

Case 5-8076/1+2/=



Int. Cl: COFF 412702

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

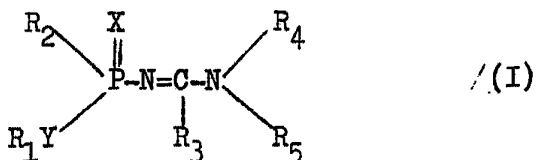
por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE DERIVADOS DE N-FOSFORIL- y N-FOSFORIL-AMIDINAS", a favor de la firma suiza CIBA-GEIGY AG, residente en BASILEA (Suiza).

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a N-fosforil-amidinas, N-fosforotionilamidinas, N-fosfonilamidinas o N-fosfonotionil-amidinas, al procedimiento para su preparación y a su utilización para combatir a los parásitos.

5. Las amidinas tienen la fórmula



10. en la que

$R_1$  representa fenilo, fenilo substituido de 1 a 3 veces mediante halógeno, de 1 a 2 veces median-

412702



- te alquilo de  $C_1-C_4$ , alquiltio de  $C_1-C_4$ , nitro, ciano o trifluorometilo o una vez mediante carbalcoxilo de  $C_1-C_4$ ,
5.  $R_2$  significa metilo, metoxilo, etilo, etoxilo o fenilo,
- $R_3$  significa hidrógeno o metilo,
- $R_4$  y  $R_5$  representan metilo, etilo, n-propilo, isopropilo o alilo,
- X e Y significan oxígeno o azufre, o
10.  $R_4$  y  $R_5$  forman con el átomo de nitrógeno, al que están enlazados, el anillo morfolino, piperidino o pirrolidino o
- $R_3$  con  $R_4$  o  $R_5$  forman un anillo pentagonal o hexagonal saturado, en donde entonces el grupo  $R_4$  o  $R_5$  que no participa en la formación del anillo, representa metilo o etilo.
- 15.
- Los grupos de alquilo  $C_1-C_4$ , alquiltio de  $C_1-C_4$  y carbalcoxilo de  $C_1-C_4$  que entran en consideración en
20. dical  $R_1$  pueden ser ramificados o de cadena rectilínea
- Ejemplo de tales grupos son, entre otros: metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, i-butilo, secubutilo, tercibutilo, metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, carbometoxilo, carboetoxilo, isopropoxicarbonilo.
- 25.

Bajo halógeno es de comprender fluor, cloro, bromo o yodo, en especial cloro, bromo o yodo.

A causa de su acción son ventajosos los compues-

412702



973

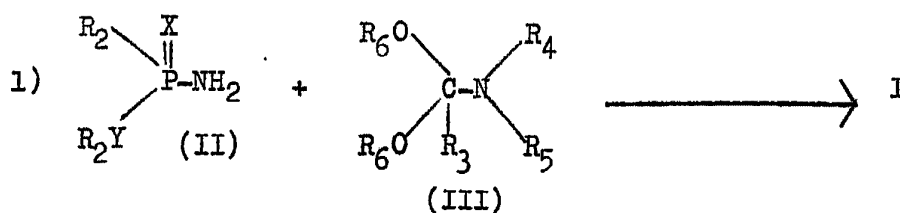
tos de la fórmula I, en la que

- 5.  $R_1$  significa los grupos 3-metil-4-metiltiofenilo, 4-nitrofenilo, 3-metil-4-nitrofenilo, 2,5-dicloro-4-bromofenilo, 2,5-dicloro-4-yodofenilo, 4-metilfenilo, 2,4-dibromo-5-clorofenilo, 2,4,5-triclorofenilo, 3-clorofenilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-metiltiofenilo, 4-clorofenilo o 4-cianofenilo,
- 10.  $R_2$  significa metilo, metoxilo, etilo o etoxilo,  
 $R_3$  significa hidrógeno,  
 $R_4$  y  $R_5$  significan metilo o etilo o  
 $R_4$  y  $R_5$  forman junto con el átomo de nitrógeno al que están enlazados, el anillo morfolino, piperidino o pirrolidino,
- 15. X significa azufre y  
Y significa oxígeno.

Un grupo especialmente ventajoso lo forman los compuestos de la fórmula I, en la que

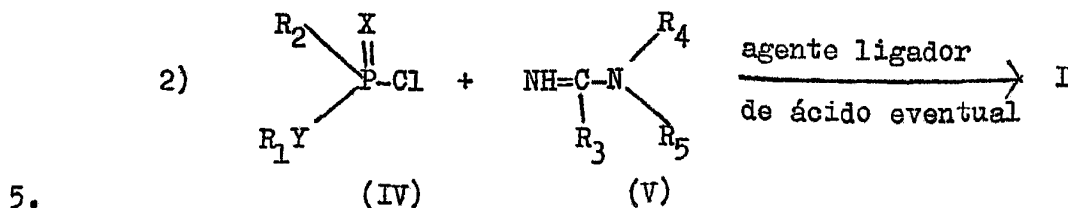
- 20.  $R_1$  significa el grupo de 3-metil-4-metiltio.  
 $R_2$  significa metilo, metoxilo, etilo o etoxilo,  
 $R_3$  significa hidrógeno,  
 $R_4$  y  $R_5$  significan metilo o etilo,  
X significa azufre y  
Y significa oxígeno.

