A01N

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a nuevos ésteres de ácido nitrofeniltiolfosfórico, al procedimiento para su preparación y a su utilización para combatir los parásitos.

5. Los ésteres de ácido nitrofeniltiolfosfórico tienen la fórmula



(I)

10.

409641



en la que

- R₁ significa metilo o etilo,
- R₂ significa n-propilo, n-butilo o n-pentilo y
- R₃ significa hidrógeno, metilo o cloro.

5. La fórmula I abarca por tanto compuestos, en los que

- R₁ significa metilo o etilo,
- R₂ significa n-propilo y
- R₃ significa hidrógeno, metilo o cloro,

10. en los que

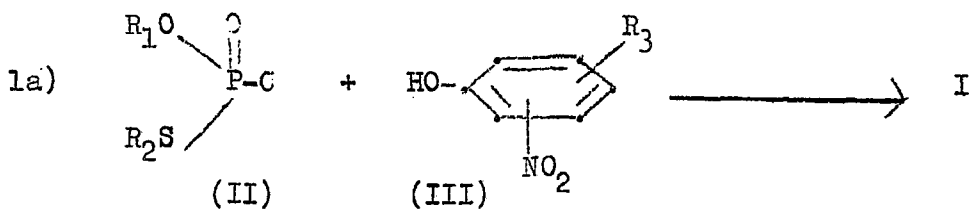
- R₁ significa metilo o etilo,
- R₂ significa h-butilo y
- R₃ significa hidrógeno, metilo o cloro,

o en los que

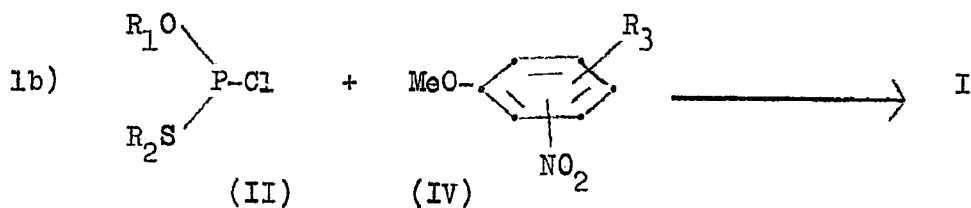
- 15. R₁ significa metilo o etilo,
- R₂ significa n-pentilo y
- R₃ significa hidrógeno, metilo o cloro.

Los compuestos de la fórmula I pueden prepararse según los siguientes métodos conocidos:

20.



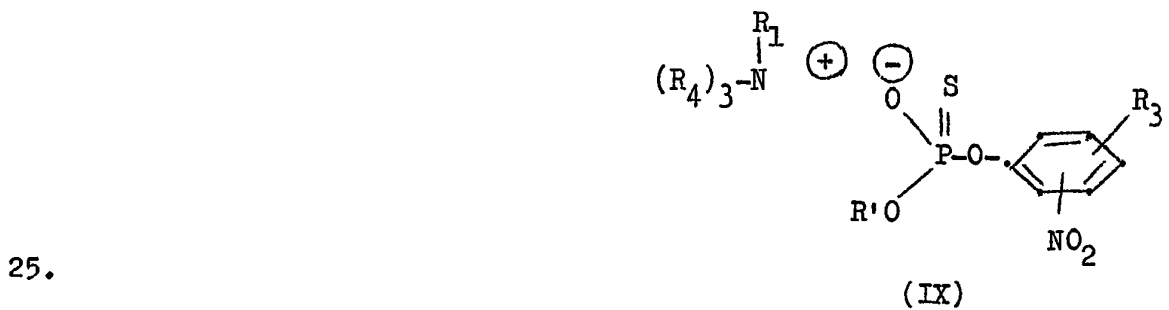
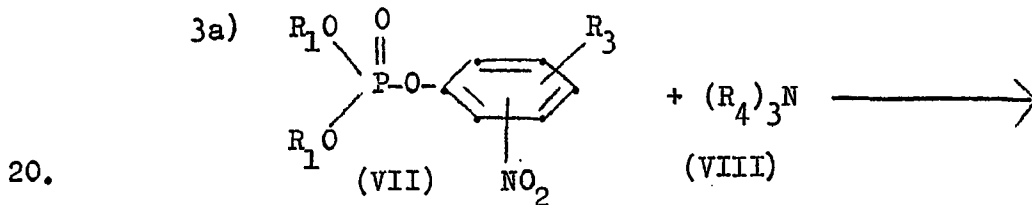
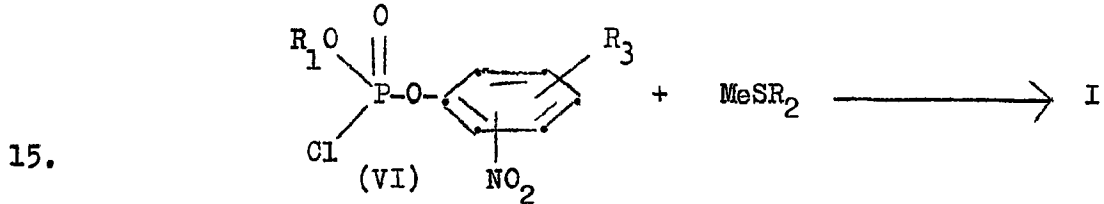
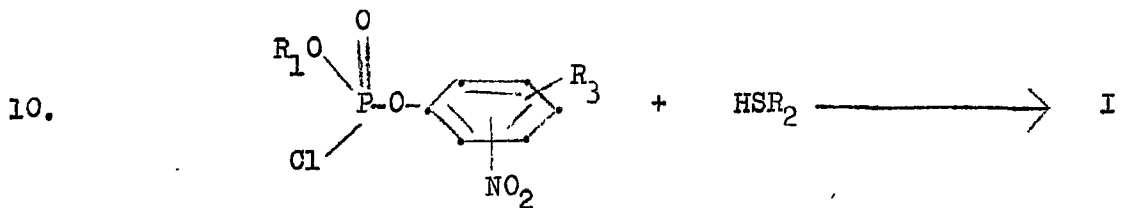
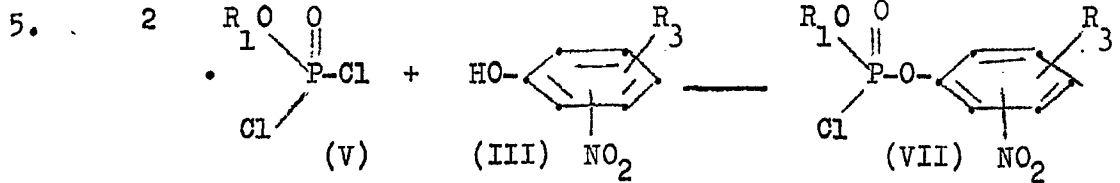
25.



409641 = 3 =

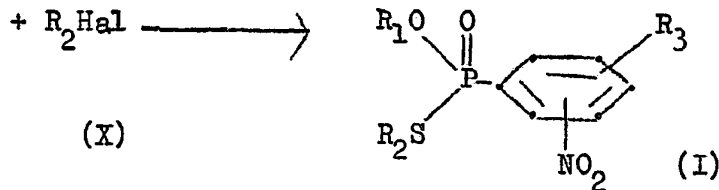


En las fórmulas II, III y IV, R_1 , R_2 y R_3 tienen la significación indicada en la fórmula I y Me representa un metal alcalino, en especial sodio o potasio, o un grupo de amonio, como por ejemplo los grupos $(R_4)_3^+NH$, en donde R_4 significa hidrógeno o alquilo.



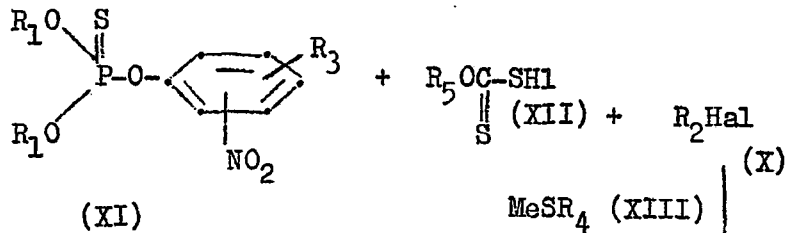
409641 = 4 =

15 01

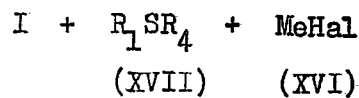
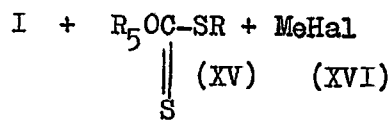
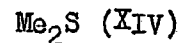
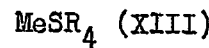


5.

