

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



| | | | |
|-------|----------|-----------------------|-------|
| 19 ES | 11 21 | NUMERO | 10 A1 |
| | | - 443.916 | |
| 22 | | FECHA DE PRESENTACION | |
| | | 27-12-75 | |

PATENTE DE INVENCION

| | | |
|------------------------------|----------|--------------|
| 50 PRIORIDADES: 51 NUMERO | 52 FECHA | 53 PAIS |
| 537.143 | 30.12.74 | EE.UU. de A. |

| | | |
|------------------------|--------------------------------|--------------------------------------|
| 47 FECHA DE PUBLICIDAD | 51 CLASIFICACION INTERNACIONAL | 62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA |
| | COFF, A01N | |

| |
|--|
| 54 TITULO DE LA INVENCION |
| PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UNA COMPOSICION INSECTICIDA ACTIVADA. |

| |
|---------------------------|
| 71 SOLICITANTE (S) |
| STAUFFER CHEMICAL COMPANY |

| |
|-------------------------------------|
| DOMICILIO DEL SOLICITANTE |
| Westport, Connecticut, EE.UU. de A. |

| |
|--|
| 72 INVENTOR (ES) |
| George Blackmore Large., Leland Stanton Pitt |

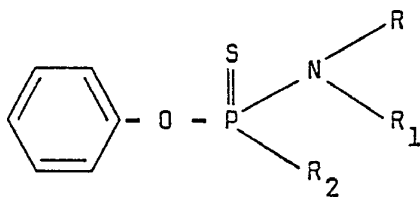
| |
|-----------------|
| 73 TITULAR (ES) |
| |

| |
|-------------------------------------|
| 74 REPRESENTANTE |
| D. JOSE MIGUEL GOMEZ-ACEBO Y POMBO. |

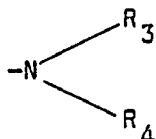
Entre otros muchos compuestos insecticidas, los ftalimidotiodosfosatos, han alcanzado un grado relativamente alto de éxito comercial. Estos compuestos son tóxicos para un gran número de plagas de insectos, a diferentes concentraciones que varían según la resistencia del insecto de que se trate. Algunos de estos compuestos quedan descritos en la Patente U.S. No. 2.767.194, específicamente el N-(mercaptometil)-ftalimida-S-(0,0-dimetilfosforoditioato).

La idea de ampliar la utilidad de los tiofosfatos, incrementando su efectividad y disminuyendo su coste, ha llevado a realizar profundos y completos estudios sobre otra clase de productos químicos biológicamente activos, a los que normalmente damos el nombre de sinerfistas. Entre los muchos sinergistas empleados, los óxidos de alquilo, concretamente, el butóxido de piperonilo, han sido ampliamente utilizados. Estos compuestos quedan descritos en la Patente U.S. No. 2.485.681 y la 2.550.737.

Se ha descubierto que los compuestos de tiofosfato con actividad insecticida, pueden incrementarse utilizando un activador de fórmula:



en donde R se selecciona de entre un grupo formado por hidrógeno y alquilo inferiores; R_1 se selecciona de entre un grupo formado por hidrógeno, alquilo y cicloalquilo; R_2 se selecciona de entre un grupo formado por alcoxi inferiores y



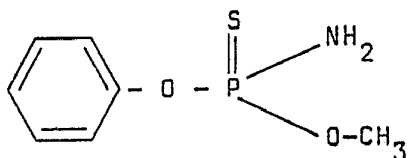
en donde R_3 y R_4 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre un grupo formado por hidrógeno y alquilo inferiores.

5 Estos compuestos se fabrican haciendo reaccionar un compuesto amínico apropiado con ciertos derivados de fosforotionato halogenados. Una vez conseguidos los productos finales, se aíslan, purifican y mezclan con el compuesto insecticida. La cantidad de activador mezclada, puede oscilar

10 entre 1 a 0,1 y 1 a 10 partes de compuestos insecticida, con respecto a compuesto activador. Tras la mezcla del insecticida con el activador, el producto resultante se aplicará al habitat de los insectos de una forma convencional.

15 Con el fin de ilustrar los méritos del presente invento, se incluyen los siguientes ejemplos:

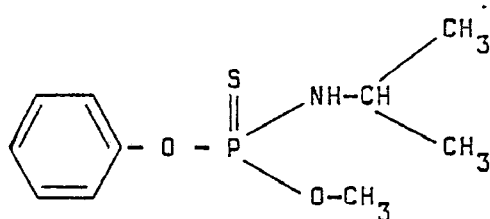
EJEMPLO 1



20 Se preparó una solución conteniendo 5,8 gramos (0,026 moles) de O-metil-O-fenil fosforotiocloridato en 50 ml. de benceno. Luego se burbujeó amoníaco en la solución sometida a agitación, hasta que ya no se produjo ningún tipo de reacción. La mezcla resultante se lavó con H_2O , se desecó sobre MgSO_4 anhidro y por último se descargó de impurezas bajo