- 25. Los compuestos de la fórmula I pueden prepararse según métodos conocidos, como sigue:





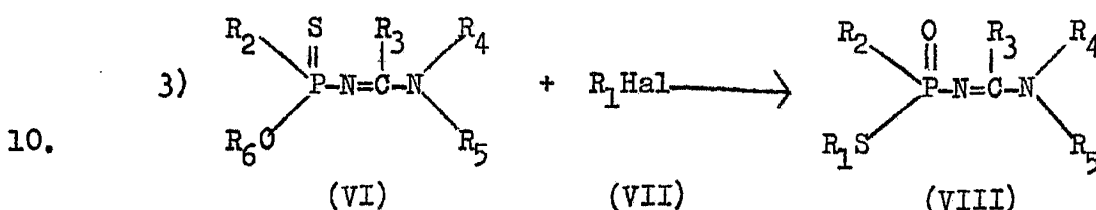
Temperatura de reacción -50 C a + 100°C



5.

Temperatura de reacción -50°C a +100°C

transformación



10.

15. En las fórmulas II a VIII,  $R_1$  a  $R_5$ , X e Y tienen la significación indicada bajo la fórmula I,  $R_6$  representa alquilo de  $C_1-C_4$  y Hal representa cloro, bromo, yodo o el radical de un éster de ácido sulfúrico.

20. En calidad de agentes ligadores de ácidos pueden entrar en consideración aminas terciarias, por ejemplo trialquilaminas, piridina, bases de piridina, dialquilanilinas, bases inorgánicas, como hidruros, hidróxidos; carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos y alcalinoterreos. Los procedimientos 1 y 2 se realizan a presión normal, bajo exclusión de humedad y en disolventes o diluentes inertes.

25. En calidad de disolventes o diluentes inertes son apropiados, por ejemplo: éteres y compuestos etéreos, como éter dietílico, éter dipropílico, dioxano, tetrahydrofurano; hidrocarburos alifáticos, o aromáticos así como halogenados, en especial benceno, tolueno, xileno, cloro-

412702



formo, clorobenceno; nitrilos, como acetonitrilo.

- Los compuestos de partida de la fórmula II a Y son en parte compuestos conocidos (véase por ejemplo DOS 2.019.597), o bien pueden prepararse por métodos análogos conocidos. Así los métodos de preparación de los amidoacetales necesarios en el procedimiento 1 se describen sintópticamente en la Zeitschrift für Chemie 9, 201 (1969) y la preparación de las amidas de ácidos (tio)fosfórico en Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, como fósforo II.
- 5.
- 10.

- Las materias activas de la fórmula I son apropiadas para combatir parásitos animales de diversa índole. Pueden utilizarse por ejemplo contra todos los estadios de desarrollo, como huevos, larvas, ninfas, crisálidas y adultos de insectos y representantes del orden acarina, como ácaros y garrapatas.
- 15.

Pueden utilizarse por ejemplo contra los siguientes insectos o representantes del orden acarina: insectos de las familias:

20. Tettigonidae, Gryllidae, Gryllotalpidae, Blattidae, Reduviidae, Phyrhocoridae, Cimicidae, Delphacidae, Aphididae, Diaspididae, Pseudococcidae, Scarabaeidae, Dermestidae, Coccinellidae, Tenebrionidae, Chrysomelidae, Bruchidae, Tineidae, Noctuidae, Lymantriidae, Pyralidae,
25. Galleridae, Culicidae, Tipulidae, Stomoxydae, Muscidae, Calliphoridae, Trypetidae, Pulicidae
- así como ácaros de las familias:
- Ixodidae, Tetranychidae y Dermanyssidae.

412702

16 MAR



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 materias activas siguientes, entre otras:

COMPUESTOS DE FOSFORO ORGANICOS

- anhídrido de ácido bis-0,0-dietilfosfórico  
(TEPP)
5. dimetil-(2,2,2-tricloro-1-hidroxietil)-fosfonato  
(TRICHLORFON)
10. 1,2-dibromo-2,2-dicloroetil-dimetil-fosfato  
(NALED)
- 2,2-diclorovinil-dimetil-fosfato  
(DICHLORPHOS)
15. 2-metoxi carbamil-1-metilvinil-dimetil-fosfato  
(MEVINPHOS)
- dimetil-1-metil-2-(metilcarbamoil)-vinil-fosfato cis  
(MONOCROTOPHOS)
- 3-(dimetoxifosfiniloxi)-N,N-dimetil-cis-crotonamida  
(DICROTOPHOS)
20. 2-cloro-2-dietilcarbamoil-1-metilvinil-dimetil-fosfato  
(PHOSPHAMIDON)
- 0,0-dietil-0 (o S)-2-(etiltio)-etil-tiofosfato  
(DEMETON)
25. S-(etiltioetil-0,0-dimetil-ditiofosfato  
(THIOMETON)
- 0,0-dietil-S-etilmercaptometil-ditiofosfite  
(PHORATE)
- 0,0-dietil-S-2-(etiltio)-etil-ditiofosfato  
(DISULFOTON)
- 30.