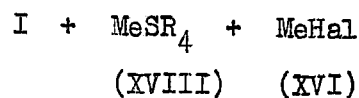
3b)



10.



15.



20.

En las fórmulas, R_1 , R_2 y R_3 tienen la significación indicada en la fórmula I, Me representa un metal alcalino, en especial sodio o potasio, o el grupo $(R_4)_3\text{-NH}^+$, en donde R_4 significa hidrógeno o alquilo, R_5 representa un radical de alquilo y Hal representa un átomo de halógeno, como cloro, bromo o yodo.

25.

En calidad de agentes aceptores de ácido pueden entrar en consideración: aminas terciarias, por ejemplo trialquilamina, bases de piridina, dialquilanilina; bases inorgánicas, como hidruros de hidróxidos; carbonatos y bi-



carbonatos de metales alcalinos y alcalino-terreos. En las reacciones es a veces necesario utilizar catalizadores, como por ejemplo cobre o cloruro de cobre. Los procedimientos 1a y 1b, 2 y 3a y 3b se realizan a la temperatura de reacción entre

5. 0°C - 130°C , a presión normal y en disolventes o diluentes.

En calidad de disolventes o diluentes son apropiados por ejemplo; los éteres y los compuestos etéreos, como el éter dietílico, el éter dipropílico, el dioxano, el tetrahidrofurano; las amidas, como las amidas de ácido carboxílico N,N-dial

10. quiladas, los hidrocarburos alifáticos, aromáticos y halogenados, en especial el benceno, el tolueno, los xilenos, el cloroformo, el clorobenceno, los nitrilos, como el acetonitrilo; DMSO, las cetonas, como la acetona, la metiletilcetona, el agua. Para los procedimientos 3a y 3b es asimismo apropiado

15. el alcohol.

Las materias de partida de las fórmulas II a XI pueden prepararse análogamente a las conocidas, por ejemplo mediante el método descrito en J. org. Chem. 30'3217 (1965).

Los compuestos de la fórmula I presentan una amplia acción biocida, y sirven por lo tanto para combatir a parásitos vegetales y animales de diversa índole y como reguladores para plantas.

20.

En forma sorprendente los compuestos de la fórmula I poseen propiedades insecticidas y acaricidas en especial mejores que los compuestos análogos conocidos, y pueden utilizarse contra todos los estadios de desarrollo como por ejemplo huevos, larvas, crisalidas, ninfas y adultos de insectos y representantes del orden acarina, como por ejemplo insectos de las familias:

25.

Tettigoniidae,
30. Gryllidae,

409641

= 5a=



5. Gryllotalpidae,
Blattidae,
Reduviidae,
Phyrrhocoridae,
Cimicidae,
Delphacidae,
Aphididae,
Diaspididae,
Pseudococcidae,
10. Scarabacidae,
Dermestidae,
Coccinellidae,
Tenebrionidae,
Chrysomelidae,
15. Bruchidae,
Tineidae,
Noctuidae,
Lymnatriidae,
Pyralidae,
20. Culcidae,
Tripulidae,
Stomoxidae,
Trypetidae,
Muscidae,
25. Calliphoridae y
Pulicidae,

asi como acáridos de las familias Ixodidae, Argasidae,
Tetranychidae y Dermanyssidae.



409641

La acción insecticida o acaricida puede ensancharse considerablemente y acomodarse a circunstancias determinadas por adición de otros insecticidas y/o acaricidas.

En calidad de aditivos son aptas, por ejemplo, las

5. materias activas siguientes, entre otras:

COMPUESTOS DE FOSFORO ORGANICOS

anhídrido de ácido bis-O,O-dietilfosfórico

(TEPP)

dimetil-(2,2,2-tricloro-1-hidroxi-etil)-fosfonato

10. (TRICHLORFON)

1,2-dibromo-2,2-dicloroetil-dimetil-fosfato

(NALED)

2,2-diclorovinil-dimetil-fosfato

(DICHLORPHOS)

15. 2-metoxycarbamil-1-metilvinil-dimetil-fosfato

(MEVINPHOS)

dimetil-1-metil-2-(metilcarbamoil)-vinil-fosfato cis

(MONOCROTOPHOS)

3-(dimetoxifosfiniloxi)-N,N-dimetil-cis-crotonamida

20. (DICROTOPHOS)

2-cloro-2-dietilcarbamoil-1-metilvinil-dimetil-fosfato

(PHOSPHAMIDON)

O,O-dietil-O (o S)-2-(etiltio)-etil-tiofosfato

(DEMETON)

25. S-(etiltioetil-O,O-dimetil-ditiofosfato

(THIOMETON)

O,O-dietil-S-etilmercaptometil-ditiofosfite

(PHORATE)

O,O-dietil-S-2-(etiltio)-etil-ditiofosfato

30. (DISULFOTON)

409641 = 7 =

15



- 0,0-dimetil-S-2-(etilsulfinil)-etil-tiofosfato
(OXYDEMETONMETHYL)
- 0,0-dimetil-S-(1,2-dicarboetixietil)-diti fosfato
(MALATHION)
5. 0,0,0,0-tetraetil-S,S'-metilen-bis-diti fosfato
(ETHION)
- 0-etil-S,S-dipropil-diti fosfato
- 0,0-dimetil-S-(N-metil-N-formilcarbamoilmetil)-diti fosfato
(FORMOTHION)
10. 0,0-dimetil-S-(N-metilcarbamoilmetil)-diti fosfato
(DIMETHOAT)
- 0,0-dimetil-O-p-nitrofenil-tiofosfato
(PARATHION-METHYL)
- 0,0-diethyl-O-p-nitrofenil-tiofosfato
15. (PARATHION)
- 0-etil-O-p-nitrofenilfenil-tiofosfonato
(EPN)
- 0,0-dimetil-O-(4-nitro-m-tolil)-tiofosfato
(FENITROTHION)
20. 0,0-dimetil-O-2,4,5-triclorofenil-tiofosfato
(RONNEL)
- 0-etil-O,2,4,5-triclorofeniletil-tiofosfonato
(TRICHLORONAT)
- 0,0-dimetil-O-2,5-dicloro-4-bromofenil-tiofosfato
25. (BROMOPHOS)
- 0,0-dimetil-O-(2,5-dicloro-4-yodofenil)-tiofosfato
(JODOFENPHOS)
- 4-tercibutil-2-clorofenil-N-metil-O-metilamidofosfato
(CRUFOMAT)
30. 0,0-dimetil-O-(3-metil-4-metilmercaptofenil)-tiofosfato



409641
(FENTHION)

isopropilamino-0-etil-(4-metilmercapto-3-metilfenil)-
fosfato

0-0-dietil-0-p-(metilsulfinil)-fenil-tiofosfato

5. (FENSULFOETHION)

0-p-(dimetilsulfamido)-fenil-0,0-dimetil-tiofosfato

(FAMPHUR)

0,0,0',0'-tetrametil-0,0'-tiodi-p-fenilenti ofosfato

0-etil-S-fenil-etil-ditiofosfonato

10. 0,0-dimetil-0-(alfa-metilbencil-3-hidroxicrotonil)-
(fosfato)

2-cloro-1-(2,4-diclorofenil)-vinil-dietil-fosfato

(CHLORFENVINPHOS)

2-cloro-1-(2,4,5-triclorofenil)-vinil-dimetil-fosfato

15. 0-2-cloro-1-(2,5-diclorofenil)-7-vinil-0,0-dietiltio-
fosfato

0,0-dietiltiofosfato de fenilglioxilonitriloxima

(PHOXIM)

0,0-dietil-0-(3-cloro-4-metil-2-oxo-2-H-1-benzopiran-

20. 7-il)-tiofosfato (COUMAPHOS)

2,3-p-dioxanditio-S,S-bis-(0,0-dietilditiofosfato)