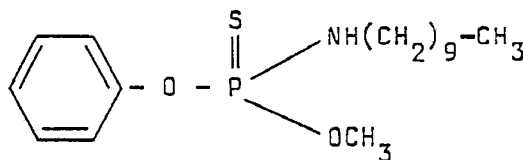
presión reducida, para conseguir finalmente un rendimiento de 5,2 gramos de producto. N_D^{30} 1,5396

EJEMPLO 2



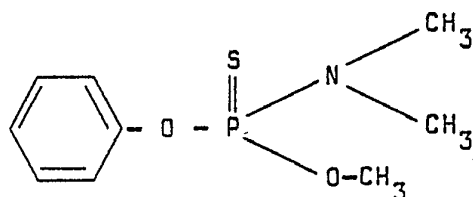
5 Se preparó una solución conteniendo 5,6 gramos
 (0,025 moles) de O-metil-O-fenil fosforotiocloridato y 100 ml.
 de benceno. A esta solución se le añadieron 3,5 gramos de iso
 propilamina poco a poco. La mezcla se agitó durante 1/2 hora.
 El producto se aisló, lavando con solución de ClH diluída y
 10 lavando mas tarde por dos veces con H₂O, desecando sobre
 MgSO₄ anhidro y eliminando los volátiles bajo presión reduci-
 da, para conseguir finalmente un rendimiento de 5,5 gramos de
 producto. N_D^{30} 1,5015

EJEMPLO 3

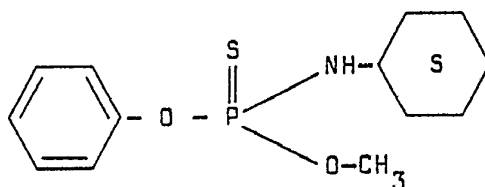


15

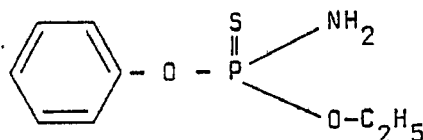
Se repitió el procedimiento del Ejemplo 2, ex-
 cepto en que se utilizaron 9,4 gramos de decilamina. El rendi-
 miento fue de 8,6 gramos. N_D^{30} 1,4781

EJEMPLO 4

Se repitió el procedimiento del Ejemplo 2, excepto en que se utilizaron 2,7 gramos de dietilamina en solución acuosa al 40 %. El rendimiento fue de 5,8 gramos de producto. N_D^{30} 1,5241

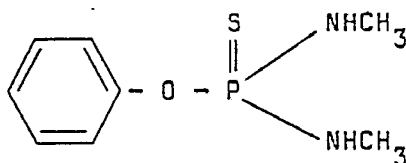
EJEMPLO 5

Se preparó una solución conteniendo 5,6 gramos (0,025 moles) de O-metil-O-fenil fosforotiocloridato y 100 ml. de benceno. A esta solución se le añadieron 6,0 gramos de ciclohexilamina, por porciones. La mezcla se sometió a reflujo durante 45 minutos. El producto se aisló de la misma forma que en el Ejemplo 2, para dar un rendimiento de 7,1 gramos de producto. Punto de fusión 43 - 45° C.

EJEMPLO 6

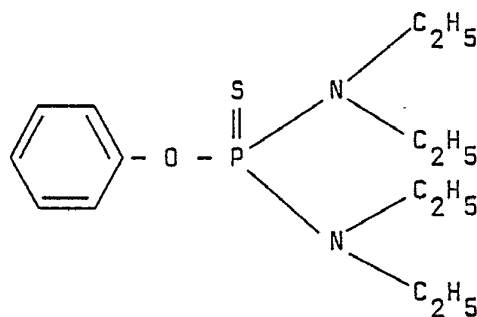
Se repitió el procedimiento del Ejemplo 1, excepto en que se utilizaron 5,9 gramos (0,025 moles) de O-etil-O-fenil fosforotiocloridato. El rendimiento fue de 5,4 gramos de producto. N_D^{30} 1,5205.

5

EJEMPLO 7

10

Se preparó una solución conteniendo 5,7 gramos (0,025 moles) de O-fenil fosforotiocloridato y 100 ml. de benceno. A esta solución se añadieron 3,26 gramos de monometilamina, contenidos en una solución acuosa al 40 %. Esta mezcla se agitó en baño de agua caliente durante 15 minutos. El producto se aisló de la misma forma que en el Ejemplo 2, para dar un rendimiento de 5,0 gramos de producto. N_D^{30} 1,5460.