47-2702



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

412702



(FENTHION)

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

5. O-O-dietil-O-p-(metilsulfinil)-fenil-tiofosfato  
(FENSULFOTHION)

O-p-(dimetilsulfamido)-fenil-O,O-dimetil-tiofosfato  
(FAMPHUR)

10. O,O,O',O'-tetrametil-O,O'-tiodi-p-fenilenti ofosfato  
O-etil-S-fenil-etil-ditiofosfonato  
O,O-dimetil-O-(alfa-metilbencil-3-hidroxicrotonil)-  
(fosfato)

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

15. 2-cloro-1-(2,4,5-triclorofenil)-vinil-dimetil-fosfato  
O- $\sqrt{2}$ -cloro-1-(2,5-diclorofenil)-vinil-O,O-dietiltio-  
fosfato  
O,O-dietiltiofosfato de fenilglioxilonitrioxima  
(PHOXIM)

20. O,O-dietil-O-(3-cloro-4-metil-2-oxo-2-H-1-benzopiran-  
7-il)-tiofosfato (COUMAPHOS)  
2,3-p-dioxanditiotiol-S,S-bis-(O,O-dietilditiofosfato)  
(DIOXATHION)

5- $\sqrt{6}$ -cloro-2-oxo-3-benzoxazolinil)-metil-O,O-dietil-  
ditiofosfato (PHOSALON)

25. 2-(dietoxifosfinilimino)-1,3-ditiolano  
O,O-dimetil-S- $\sqrt{2}$ -metoksi-1,3,4-tiadiazol-5-(4H)-onil-  
(4)-metil-ditiofosfato

O,O-dimetil-S-ftalimidometil-ditiofosfato (IMIDAN)  
O,O-dietil-O-(3,5,6, tricloro-2-piridil)-tiofosfato

412702



- 0,0-dietil-0-2-piracini1-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)-  
-diti ofosfato (AZINPHOSMETHYL)  
0,0-dietil-S-(4-oxo-1,2,3-benzotriacin-3(4H)-il-metil-  
di ti ofosfato (AZINPHOSAETHYL)
10. S-4,6-diamino-s-triacin-2-il)-metil7-0,0-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)-diti 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-0-2-dimetilamino-4-metilpirimidil-(6)7-  
ti ofosfato (DIOCTHYL)  
0,0-dimetil-S-(metilcarbamilmetil)-ti ofosfato  
(METHOAT)  
0-etil-0-(8-quinolil)-fenil ti ofosfonato

412702



(OXINOTHIOPHOS)

O-metil-S-metil-amidoti ofosfato

(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-metilisopropilamido-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-p-(p-clorofenil)-azofenil-l-O, O-dimetil-ti ofosfato



(AZOTHOAT)

- O-etil-S-4-clorofenil-etil-diti ofosfonato
- O-isobutil-S-p-clorofenil-etil-diti ofosfonato
- O,O-dimetil-S-p-clorofenil-ti ofosfato
- 5. O,O-dimetil-S-(p-clorofeniltiometil)-diti ofosfato
- O,O-dietil-p-clorofenilmercaptometil-diti ofosfato

(CARBOPHENOTHION)

- O,O-dietil-S-p-clorofeniltiometil-ti ofosfato
- O,O-dimetil-S-(carboetoxi-fenilmetil)-diti ofosfato

10. (PHENTHOAT)

- O,O-dietil-S-(carbofluoroetoxi-fenilmetil)-diti ofos-  
fato
- O,O-dimetil-S-(carboisopropoxi-fenilmetil)-diti ofosfa-  
to

15. O,O-dietil-7-hidroxi-3,4-tetrametilen-cumarinil-ti ofos-  
fato (COUMITHOAT)

- 2-sulfuro de 2-metoxi-4-H-1,3,2-benzodioxafosforina
- O,O-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)-O,O-dietil-diti ofosfato
- N-hidroxi naftalimido-dietil-fosfato
- dimetil-3,5,6-tricloro-2piridil-fosfato

25. O,O-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-O,O-dietilti ofosfórico

412702



(SULFOTEP)

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

(BUTONAT)

5. 0,0-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)

0,0-dietil-O-(2,2-dicloro-1-cloroetoxivinil)-fosfato  
0,0-dimetil-O-(2,2-dicloro-1-cloroetoxivinil)-fosfato  
O-etil-S,S-difenilditiol-fosfato  
O-etil-S-bencil-fenilditi ofosfonato

15. 0,0-dietil-S-bencil-tiol-fosfato  
0,0-dimetil-S-(4-clorofeniltiometil)-diti ofosfato

(METHYLCARBOPHENOTHION)

0,0-dimetil-S-(etiltiometil)-diti ofosfato  
diisopropilaminofluorofosfato

20. (MIPAFIX)

0,0-dimetil-S-(morfolinilcarbamoilmetil)-diti ofosfato  
(MORPHOTHION)

bismetilamido-fenilfosfato  
0,0-dimetil-S-(bencensulfonil)-diti ofosfato

25. 0,0-dimetil-(S y O)-etilsulfoniletal-ti ofosfato  
0,0-dietil-O-4-nitrofenilfosfato  
disulfuro de trietoxi-isopropoxi-bis-(ti ofosfinilo)  
2-óxido de 2-metoxi-4H-1,3,2-benzodioxafosforina  
octametilpirofosforamida