(DIOXATHION)

5-6-cloro-2-oxo-3-benzoxazolinil)-metil-0,0-dietil-

ditiofosfato (PHOSALON)

25. 2-(dietoxifosfinilimino)-1,3-ditiolano

0,0-dimetil-S-2-metoksi-1,3,4-tiadiazol-5-(4H)-onil-

(4)-metil-ditiofosfato

0,0-dimetil-S-ftalimidometil-ditiofosfato (IMIDAN)

0,0-dietil-0-(3,5,6, tricoloro-2-piridil)-tiofosfato

409641

= 9 =



- 0,0-dietil-0-2-piraciniil-ti ofosfato
(THIONAZIN)
- 0,0-dietil-0-(2-isopropil-4-metil-5-pirimidil)-ti ofos -
fato (DIAZINON)
5. 0,0-dietil-0-(2-quinoxalil)-ti ofosfato
0,0-dimetil-S-(4-oxo-1,2,3-benzotriacin-3(4H)-il-metil)-
-di ti ofosfato (AZINPHOSMETHYL)
0,0-dietil-S-(4-oxo-1,2,3-benzotriacin-3(4H)-il-metil-
di ti ofosfato (AZINPHOSAETHYL)
10. S- $\sqrt{4,6}$ -diamino-s-triacin-2-il)-metil $\sqrt{7}$ -0,0-dimetil-diti o-
fosfato (MENAZON)
0,0-dimetil-0-(3-cloro-4-nitrofenil)-ti ofosfato
(CHLORTHION)
0,0-dimetil-0 (o S)-2-(etil ti oetil)-ti ofosfato
(DEMETON-S-METHYL)
15. Cloruro de 2-(0,0-dimetil-fosforil-ti ometil)-5-metoxi-
piron-4-3,4-diclorobencil-trifenilfosfonio
0,0-dietil-S-(2,5-diclorofenil ti ometil)-di ti ofosfato
(PHENKAPTON)
20. 0,0-dietil-0-(4-metil-cumarinil-7)-ti ofosfato
(POTASAN)
5-amino-bis-(dimetilamido)-fosfinil-3-Fenil-1,2,4-
triazol (TRIAMIPHOS)
N-metil-5-(0,0-dimetil ti ofosforil)-3-tiavaleramida
(VAMIDOTHION)
25. 0,0-dietil-0- $\sqrt{2}$ -dimetilamino-4-metilpirimidil-(6) $\sqrt{7}$ -
ti ofosfato (DIOCTHYL)
0,0-dime til-S-(metilcarbamilmetil)-ti ofosfato
(OMETHOAT)
0-etil-0-(8-quinolil)-fenil ti ofosfonato

(OXINOTHIOPHOS)

O-metil-S-metil-amidoti ofosfato

15



(MONITOR)

O-metil-O-(2,5-dicloro-4-bromofenil)-benzoti ofosfonato

5. (PHOSVEL)

O,O,O,O-tetrapropildi tiopirofosfato

3-(dimetoxifosfiniloxi)-N-metil-N-metoxi-cis-crotona-
mida

O,O-dimetil-S-(N-etilcarbamoilmetil)-diti ofosfato

10. (ETHOAT-METHYL)

O,O-dietyl-S-(N-isopropilcarbamoilmetil)-diti ofosfato

(PROTHOAT)

S-N-(1-ciano-1-metiletil)-carbamoilmetil-dietyl tiol-
fosfato (CYANTHOAT)

15. S-(2-acetamidoetil)-O,O-dimetildi ti ofosfato

triamida de ácido hexametilfosfórico

(HEMPA)

O,O-dimetil-O-(2-cloro-4-nitrofenil)-ti ofosfato

(DICAPTHON)

20. O,O-dimetil-O-p-cianofenil-ti ofosfato

(CYANOX)

O-etil-O-p-cianofenil-ti ofosfonato

O,O-dietyl-O-2,4-diclorofenil-ti ofosfonato

(DICHLOFENTHION)

25. O,2,4-diclorofenil-O-metil isopropilamido-ti ofosfato

O,O-dietyl-O-2,5-dicloro-4-bromofenil-ti ofosfato

(BROMOPHOS-AETHYL)

dimetil-p-(metiltio)-fenil-fosfato

O,O-dimetil-O-p-sulfamidofenil-ti ofosfato

O- \sqrt{p} -(p-clorofenil)-azofenil- \sqrt{p} -O,O-dimetil-ti ofosfato

409641

= 11 =

(AZOTHOAT)

150



- 0-etil-S-4-clorofenil-etil-diti ofosfonato
0-isobutil-S-p-clorofenil-etil-diti ofosfonato
0,0-dimetil-S-p-clorofenil-ti ofosfato
5. 0,0-dimetil-S-(p-clorofeniltiometil)-diti ofosfato
0,0-dietil-p-clorofenilmercaptometil-diti ofosfato
(CARBOPHENOTHION)
0,0-dietil-S-p-clorofeniltiometil-ti ofosfato
0,0-dimetil-S-(carboetoxi-fenilmetil)-diti ofosfato
10. (PHENTHOAT)
0,0-dietil-S-(carbofluoroetoxi-fenilmetil)-diti ofos-
fato
0,0-dimetil-S-(carboisopropoxi-fenilmetil)-diti ofosfa-
to
15. 0,0-dietil-7-hidroxi-3,4-tetrametilen-cumarinil-ti ofos-
fato (COUMITHOAT)
2-sulfuro de 2-metoxi-4-H-1,3,2-benzodioxafosforina
0,0-dietil-O-(5-fenil-3-isooxazolil)-ti ofosfato
2-(dietoxifosfinilimino)-4-metil-1,3-diti olano
20. Óxido de tris-(2-metil-1-aciridinil)-fosfina
(METEPA)
S-(2-cloro-1-ftalimidoetil)-0,0-dietil-diti ofosfato
N-hidroxinaftalimido-dietil-fosfato
dimetil-3,5,6-tricloro-2piridil-fosfato
25. 0,0-dimetil-O-(3,5,6-tricloro-2-piridil)-ti ofosfato
S-2-(etilsulfonil)-etil-dimetilti ol-fosfato
(DIOXYDEMETON-S-METHYL)
dietil-S-2-(etilsulfinil)-etil-diti ofosfato
(OXYDISULFOTON)
anhídrido bis-0,0-dietilti ofosfórico

409641

= 12 =



(SULFOTEP)

dimetil-1,3-di-(carbometoxi)-1-propen-2-il-fosfato
dimetil-(2,2,2-tricloro-1-butiroiloxietil)-fosfonato

(BUTONAT)

5. O,O-dimetil-O-(2,2-dicloro-1-metoxi-vinil)-fosfato
bis-(dimetilamido)-fluorofosfato

(DIMEFOX)

cloruro de 3,4-diclorobencil-trifenil-fosfonio
dimetil-N-metoximetilcarbamoilmetil-diti ofosfato

10. (FORMOCARBAM)

O,O-dietil-O-(2,2-dicloro-1-cloroetoxivinil)-fosfato
O,O-dimetil-O-(2,2-dicloro-1-cloroetoxivinil)-fosfato
O-etil-S,S-difenilditiol-fosfato
O-etil-S-bencil-fenildi ti ofosfonato

15. O,O-dietil-S-bencil-tiol-fosfato

O,O-dimetil-S-(4-clorofeniltiometil)-diti ofosfato

(METHYLCARBOPHENOTHION)

O,O-dimetil-S-(etiltiometil)-diti ofosfato
diisopropilaminofluorofosfato

20. (MIPAFox)

O,O-dimetil-S-(morfolinilcarbamoilmetil)-diti ofosfato

(MORPHOTHION)

bismetilamido-fenilfosfato

O,O-dimetil-S-(bencensulfonil)-diti ofosfato

25. O,O-dimetil-(S y O)-etilsulfoniletil-ti ofosfato

O,O-dietil-O-4-nitrofenilfosfato

disulfuro de trietoxi-isopropoxi-bis-(ti ofosfinilo)

2-óxido de 2-metoxi-4H-1,3,2-benzodioxafosforina

octametilpirofosforamida

30. (SCHRADAN)