30. (SCHRADAN)

412702



- bis-(dimetoxiti ofosfini sulfuro)-fenilmetano  
N,N,N',N'-tetrametildiamidofluorofosfato  
(DIMEFOX)
5. O-fenil-O-p-nitrofenil-metanti ofosfonato  
(COLEP)
- O-metil-O-(2-cloro-4-tercibutil-fenil)-N-metilamido-  
tiofosfato (NARLENE)
- O-etil-O-(2,4-diclorofenil)-feniltiofosfonato
10. O,O-dietyl-O-(4-metilmercapto-3,5-dimetilfenil)-tiofos-  
fato  
disulfuro de 4,4'-bis-(O,O-dimetil tti ofosforiloxi)-  
difenilo  
O,O-di-(beta-cloroetil)-O-(3-cloro-4-metil-cumarinil-  
7)-fosfato
15. S-(1-ftalimidoetil)-O,O-dietyl di tti ofosfato  
O,O-dimetil-O-(3-cloro-4-dietyl sulfamilfenil)-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)

412702



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

2-secubutil-4,6-dinitrofenil-ciclopropionato

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

5. (DINOBUION)

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-clorobencil-4-clorofenilo

(CHORBENSID)

6-metil-2-oxo-1,3-ditiolo- $\sqrt{4,5-b}$ -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 (FENOZAFLOR)

412702



sulfonato de p-clorofenil-p-clorobenceno  
(OVEK)

bencensulfonato de p-clorofenilo  
(FENSON)

5. p-clorofenil-2,4,5-triclorofenilsulfona  
(TETRADIFON)

sulfuro de p-clorofenil-2,4,5-triclorofenilo  
(TETRASUL)

10. sulfuro de o-clorobencil-p-clorofenilo  
(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  
(CARBAFYL)

30. 2-butinil-4-clorofenilcarbamato

412702



- 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  
(CPMG)
- 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-quinaaldil-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)

412702



- 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  
(ARPROGARB)  
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-benzofurani 1-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).

412702



1973

- 2-metilcarbamoiloximino-1,3-ditiolano
- 5-metil-2-metilcarbamoiloximino-1,3-oxitioolano
- 2-(1-metoxi-2-propoxi)-fenil-N-metilcarbamato
- 2-(1-butyl-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

412702



18

- 2-cloro-5-tercibutil-fenil-N-metil-carbamato  
4-(metil-propargilamino)-3,5-xilil-N-metil-carbamato  
4-(metil-gamma-cloroalilamino)-3,5-xilil-N-metil-carbamato
5. 4-(metil-beta-cloroalilamino)-3,5-xilil-N-metil-carbamato
- 1-(beta-etoxicarboniletil)-3-metil-5-pirazolil-N,N-dimetil-carbamato
- 3-metil-4-(dimetilamino-metilmercapto-metilenimino)-fenil-N-metilcarbamato
10. clorhidrato de 1,3-bis-(carbamoiltio)-2-(N,N-dimetilamino)-propano
- 5,5-dimetilhidrorresorcinoldimetilcarbamato
- 2-[etil-propargilamino]-fenil-N-metilcarbamato
15. 2-[metil-propargilamino]-fenil-N-metilcarbamato
- 2-[dipropargilamino]-fenil-N-metilcarbamato
- 4-[dipropargilamino]-3-tolil-N-metilcarbamato
- 4-[dipropargilamino]-3,5-xilil-N-metilcarbamato
- 2-[alil-isopropilamino]-fenil-N-metilcarbamato
20. 3-[alil-isopropilamino]-fenil-N-metilcarbamato

HIDROCARBUROS CLORADOS

- gamma-hexaclorociclohexano  
(GAMMEXANE, LINDAN, GAMMA-HCH)
- 1,2,4,5,6,7,8,8-octacloro-3alfa-4,7,7alfa'-tetrahidro-4,7-metilenindano
25. (CHLORDAN)
- 1,4,5,6,7,8,8-heptacloro-3alfa-4,7,7alfa-tetrahidro-4,7-metilenindano

412702



(HEPTACHLOR)

1,2,3,4,10,10-hexacloro-1,4,4alfa,5,8,8alfa-hexahidro-  
endo-1,4-exo-5,8-dimetanonaftalina

(ALDRIN)

5. 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

(DIELDRIN)

1,2,3,4,10,10-hexacloro-6,7-epoxi-1,4,4alfa,5,6,7,8,8al-  
fa-octahidro-endo-endo-5,8-dimetanonaftalina

10. (ENDRIN)

Las buenas propiedades nematocidas de los com-  
puestos de la fórmula I se encuentran en primer térmi-  
no. Pueden utilizarse para combatir, por ejemplo, los  
siguientes nemátodos parasitarios de las plantas:

- 15. Meloidogyne spp., Heterodera spp., Ditylenchus spp.,  
Pratylenchus spp., Paratylenchus spp., Anguina spp.,  
Helicotylenchus spp., Tylenchorhynchus spp.,  
Rotylenchulus spp., Tylenchulus semipen etrans,  
Radipholus similis, Belonolaimus spp., Trichodorus spp.,
- 20. Longidorus spp., Aphelenchoides spp., Xiphinema spp.,  
Rhadinaphelenchus spp.,

Los compuestos de la fórmula I pueden emplear-  
se solos o junto con vehículos apropiados y/o materias  
suplementarias apropiadas. Los vehículos apropiados y  
25. las materias suplementarias apropiadas pueden ser sólidas  
o líquidas y corresponden a las materiales usuales en  
la técnica de las formulaciones, como por ejemplo, mate-  
rias naturales o regeneradas, disolventes, dispersan-  
tes, humectantes, fijadores, espesantes, aglomerantes

4127026



y/o ábomos.

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.

- 5.
10. 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:

- preparaciones sólidas:

agentes de espolvoreo,  
agentes de esparcimiento,  
granulados,  
granulados de envoltura,  
granulados de impregnación  
y granulados homogéneos;

- 20.
- preparaciones líquidas:

a) concentrados de materia activa dispersables en agua:

polvo para aspersiones (polvos humectables),  
pastas y emulsiones;

25.

30.



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.

- 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,  $\text{SiO}_2$ , granicalcio, bentonita, etc.) y evaporando luego el disolvente orgánico.

- 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 -



- 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  
5. con las materias activas, en forma, por ejemplo, de sus  
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-alkilfenoles  
con 5 a 15 radicales de óxido de etileno por molécula y



- 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 (polveros 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 (polveros 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.

412702



- do; productos de condensación de la naftalina o de los ácidos naftalinsulfónicos con fenol y formaldehído; sales alcalinas, amónicas y alcalinotérreas del ácido ligninsulfónico; sulfonatos de alquilarilo; sales alcalinas y alcalinotérreas del ácido dibutilnaftalinsulfónico; sulfatos 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 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 de manera que en los polvos para aspersiones la porción sólida no rebasa 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 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 de 120° a 350° C. Los disolventes deben ser prácticamente inodoros e inertes respecto a las materias activas.

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

412702



- 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 epíclorohidrina,



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,



1930 2073

- 19,5 partes de creta de Champagne y  
28,1 partes de caolín;
- c) 25 partes de materia activa,  
2,5 partes de isooctilfenoxi-poli oxietilen-  
5. 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 -  
15. fónico y formaldehido y  
82 partes de caolín.

Se mezclan íntimamente las materias activas con las materias suplementarias en mezcladoras apropiadas y se muele la mezcla en molinos y laminadoras a propósito. Se obtienen así polvos para aspersiones que pueden diluirse con agua para formar suspensiones de cualquier concentración que se desee.

20.

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 -



- tituido por éter poliglicólico de alcohol graso y sal cálcica de sulfonato de alquilarilo,
- 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 alquilarilo 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 :

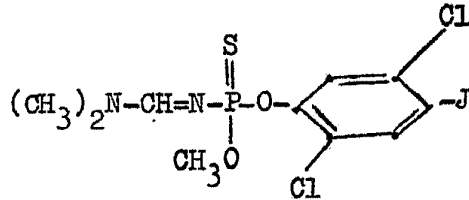
- 5 partes de materia activa,
- 1 parte de epiclorohidrina y
20. 94 partes de bencina (de intervalo de ebullición 160 a 190° C).

Ejemplo 1

a) N,N-dimetil-N'-O-metil-O-(3,6-dicloro-4-yodofenil)-tionofosforil-formamidina

25. 25 g de amida de ácido O-metil-O-(3,6-dicloro-4-yodo-fenil)-tiofosfórico se vierten sobre y se sacuden con 10 g de dimetilacetato de N,N-dimetilformamida, hasta que se origina una solución clara. Luego se destila a 50°C/1 torr todas las partículas volátiles. Permanecen
30. 28,6 g del compuesto de la fórmula

- 30  
412702

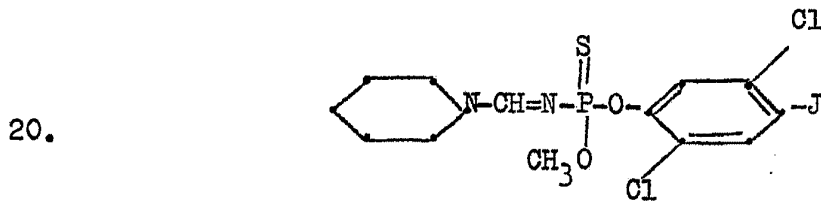


5. como una resina viscosa, que solidifica en forma cristalina después de algunos días; punto de fusión 87-92°C.

b) N-[O-(2,5-dicloro-4-yodofenil)-O-metil-tionofosforil]-piperidinil-formimida

10. 12, 4 g de amida de ácido O-metil-O-(3,6-dicloro-4-yodo-fenil)-tiofosfórico se agitan a 50°C durante 10 minutos con una mezcla de 5,1 g de bis-metoxipiperidino-metano y 10 cc de dioxano, con lo que el material de partida se disuelve poco a poco y simultáneamente precipita en forma cristalina la mayor parte del producto de reacción.