409641



bis-(dimetoxitiofosfinilsulfuro)-fenilmetano

N,N,N',N'-tetrametildiamidofluorofosfato

(DIMEFOX)

O-fenil-O-p-nitrofenil-metantiofosfonato

5. (COLEP)

O-metil-O-(2-cloro-4-tercibutil-fenil)-N-metilamido-

tiofosfato (NARLENE)

O-etil-O-(2,4-diclorofenil)-feniltiofosfonato

O,O-di-etil-O-(4-metilmercapto-3,5-dimetilfenil)-tiofos-

10. fato

disulfuro de 4,4'-bis-(O,O-dimetiltiofosforiloxi)-

difenilo

O,O-di-(beta-cloroetil)-O-(3-cloro-4-metil-cumarinil-

7)-fosfato

15. S-(1-ftalimidoetil)-O,O-di-etildi tiofosfato

O,O-dimetil-O-(3-cloro-4-di-etilsulfamilfenil)-tiofos-

fato

O-metil-O-(2-carboisopropoxifenil)-amidotiofosfato

5-(O,O-dimetilfosforil)-6-cloro-biciclo(3.2.0)-hepta-

20. dieno-(1,5)

O-metil-O-(2-isopropoxycarbonil-1-metilvinil)-etilami-

dotiofosfato

NITROFENOLES Y DERIVADOS

4,6-dinitro-6-metilfenol, sal sódica

25. (DINITROCRESOL)

dinitrobutilfenol, (sal 2,2',2"-trietanolamínica)

2-ciclohexil-4,6-dinitrofenol

(DINEX)

2-(1-metilheptil)-4,6-dinitrofenil-crotonato

30. (DINOCAP)

409641

= 14 =



2-secubutil-4,6-dinitrofenil-3-metil-butenato
(BINAPACRYL)

2-secubutil-4,6-dinitrofenil-ciclopropionato

2-secubutil-4,6-dinitrofenil-isopropil-carbonato

5. (DINOBTION)

DIVERSOS

piretina I

piretina II

3-alil-2-metil-4-oxo-2-ciclopenten-1-il-crisantemomato

10. (ALLETHRIN)

6-cloropiperonil-crisantemomato

(BARTHIN)

2,4-dimetilbencil-crisantemomato

(DIMETHRIN)

15. 2,3,4,5-tetrahidroftalimidometil-crisantemomato

sulfuro de 4-clorobenzil-4-clorofenilo

(CHORBENSID)

6-metil-2-oxo-1,3-ditiolo- $\sqrt{4,5-b7}$ -quinoxalina

(QUINOMETHIONAT)

20. monocarboxilato de (1)-3-(2-furfuril)-2-metil-4-oxoci-

clopent-2-enil-(1)-(cis + trans)-crisantemo

(FURETHRIN)

2-pivaloil-indan-1,3-diona

(PINDON)

25. N'-(4-cloro-2-metilfenil)-N,N-dimetilformamidina

(CHLORPHENAMIDIN)

sulfuro de 4-clorobencil-4-fluorofenilo

(FLUORBENSIDE)

5,6-dicloro-1-fenoxicarbamil-2-trifluorometil-bencimi-

30. dazol (FENOZAFLOP)

409641

= 15 =



- sulfonato de p-clorofenil-p-clorobenceno
(OVEX)
- bencensulfonato de p-clorofenilo
(FENSON)
5. p-clorofenil-2,4,5-triclorofenilsulfona
(TETRADIFON)
- sulfuro de p-clorofenil-2,4,5-triclorofenilo
(TETRASUL)
- sulfuro de o-clorobencil-p-clorofenilo
10. (CHLORBENSIDE)
- 2-tio-1,3-ditiolo-(5,6)-quinoxalina
(THIOCHINOX)
- sulfito de prop-2-inil-(4-tercibutilfenoxi)-ciclohexilo
(PROPARGIL)
15. FORMAMIDINAS
- 1-dimetil-2-(2'-metil-4'-clorofenil)-formamidina
(CHORPHENAMIDIN)
- 1-metil-2-(2'-metil-4'-clorofenil)-formamidina
- 1-metil-2-(2'-metil-4'-bromofenil)-formamidina
20. 1-metil-2-(2',4'-dimetilfenil)-formamidina
- 1-n-butil-1-metil-2-(2'-metil-4'-clorofenil)-formamidina
- 1-metil-1-(2'-metil-4'-cloranilino-metileno)
- 2-(2"-metil-4"-clorofenil)-formamidina
- 1-n-butil-2-(2'-metil-4'-clorofenil-imino)-pirrolidina
25. UREAS
- N-2-metil-4-clorofenil-N',N'-dimetil-tiourea
- CARBAMATOS
- 1-naftil-N-metilcarbamato
(CARBARYL)
30. 2-butinil-4-clorofenilcarbamato



409641

- 4-dimetilamino-3,5-xilil-N-metilcarbamato
- 4-dimetilamino-3-tolil-N-metilcarbamato
(AMINOCARB)
- 4-metiltio-3,5-xilil-N-metilcarbamato
- 5. (METHIOCARB)
- 3,4,5-trimetilfenil-N-metilcarbamato
- 2-clorofenil-N-metilcarbamato
(CEMC)
- 5-cloro-6-oxo-2-norbonan-carbonitril-O-(metilcarbamoil)-
- 10. -oxima
- 1-(dimetilcarbamoil)-5-metil-3-pirazolil-N,N-dimetil-
carbamato (DIMETILAN)
- 2,3-dihidro-2,2-dimetil-7-benzofuranil-N-metilcarbamato
(CARBOFURAN)
- 15. 2-metil-2-metiltio-propionaldehido-O-(metilcarbamoil)-
oxima (ALDICARB)
- 8-quinaidil-N-metilcarbamato y sus sales
- 2-isopropil-4-(metilcarbamoiloxi)-carbanilato de metilo
- m-(1-etilpropil)-fenil-N-metilcarbamato
- 20. 3,5-di-tercibutil-N-metilcarbamato
- m-(1-metilbutil)-fenil-N-metilcarbamato
- 2-isopropilfenil-N-metilcarbamato
- 2-secubutilfenil-N-metilcarbamato
- m-tolil-N-metilcarbamato
- 25. 2,3-xilil-N-metilcarbamato
- 3-isopropilfenil-N-metilcarbamato
- 3-tercibutilfenil-N-metilcarbamato
- 3-secubutilfenil-N-metilcarbamato
- 3-isopropil-5-metilfenil-N-metilcarbamato
- 30. (PROMECARB)

4096411

= 17 =



- 3,5-diisopropilfenil-N-metilcarbamato
2-cloro-5-isopropilfenil-N-metilcarbamato
2-cloro-4,5-dimetilfenil-N-metilcarbamato
2-(1,3-dioxolan-2-il)-fenil-N-metilcarbamato
5. (DIOXACARB)
2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)-fenil-N-metilcarbamato
2-(1,3-dioxolan-2-il)-fenil-N,N-dimetilcarbamato
2-(1,3-ditiolan-2-il)-N,N-dimetilcarbamato
2-(1,3-ditiolan-2-il)-fenil-N,N-dimetilcarbamato
10. 2-isopropoxifenil-N-metilcarbamato
(ARPROCARB)
2-(2-propiniloxi)-fenil-N-metilcarbamato
3-(2-propiniloxi)-fenil-N-metilcarbamato
2-dimetilaminofenil-N-metilcarbamato
15. 2-dialilaminofenil-N-metilcarbamato
4-dialilamino-3,5-xilil-N-metilcarbamato
(ALLYXICARB)
4-benzotienil-N-metilcarbamato
2,3-dihidro-2-metil-7-benzofuranil-N-metilcarbamato
20. 3-metil-1-fenilpirazol-5-il-N,N-dimetilcarbamato
1-isopropil-3-metilpirazol-5-il-N,N-dimetilcarbamato
(ISOLAN)
2-dimetilamino-5,6-dimetilpirimidin-4-il-N,N-dimetil-
carbamato
25. 3-metil-4-dimetilaminometileniminofenil-N-metilcarbamato
3,4-dimetilfenil-4-metilcarbamato
2-ciclopentilfenil-N-metilcarbamato
3-dimetilamino-metileniminofenil-N-metilcarbamato
{FORMETANATE} y sus sales
30. 1-metiltio-etilimino-N-metilcarbamato (METHOMYL).