15. Se enfría a 0°C, el producto se filtra y se lava con metanol. Se obtiene 12 g del compuesto de la fórmula



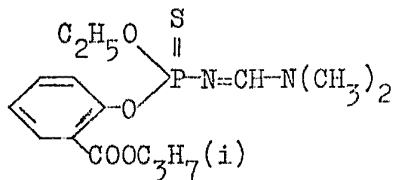
Punto de fusión 150-152°C.

25. En forma análoga se preparan asimismo los compuestos siguientes de la fórmula I:

412702

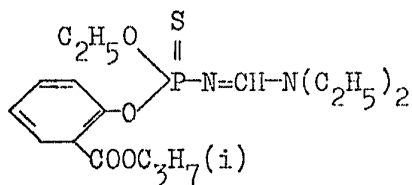


10.



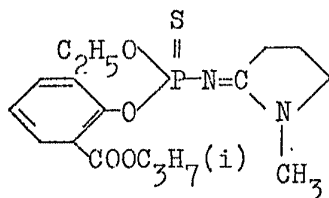
$n_D^{28} = 1,5302$

5.



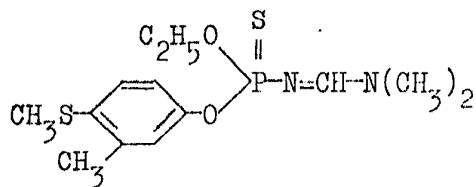
$n_D^{28} = 1,5133$

10.



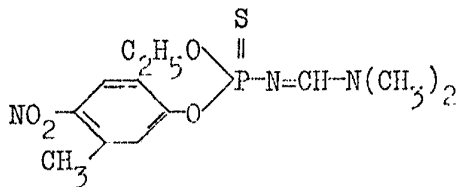
$n_D^{28} = 1,5413$

15.



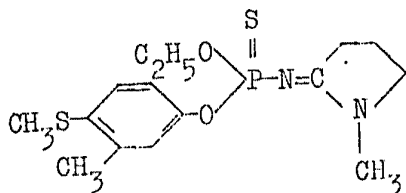
$n_D^{20} = 1,5869$

20.



$n_D^{20} = 1,5811$

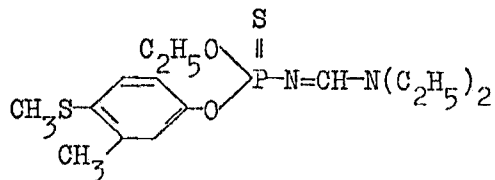
25.



P. de f. 62-63°C

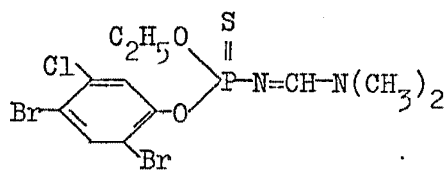


16



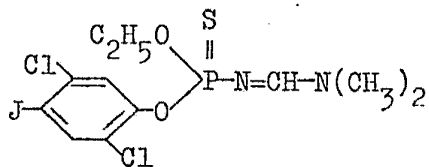
$$n_D^{24} = 1,5663$$

5.



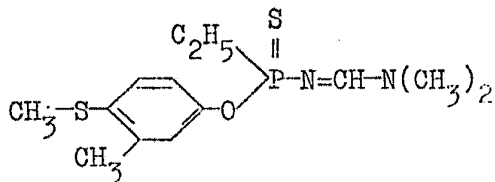
$$n_D^{20} = 1,5955$$

10.



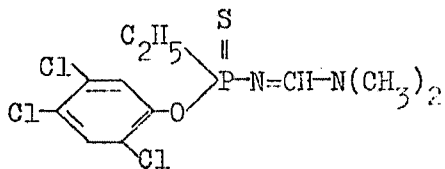
P.de f. 87-89°C

15.



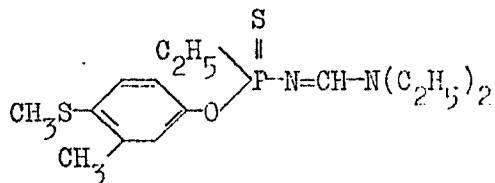
$$n_D^{24} = 1,6010$$

20.



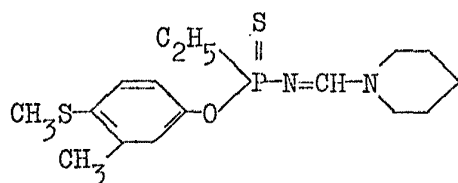
$$n_D^{24} = 1,5939$$

25.



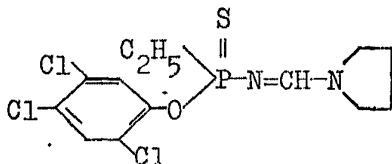
$$n_D^{26} = 1,5813$$

412702 16



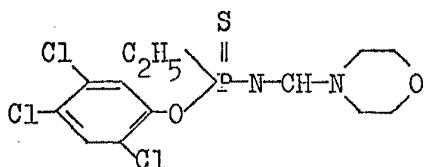
$$n_D^{26} = 1,5948$$

5.



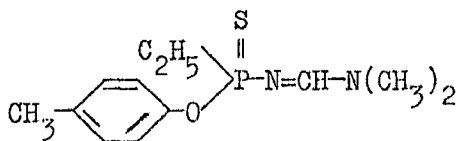
$$n_D^{26} = 1,5942$$

10.



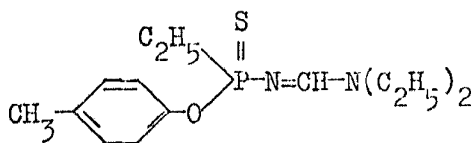
p. de f. 93-95°C

15.



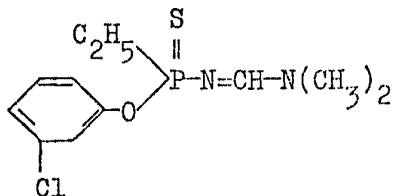
$$n_D^{26} = 1,5631$$

20.



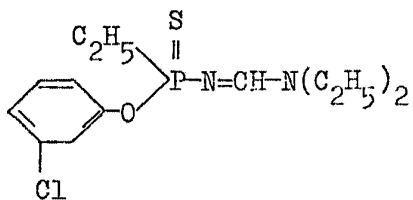
$$n_D^{24} = 1,5523$$

25.



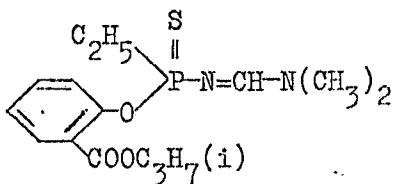
$$n_D^{24} = 1,5810$$

412702



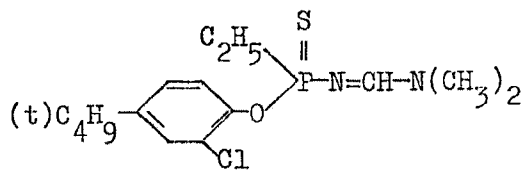
$n_D^{24} = 1,5615$

5.



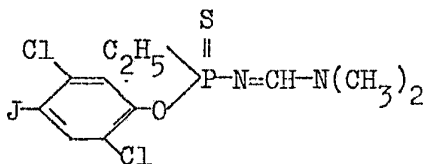
$n_D^{24} = 1,5448$

10.



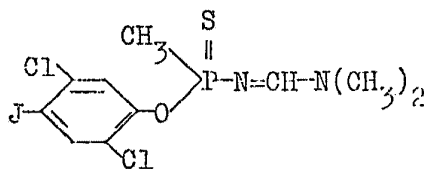
$n_D^{24} = 1,5492$

15.



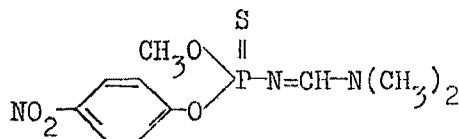
$n_D^{24} = 1,6343$

20.



$n_D^{24} = 1,6423$

25.

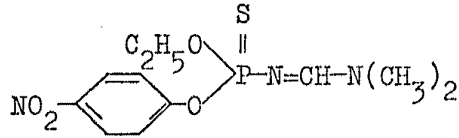


$n_D^{24} = 1,5836$

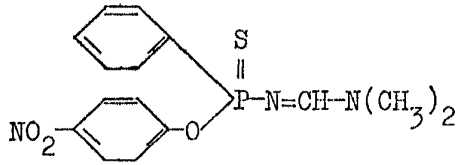
412702



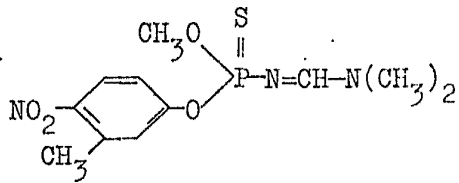
10 73



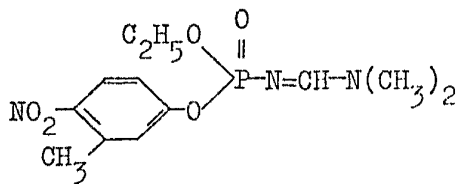
$n_D^{26} = 1,5740$



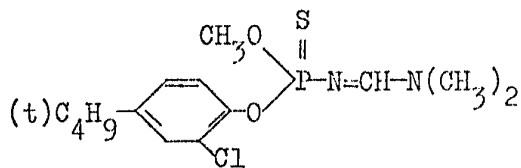
$n_D^{24} = 1,6155$



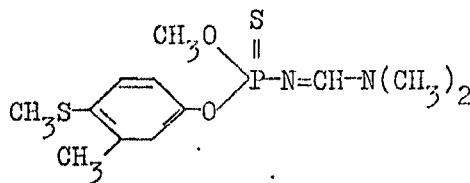
$n_D^{24} = 1,5798$



$n_D^{24} = 1,5422$



$n_D^{24} = 1,5571$

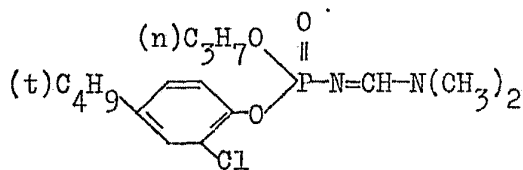


$n_D^{23} = 1,6068$

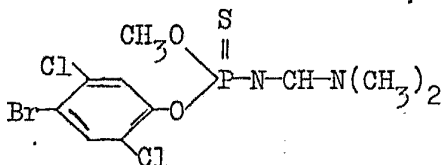
412702 16.