409641



- 2-metilcarbamoiloximino-1,3-ditiolano
- 5-metil-2-metilcarbamoiloximino-1,3-oxitiolano
- 2-(1-metoxi-2-propoxi)-fenil-N-metilcarbamato
- 2-(1-butir-3-il-oxi)-fenil-N-metilcarbamato
- 5. 1-dimetilcarbamil-1-metiltio-0-metilcarbamil-formoxima
- 1-(2'-cianoetiltio)-0-metilcarbamil-acetaldoxima
- 1-metiltio-0-carbamil-acetaldoxima
- 0-(3-secubutilfenil)-N-feniltio-N-metilcarbamato
- 2,5-dimetil-1,3-ditiolan-2-(0-metilcarbamil)-aldoxima
- 10. 0,2-difenil-N-metilcarbamato
- 2-(N-metilcarbamil-oximio)-3-cloro-biciclo/2.2.1/heptano
- 2-(N-metilcarbamil-oximio)-biciclo/2.2.1/heptano
- 3-isopropilfenil-N-metil-N-cloroacetil-carbamato
- 3-isopropilfenil-N-metil-N-metiltiometil-carbamato
- 15. 0-(2,2-dimetil-4-cloro-2,3-dihidro-7-benzofuranil)-N-metilcarbamato
- 0-(2,2,4-trimetil-2,3-dihidro-7-benzoduranil)-N-metilcarbamato
- 0-naftil-N-metil-N-acetil-carbamato
- 20. 0-5,6,7,8-tetrahidronaftil-N-metil-carbamato
- 3-isopropil-4-metiltio-fenil-N-metilcarbamato
- 3,5-dimetil-4-metoxi-fenil-N-metilcarbamato
- 3-metoximetoxi-fenil-N-metilcarbamato
- 3-aliloxifenil-N-metilcarbamato
- 25. 2-propargiloximetoxi-fenil-N-metil-carbamato
- 2-aliloxifenil-N-metilcarbamato
- 4-metoxicarbonilamino-3-isopropilfenil-N-metil-carbamato
- 3,5-dimetil-4-metoxicarbonilamino-fenil-N-metil-carbamato
- 2-gamma-metiltiopropilfenil-N-metilcarbamato
- 30. 3-(alfa-metoximetil-2-propenil)-fenil-N-metil-carbamato

409641 = 19 =



- 2-cloro-5-tercibutil-fenil-N-metil-carbamato
4-(metil-propargilamino)-3,5-xilil-N-metil-carbamato
4-(metil-gamma-cloralilamino)-3,5-xilil-N-metil-carbamato
N-(metil-beta-cloralilamino)-3,5-xilil-N-metil-carbamato
5. 1-(beta-etoxi carboniletil)-3-metil-5-pirazolil-N,N-dime-
til-carbamato
3-metil-4-(dimetilamino-metilmercapto-metilenimino)-fe-
nil-N-metilcarbamato
clorhidrato de 1,3-bis-(carbamoiltio)-2-(N,N-dimetilami-
10. no)-propano
5,5-dimetilhidrorresorcinoldimetilcarbamato
2- $\sqrt{\text{etil-propargilamino}}$ -fenil-N-metilcarbamato
2- $\sqrt{\text{metil-propargilamino}}$ -fenil-N-metilcarbamato
2- $\sqrt{\text{dipropargilamino}}$ -fenil-N-metilcarbamato
15. 4- $\sqrt{\text{dipropargilamino}}$ -3-tolil-N-metilcarbamato
4- $\sqrt{\text{dipropargilamino}}$ -3,5-xilil-N-metilcarbamato
2- $\sqrt{\text{alil-isopropilamino}}$ -fenil-N-metilcarbamato
3- $\sqrt{\text{alil-isopropilamino}}$ -fenil-N-metilcarbamato

HIDROCARBUROS CLORADOS

20. gamma-hexaclorociclohexano
(GAMMEXANE, LINDAN, GAMMA-HCH)
1,2,4,5,6,7,8,8-octacloro-3alfa-4,7,7alfa'-tetrahidro-
4,7-metilenindano (CHLORDAN)
1,4,5,6,7,8,8-heptacloro-3alfa-4,7,7alfa-tetrahidro-
25. 4,7-metilenindano (HEPTACHLOR)
1,2,3,4,10,10-hexacloro-1,4,4alfa,5,8,8alfa-hexahidro-
endo-1,4-exo-5,8-dimetanonaftalina (ALDRIN)
1,2,3,4,10,10-hexacloro-6,7-epoxi-1,4,4alfa,5,6,7,8,8al-
fa-octahidro-exo-1,4-endo-5,8-dimetanonaftalina
30. (DIELDRIN)

409641

= 20 =

15 DIC



1,2,3,4,10,10-hexacloro-6,7-epoxi-1,4,4alfa,5,6,7,8,8
alfa-octahidro-endo-endo-5,8-dimetanonaftalina
(ENDRIN).

5. Las materias activas de la fórmula I son asi-
mismo apropiadas para combatir representantes de la divi-
sión Thallophyta, como por ejemplo virus, bacterias y hongos.
Asi poseen propiedades fungicidas frente a hongos fito-
patógenos en plantas de cultivo de diversa índole, como
cereales, maiz, arroz, hortalizas, plantas ornamentales,
10. árboles frutales, vides, frutos del campo, etc.

- Con las nuevas materias activas pueden atajarse o
aniquilarse los hongos que aparecen en los frutos, las
flores, las hojas, los tallos, los bulbos y las raices,
con lo cual se exoneran también de tales hongos las par-
tes de los vegetales que crecen más tarde. Las materias
15. activas de la fórmula I son eficaces especialmente con-
tra los hongos fitopatógenos pertenecientes a las clases
siguientes:

20. Oomicetos,
Cigomicetos,
Ascomicetos,
Basidiomicetos y
Denteromicetos.

25. Por otra parte, las nuevas materias activas pueden
utilizarse para el tratamiento de las semillas, los fru-
tos, los tubérculos, etc., con el fin de protegerlos de
las infecciones micóticas, por ejemplo por hongos necró-
ticos de cualquier clase, como los ustilaginales, por
ejemplo del tipo Ustilago, Tilletia, Urocystis, Turbur-

409641

= 21 =



cinia y Phoma.

Para ensanchar el espectro de acción, a las materias activas de la fórmula I, además de los acaricidas e insecticidas mencionados antes, pueden mezclarse también

5. por ejemplo, bactericidas, fungistáticos, bacteriostáticos, nematocidas y/o por ejemplo los fungicidas siguientes:
- acetato de dodecilguanidina (DODINE)
pentacloronitrobenzeno (QUINTOZENE)
10. pentaclorofenol (PCP)
2-(1-metil-n-propil)-4,6-dinitrofenil-2-metilcrotonado
(BINAPACRYL)
2-(1-metil-n-heptil)-4,6-dinitrofenilcrotonado
(DINOCAP)
15. 2,6-dicloro-4-nitroanilina (DICHLORAN)
2,3,5,6-tetracloro-benzoquinona-(1,4)
(CHLORANIL)
2,3-dicloro-naftoquinona-(1,4) (DICHLONE)
N-(triclorometiltio)-ftalimida (FOLPET)
20. N-(triclorometiltio)ciclohex-4-endo-1,2-dicarboximida
(CAPTAN)
N-(1,1,2,2-tetracloroetiltio)ciclohex-4-en-1,2-dicarboximida (CAPTAFOL)
N-metilsulfonal-N-triclorometiltio-cloroanilina
25. N'-diclorofluormetiltio-N-metil-N'-fenilsulfamina
(DICHLORFLUAMID)
O-etil-S-bencil-fenilditiofosfato
O,O-dietil-S-bencil-tiolfosfato
etilen-1,2-bis-ditiocarbamato disódico (NABAM)

409641 = 22 =



etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de cinc

(ZINEB)

etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de manganeso (II)

(MANEB)

disulfuro de tetrametiltiuram

5. (THIRAM)

1-oxi-3-acetil-6-metil-ciclohexen-(5)diona-(2,4)

(ACIDO DEHIDROACETICO)

8-hidroxi-quinolina (8-QUINOLINOL)

2-dimetilamino-6-metil-5-n-butil-4-hidroxi-pirimidina

10. metil-N-bencimidazol-2-il-N-(butilcarbamoil) carbamato

(BENOMYL)

2-etilamino-6-metil-5n-butil-4-hidroxipirimidina

2,3-diciano-1,4-ditia-antraquinona

(DITHIANON)

15. 2-(4-tiazolil)-bencimidazol

3,5-dimetiltetrahidro-1,3,5-tiadiacin-2-tiona

(DAZOMET)

2,3-dihidro-5-carboxanilido-6-metil-1,4-oxatina

alcohol pentaclorobencilico,

20. Además, los compuestos de la fórmula I pueden utilizarse para combatir nemátodos fitopatógenos.

Los compuestos de la fórmula I pueden emplearse solos o junto con vehículos apropiados y/o materias suplementarias apropiadas. Los vehículos apropiados y las materias suplementarias apropiadas pueden ser sólidos o líquidos y corresponden a las materias usuales en la técnica de las formulaciones, como, por ejemplo, mate-

25.