5.

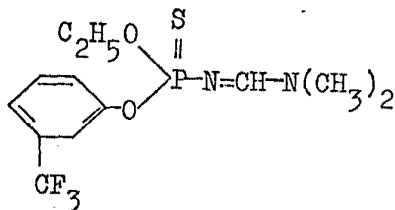


$n_D^{23} = 1,5207$

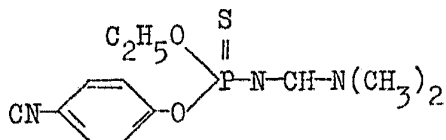


$n_D^{23} = 1,6032$

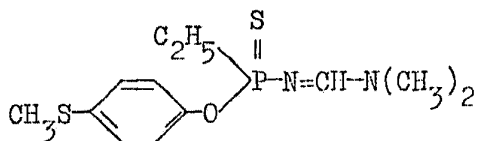
10.



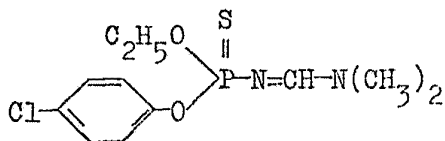
15.



20.



25.







5. Para probar la acción acaricida se trataron hojas de judía que estaban atacadas mediante adultos, estadios de reposo y huevos de ácaro tojo (*Tetranychus urticae*) con una emulsión al 0,05% de la substancia a ensayar (preparada a partir de un concentrado emulgible al 25%). En ensayo se evaluó después de 6 días. Como animales de ensayo se utilizaron cepas del ácaro rojo resistentes frente al éster de ácido fosfórico.
10. B) Acción sobre garrapatas y sus estadios de desarrollo  
1) Rhipicephalus bursa (adultos y larvas)
15. Se depositaron cada vez en un tubito de vidrio 5 garrapatas adultas o respectivamente 50 larvas de garrapata y se las sumergió de 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 substancia 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 dos semanas y para las larvas al cabo de 3 días. Para cada ensayo se realizaron dos repeticiones.
- 2) Boophilus micropulus (hembras y larvas)
25. Con una serie de dilución análoga a la de la prueba A, se realizaron ensayos con 5 hembras cada vez sensibles u OP-resistentes o con 20 larvas cada vez sensibles u OP-resistentes. (La resistencia se refiere a la tolerancia de la diazinona). La evaluación se efectuó en las hembras al cabo de 6 semanas y en las larvas al cabo de 3 días.



Los compuestos según el ejemplo 1 resultaron eficaces en estas pruebas contra los adultos y las larvas de *Rhipicephalus bursa* y las hembras y larvas sensibles u OP-resistentes de *Boophilus microplus*.

5. Ejemplo 4

Acción contra los nemátodos del terreno

10. 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 nemátodos de agallas radicales (*Meloidogyne Arenaria*) y se mezcló íntimamente. En la tierra así preparada, en una serie de ensayos, se plantaron inmediatamente después plantones de tomate y, en otra serie de ensayos, se sembraron al cabo de 8 días de espera semillas de tomate.

15. 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.

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

= . =

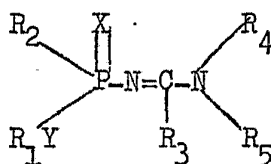
N O T A

25. Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención, con prioridad de la solicitud de patentes suizas núms. 4054/72 del 17 de marzo de 1972 y 2328/73 del 16 de febrero de 1973, las siguientes:



REIVINDICACIONES

1. Procedimiento para la preparación de derivados de N-fosforil- y N-fosforil-amidinas de la fórmula



5.

en la que

10.  $R_1$  significa fenilo, fenilo substituido de una a tres veces mediante halógeno, de una a dos veces mediante alquilo de  $C_1-C_4$ , alquiltio de  $C_1-C_4$ , nitro, ciano o trifluorometilo o una vez mediante carbalcoxilo de  $C_1-C_4$ ,
15.  $R_2$  significa metilo, metoxilo, etilo, etoxilo o fenilo,
- $R_3$  significa hidrógeno o metilo,
- $R_4$  y  $R_5$  significan metilo, etilo, n-propilo, isopropilo o alilo,
- X e Y significan oxígeno o azufre o
20.  $R_4$  y  $R_5$  forman con el átomo de nitrógeno, al que están enlazados, el anillo morfolino, piperidino o pirrolidino o
- $R_3$  con  $R_4$  y  $R_5$  forman un anillo pentagonal o hexagonal saturado, en donde entonces el grupo  $R_4$  o  $R_5$  que no participa en la formación del anillo, representa metilo o etilo,
- 25.