409641

= 23 =



1972

rias naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, humectantes, fijadores, espesantes, aglomerantes y/o abonos.

- Para la aplicación, los compuestos de la fórmula I pueden elaborarse en forma de agentes de espolvoreo, concentrados de emulsión, granulados, dispersiones, sprays, soluciones o suspensiones en la formulación usual que pertenece al conocimiento común de la técnica de las aplicaciones. Cabe citar además los "cattle dips" o baños de ganado y los "sprays races" o pasos de rociadura, en los que se emplean preparaciones acuosas.

- La preparación de agentes para este invento se realiza de manera ya conocida, por mezcla y molturación íntimas de las materias activas de la fórmula I con materias de vehículo apropiadas, eventualmente con adición de dispersantes o disolventes que sean inertes respecto a las materias activas. Estas pueden hallarse y aplicarse en las formas de elaboración siguientes :

- 20. - preparaciones sólidas : agentes de espolvoreo, agentes de esparcimiento, granulados, granulados de envoltura, granulados de impregnación y granulados homogéneos;
- 25. - preparaciones líquidas :
 - a) concentrados de materia activa dispersables en agua: polvo para aspersiones (polvos humectables), pastas y emulsiones;

409641



b) soluciones.

- Para la composición de preparaciones sólidas (agentes de espolvoreo, agentes de esparcimiento, etc.) se mezclan las materias activas con materias de vehículo inertes. En calidad de materias de vehículo entran en cuenta, por ejemplo, el caolín, el talco, el bol, el loes, la creta, la piedra caliza, la calcita, el ataclay, la dolomita, la tierra fósil, el ácido silícico precipitado, los silicatos alcalinotérreos, los silicatos de aluminio sódicos y potásicos (feldespatos y mica), los sulfatos de calcio y de magnesio, el óxido de magnesio, materias sintéticas molidas, abonos (como el sulfato amónico, el fosfato amónico, el nitrato amónico y la urea), productos vegetales molidos (como harina de cereales, harina de corteza de árbol, aserrín de madera y harina de cáscara de nuez), polvo de celulosa, residuos de las extracciones de vegetales, carbón activo, etc., separadamente o en mezclas entre sí.
- 5.
- 10.
- 15.

- Los granulados pueden prepararse muy sencillamente disolviendo una materia activa de la fórmula I en un disolvente orgánico, aplicando la solución así obtenida a un mineral granulado (por ejemplo, atapulgita, SiO_2 , granicalcio, bentonita, etc.) y evaporando luego el disolvente orgánico.
- 20.

- También pueden prepararse granulados de polímeros, para lo cual se mezclan las materias activas de la fórmula I con compuestos polimerizables (urea/formaldehído, diciandiamida/formaldehído, melamina/formaldehído u otros) y a continuación se efectúa una polimeriza -
- 25.

409641

= 25 =



- ción conservadora, que deja intactas las sustancias ac -
tivas y en la que, durante la formación del gel todavía,
se realiza la granulación. Más favorable es impregnar
con las materias activas, en forma, por ejemplo, de sus
5. soluciones (en un disolvente de punto de ebullición ba -
jo), granulados listos de polímeros porosos (urea/for -
maldehído, poliacrilonitrilo, poliéster u otros), de su -
perficie determinada y relación favorable y determinable
previamente de adsorción/desorción, y expulsar luego el
10. disolvente. Tales granulados de polímeros pueden tam -
bien esparcirse en forma de microgranulados (preferen -
temente con peso específico aparente de 300 g a 600 g
por litro) por medio de espolvoreadores. El espolvoreo
sobre zonas extensas de cultivo de plantas útiles puede
15. realizarse con ayuda de aviones.

Los granulados son asequibles también por
compactación del material de vehículo con las materias
activas y las suplementarias y desmenuzación consecutiva.

- A estas mezclas pueden agregarse además su -
20. plementos estabilizadores de la materia activa y/o mate -
rias no iónicas, anionactivas y cationactivas, que mejo -
ren, por ejemplo, la adherencia de las materias activas
a las plantas y a las partes de los vegetales (fijadores
y adhesivos) y/o aseguren mejor humectabilidad (humectan -
25. tes) y mejor dispersabilidad (dispersantes).

Entran en cuenta, por ejemplo, las materias
siguientes: mezcla de oleína y cal; derivados de la ce -
lulosa (metilcelulosa, carboximetilcelulosa, etc.); éte -
res hidroxietilenglicólicos de mono- y di-alquifenoles
con 5 a 15 radicales de óxido de etileno por molécula y



409641

- 8 o 9 átomos de carbono en el radical alquílico, ácido ligninsulfónico y sus sales alcalinas y alcalinotérreas; éteres polietilenglicólicos ("carbowaxes"); éteres poliglicólicos de alcohol graso con 5 a 20 radicales de óxido de etileno por molécula y 8 a 18 átomos de carbono en la parte de alcohol graso; productos de condensación de óxido de etileno con óxido de propileno; polivinilpirrolidonas; alcoholes polivinílicos; productos de condensación de urea/formaldehído; y productos de látex.
- 5.
10. Los concentrados de materia activa dispersables en agua, o sea los polvos de aspersiones (polvos humectables), las pastas y los concentrados de emulsión, constituyen agentes que pueden diluirse con agua hasta cualquier concentración que se desee. Constan
15. de materia activa, materia de vehículo, eventuales aditivos que estabilicen la materia activa, sustancias tensioactivas y agentes antiespumantes y eventualmente disolventes.
20. Los polvos para aspersiones (polvos humectables) y las pastas se obtienen mezclando y moliendo hasta homogeneidad las materias activas con agentes dispersantes y materias de vehículo pulverulentas, en dispositivos apropiados. En calidad de materias de vehículo entran en cuenta, por ejemplo, las que se han mencionado
25. antes para las preparaciones sólidas. En muchos casos es ventajoso emplear mezclas de diversas materias de vehículo. En calidad de dispersantes pueden emplearse, por ejemplo: productos de condensación de naftalina sulfonada y derivados de naftalina sulfonada con formaldehído.

409641



- do; productos de condensación de la naftalina o de los ácidos naftalinsulfónicos con fenol y formaldehido; sales alcalinas, amónicas y alcalinotérreas del ácido ligninsulfónico; sulfonatos de alquilarilo; sales alcalinas y alcalinotérreas del ácido dibutilnaftalinsulfónico; sul-
5. gatos de alcohol graso, como las sales de hexadecanoles, heptadecanoles y octadecanoles sulfatados y las sales de éteres glicólicos sulfatados de alcohol graso, la sal sódica de la oleilmetiltaurida; los acetilenglicoles
10. diterciarios, el cloruro de dialquildilaurilamonio y las sales alcalinas y alcalinotérreas de ácido graso.

En calidad de agentes antiespumantes entran en consideración, por ejemplo los aceites de silicona.

- Las materias activas se mezclan, muelen, criban y homogeneizan con los suplementos reseñados antes
15. de manera que en los polvos para aspersiones la porción sólida no rebase de un tamaño granular de 0,02 a 0,04 mm y, en las pastas, de 0,03 mm. Para preparar concentrados de emulsión y pastas se emplean agentes dispersantes como
20. los que se han señalado en los párrafos anteriores, disolventes orgánicos y agua. En calidad de disolventes están indicados, por ejemplo, los alcoholes, el benceno, los xilenos, el tolueno, el sulfóxido de dimetilo y las fracciones de aceite mineral que hierven en el intervalo
25. de 120° a 350°C. Los disolventes deben ser prácticamente inodoros no fitotóxicos e inertes respecto a las materias activas.

Los agentes de este invento pueden aplicarse además en forma de soluciones. Para ello se disuel-

409641 = 28 =



- ve la materia activa, o varias de las materias activas, de la fórmula general I en disolventes orgánicos apropiados, mezclas de disolventes o agua. En concepto de disolventes orgánicos pueden emplearse, solos o en mezcla entre sí, hidrocarburos alifáticos y aromáticos, sus derivados clorados, alquilnaftalinas o aceites minerales.
- 5.

- El contenido de materia activa en los agentes que se han descrito antes se halla entre 0,1 y 95 %; pero cabe señalar que en la aplicación desde aviones o por medio de otros dispositivos de aplicación adecuados pueden utilizarse concentraciones hasta el 99,5% o incluso la materia activa pura.
- 10.

Las materias activas de la fórmula I pueden formularse, por ejemplo, de la manera siguiente :

15. Agentes de espolvoreo:

Para preparar a) un agente de espolvoreo al 5% y b) un agente de espolvoreo al 2% se emplean las materias siguientes :

- 20.
- a) 5 partes de materia activa y
95 partes de talco;
 - b) 2 partes de materia activa,
1 parte de ácido silícico muy disperso y
97 partes de talco.

25. Se mezclan las materias activas con las materias de vehículo y se muele.

Granulado:

Para preparar un granulado al 5% se emplean las materias siguientes :

- 5 partes de materia activa,
- 0,25 partes de epiclorohidrina,

409641

= 29 =



0,25 partes de éter cetil-poliglicólico,
3,50 partes de polietilenglicol y
91 partes de caolín (tamaño granular :
0,3 a 0,8 mm).

5. Se mezcla la sustancia activa con la epi -
clorohidrina, se disuelve la mezcla con 6 partes de ace -
tona y luego se añaden el polietilenglicol y el éter ce -
til-poliglicólico. La solución así obtenida se rocía so -
bre el caolín y a continuación se evapora la acetona en
10. vacío.

Polvos para aspersiones:

Para la preparación de

- a) un polvo para aspersiones al 40%,
b) y c) un polvo para aspersiones al 25% y
15. d) un polvo para aspersiones al 10%,
se emplean los ingredientes siguientes :
a) 40 partes de materia activa,
5 partes de sal sódica del ácido ligninsulfónico,
1 parte de sal sódica del ácido dibutilnaftalin-
20. sulfónico y
54 partes de ácido silícico;
b) 25 partes de materia activa,
4,5 partes de ligninsulfonato cálcico,
1,9 partes de una mezcla de 1:1 de creta de
25. Champagne e hidroxietilcelulosa,
1,5 partes de dibutil-naftalin-sulfonato
sódico,
19,5 partes de ácido silícico,

409641

= 30 =



- 19,5 partes de creta de Champagne y
28,1 partes de caolín;
5. c) 25 partes de materia activa,
2,5 partes de isooctilfenoxi-polioxietilen-
etanol,
1,7 partes de una mezcla 1:1 de creta de
Champagne e hidroxietilcelulosa,
8,3 partes de silicato sódico de aluminio,
16,5 partes de kieselgur y
10. 46 partes de caolín;
- d) 10 partes de materia activa,
3 partes de una mezcla de sales sódicas de
sulfatos de alcohol graso saturado,
5 partes de condensado de ácido naftalinsul -
fónico y formaldehído y
15. 82 partes de caolín.

Se mezclan íntimamente las materias activas
con las materias suplementarias en mezcladoras apropia -
das y se muele la mezcla en molinos y laminadoras a pro -
pósito. Se obtienen así polvos para aspersiones que pue -
den diluirse con agua para formar suspensiones de cual -
quier concentración que se desee.

Concentrados emulgibles:

Para preparar

25. a) un concentrado emulgible al 10% y
b) un concentrado emulgible al 25%,
se emplean las materias siguientes :
- a) 10 partes de materia activa,
3,4 partes de aceite vegetal epoxidado,
13,4 partes de un emulgente de combinación cons -

409641

= 31 =



- tituido por éter poliglicólico de alcohol
graso y sal cálcica de sulfonato de alquil-
arilo,
- 40 partes de dimetilformamida y
5. 43,2 partes de xileno;
- b) 25 partes de materia activa,
2,5 partes de aceite vegetal epoxidado,
10 partes de una mezcla de sulfonato de alquil -
arilo y éter poliglicólico de alcohol graso,
10. 5 partes de dimetilformamida y
57,5 partes de xileno.

De estos concentrados pueden prepararse, por
dilución con agua, emulsiones de cualquier concentración
que se desee.

15. Agentes para rociadura :

Para preparar un agente de rociadura al 5%
se emplean los ingredientes siguientes :

- 5 partes de materia activa,
1 parte de epiclorohidrina y
20. 94 partes de bencina (de intervalo de ebulli-
ción 160 a 190° C).

Ejemplo 1

Ester de ácido O-etil-S-n-propil-O-(3-nitrofenil)-tiol-
fosfórico

25. Se disuelven 18,1 g de m-nitrofenol en 150 cc
de benceno, luego se adicionan 13,3 g de trietilamina. A
10-15°C se adiciona a gotas bajo agitación constante 26,4
g de éster de ácido O-etil-S-n-propilclorotiofosfórico.
Después de 12/ horas de agitación a temperatura ambiente se la-

409641

= 32 =

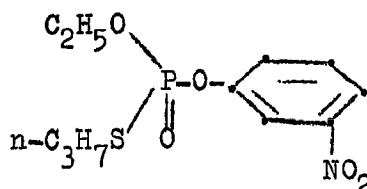
15 DI



va con agua, solución al 3% de Na_2CO_3 y de nuevo con agua y se seca sobre sulfato sódico exento de agua.

El benceno se destila. Tras la destilación molecular del residuo se obtiene a $135^\circ\text{C}/0,001$ torr el compuesto de la fórmula

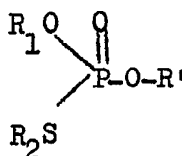
5.

 $n_D^{25} : 1,5332$

10.

En forma análoga se preparan asimismo los compuestos siguientes:

15.



20.

R_1	R_2	R'	Datos físicos
$-\text{C}_2\text{H}_5$	$-\text{C}_3\text{H}_7(n)$		$n_D^{25} : 1,5374$
$-\text{C}_2\text{H}_5$	$-\text{C}_4\text{H}_9(n)$		$n_D^{25} : 1,5272$
$-\text{C}_2\text{H}_5$	$-\text{C}_5\text{H}_{11}(n)$		$n_D^{25} : 1,5248$
$-\text{C}_2\text{H}_5$	$-\text{C}_4\text{H}_9(n)$		$n_D^{25} : 1,5263$

409641

= 33 =



	R ₁	R ₂	R'	Datos físicos
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		n _D 25 : 1,5256
5.	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		n _D 25 : 1,5229
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		n _D 25 : 1,5233
	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		
10.	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		n _D 25 : 1,5233
	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		n _D 25 : 1,5366
15.	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		n _D 25 : 1,5442
	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)		n _D 23 : 1,5409
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
20.	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
25.	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		
	-C ₂ H ₅	-C ₅ H ₁₁ (n)		

409641

= 34 =



Ejemplo 2

A) Acción insecticida por ingestión

5. Se rociaron unas plantas de tabaco y de patata con una emulsión acuosa de materia activa al 0,05% (obtenida a partir de un concentrado de emulgible al 10%).

10. Una vez seca la empañadura, se poblaron las plantas de tabaco con orugas de falena (*Spodoptera litoralis*) y las plantas de patata con larvas del escarabajo de la patata (*Leptinotarse decemlineata*). La prueba se efectuó a 24°C y con 60% de humedad relativa del aire.

Los compuestos según el ejemplo 1 mostraron en esta prueba acción tóxica por ingestión contra *Spodoptera litoralis* y *Leptinotarsa decemlineata*.

B) Acción insecticida sistémica

15. Para comprobar la acción sistémica, se mojaron en una solución acuosa de materia activa al 0,01% (obtenida a partir de un concentrado emulgible al 10%) unas plantas de haba (*Vicia faba*) enraizadas. Al cabo de 24 horas, se poblaron con pulgones (*Aphis fabae*) las partes aéreas de las plantas. Mediante un dispositivo especial, los animales se mantuvieron protegidos de la acción por contacto y de la acción gaseosa. La prueba se realizó a 24°C y con 70% de humedad relativa del aire.

20.

25. En las pruebas anteriores, los compuestos según el ejemplo 1 mostraron acción insecticida por ingestión y acción insecticida sistémica.

Ejemplo 3

Acción contra *Chilo suppressalis*

En macetas de plástico que tenían 17 cm de diáme-

409641

= 35 =



tro superior se plantaron cada vez 6 plantas de arroz de la especie Caloro, que se cultivaron hasta alcanzar 60 cm aproximadamente de altura. La infestación con larvas de *Chilo suppressalis* (L₁; 3 a 4 mm de longitud) se efectuó 2 días después de la aplicación de la materia activa en forma de granulado (cantidad de empleo: 8 kg de sustancia activa por hectárea) en el agua de arrozal. La evaluación de la acción insecticida se realizó 10 días después de aplicar el granulado.

10. Los compuestos según el ejemplo 1 resultaron en esta prueba eficaces contra *Chilo suppressalis*.

Ejemplo 4

Acción contra insectos del suelo

Se mezcló homogéneamente tierra de estiércol esterilizado con un polvo para rociadura que contenía 25% de materia activa, de modo que resultara una cantidad de aplicación de 8 kg de sustancia activa por hectárea.

Con la tierra así tratada se pusieron plantas jóvenes de pepino (*Cucumis pepo*) en macetas de plástico (de 7 cm de diámetro; tres plantas por maceta). Inmediatamente después se infestó cada maceta con 5 larvas de *Aulacophora femoralis* y respectivamente con larvas de *Pachymoda* o *Chortophila*. Los controles se realizaron a los 4, 8, 16 y 32 días después de la depositación de las larvas.

25. Cuando en el primer control se comprobó un exterminio del 80 al 100%, se efectuó una segunda infestación con cinco larvas cada vez, en la misma muestra de tierra y con tres nuevas plantas de pepino. Cuando la acción resultó ser menor del 80%, se dejaron en la tierra de en-

409641

= 36 =

15



5. sayo hasta el control siguiente los animales que habían quedado. Cuando con una cantidad de aplicación de 8 kg/ha una substancia produjo 100% de exterminio, se procedió a una nueva prueba con 4 y respectivamente 2 kg de substancia activa por hectárea.

Los compuestos según el ejemplo 1 mostraron en esta prueba acción contra las larvas de Aulacophora femoralis, Pachmoda y Chlortophila.

Ejemplo 5

10. Acción contra las garrapatas

A) Rhipicephalus bursa

15. Se depositaron cada vez en un tubito de vidrio 5 garrapatas adultas o respectivamente 50 larvas de garrapata y se las sumergió por 1 a 2 minutos en 2 cc de una emulsión acuosa de una serie de dilución con 100, 10, 1, y 0,1 ppm de sustancia de ensayo cada vez. Luego se tapó el tubito con una torunda de algodón normalizada y se le puso cabeza abajo, para que la emulsión de materia activa fuera absorbida por la guata.

20. La evaluación se efectuó para los adultos al cabo de 2 semanas y para las larvas al cabo de 2 días. Para cada ensayo se realizaron dos repeticiones.

B) Boophilus microplus (larvas)

25. Con una serie de dilución análoga a la de la prueba A, se realizaron ensayos con 20 larvas cada vez sensibles u PO-resistentes. (La resistencia se refiere a la tolerancia de la diacina).

Los compuestos según el ejemplo 1 resultaron eficaces en estas pruebas, contra los adultos y las larvas de

409641

= 37 =



Rhipicephalus bursa y las larvas sensibles u OP-resistentes de Boophilus microplus.

Ejemplo 6

Acción acaricida

5. 12 horas antes de la prueba de la acción acaricida, se cubrieron con un trozo de hoja infestada, procedente de una cria en masa de Tetranychus urticae, unas plantas de habichuela enana (phaseolus vulgaris). Los eg
10. tados móviles trasplantados se pulverizaron con los preparados de ensayo emulsionados valiéndose de un pulverizador de cromatografía, de modo que no se llegara al chorreo del caldo de aspersion. Al cabo de 2 a 7 días se evaluaron bajo el binocular los individuos vivos y muertos de larvas, adultos y huevos y se expresó el resultado en tanto
15. por ciento. Durante el "tiempo de permanencia" las plantas tratadas se mantuvieron a 25°C en cabinas de invernadero.

- Los compuestos según el ejemplo 1 resultaron eficaces en esta prueba contra los adultos, las larvas y los
20. huevos de Tetranychus urticae.

Ejemplo 7

Acción contra los nemátodos del terreno

- Para comprobar la acción contra los nemátodos del terreno, se añadieron las materias activas, en la concentración indicada en cada caso, en tierra infestada por
25. nemátodos de agallas radiculares (Meloidogyne arenaria) y se mezcló íntimamente. En la tierra así preparada, en una serie de ensayo, se plantaron inmediatamente después plantones de tomate y, en otra serie de ensayo, se sembra

409641

= 38 =

409641



ron al cabo de 8 días de espera semillas de tomate.

Para juzgar la acción nematocida, al cabo de 28 días de la plantación o respectivamente de la siembra se recontaron las agallas existentes en las raíces.

5. Las materias activas según el ejemplo 1 mostraron en esta prueba buena acción contra *Meloidogyne arenaria*.

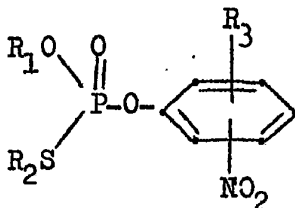
= . . =

N O T A

10. Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones con prioridad de las solicitud de patentes suizas núms. 18439/71 del 16.12.71 y 15728/72 del 27.10.72.

1. Procedimiento para la preparación de ésteres de ácido nitrofeniltiolfosfórico, de actividad antiparasitaria, de la fórmula

15.



20.

en la que

R_1 significa metilo o etilo,

R_2 significa n-propilo, n-butilo o n-pentilo, y

R_3 significa hidrógeno, metilo o cloro.

caracterizado porque se deja reaccionar un compuesto de

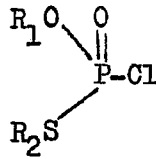
25.

la fórmula

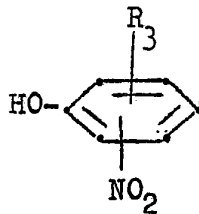
409641

= 39 =

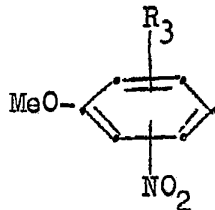
409641



5. o en presencia de un agente aceptor de ácido con un compuesto de la fórmula



10. o, sin agente aceptor de ácido, con un compuesto de la fórmula



15.

en las que

R_1 a R_3 tienen la significación indicada antes,

y

20.

Me representa un metal monovalente o el grupo $(R_4)_3\text{NH}$, en donde R_4 significa (+) ca hidrógeno o alquilo.

25.

2. Procedimiento para la preparación de ésteres de ácido nitrofeniltiolfósforico.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 40 páginas foliadas y

409641

= 40 =

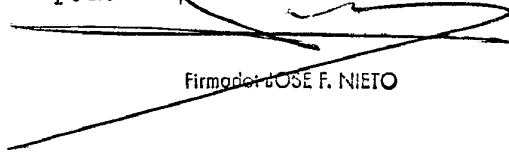
409641



escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 15 Diciembre 1972
JAIME ISERN

p.a. p.p.



Firmado por JOSE F. NIETO