EJEMPLO 8

15

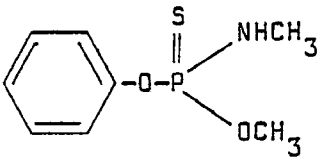
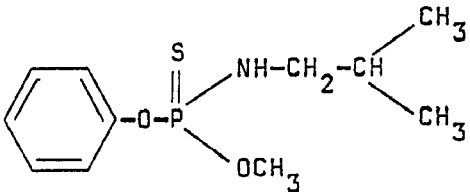
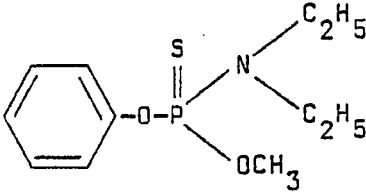
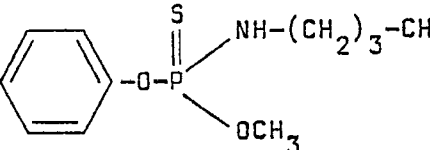
Se repitió el procedimiento del Ejemplo 7, ex-

cepto en que se utilizaron 7,6 gramos de dietilamina. El rendimiento fue de 6,0 gramos. N_D^{30} 1,5157.

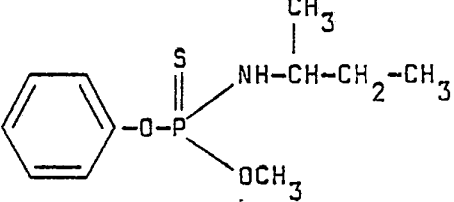
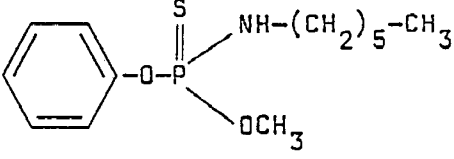
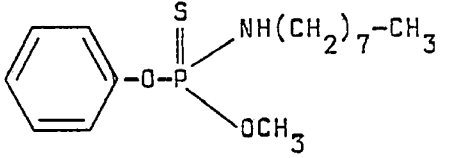
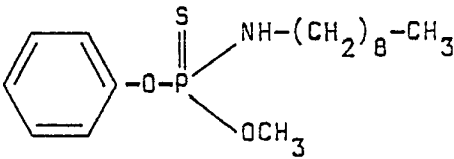
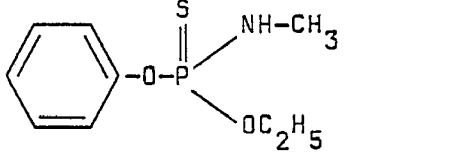
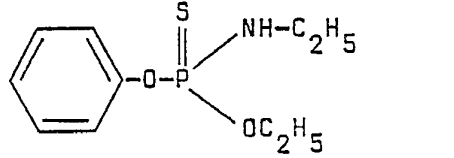
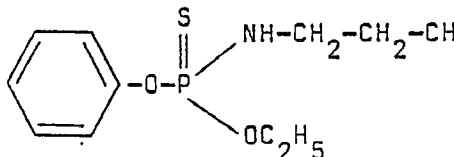
Se sintetizaron otros compuestos adicionales de una forma similar, utilizando las materias primas adecuadas.

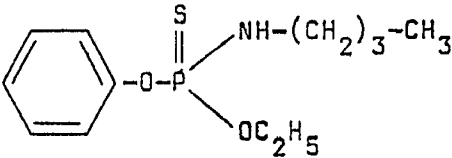
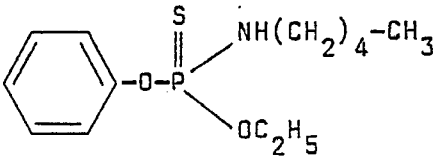
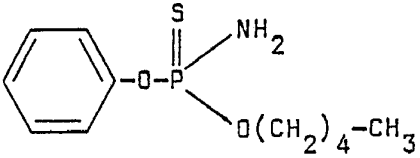
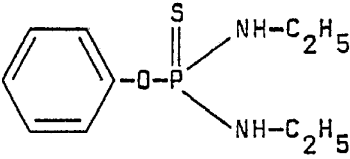
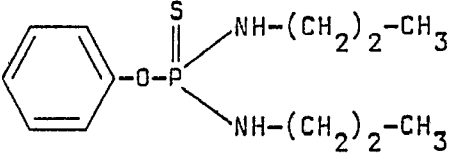
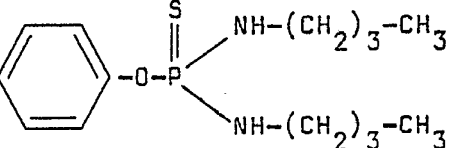
5 Estos compuestos quedan reflejados en la siguiente Tabla:

TABLA I

| | | |
|------------|--|-------------------|
| Ejemplo 9 |  | N_D^{30} 1,5150 |
| Ejemplo 10 |  | N_D^{30} 1,4972 |
| Ejemplo 11 |  | N_D^{30} 1,5071 |
| Ejemplo 12 |  | N_D^{30} 1,4976 |

10

| | | | |
|------------|--|--|-------------------|
| Ejemplo 13 |  | N_D^{30} 1.4988 | |
| Ejemplo 14 |  | N_D^{30} 1.4698 | |
| Ejemplo 15 |  | N_D^{30} 1.4822 | |
| Ejemplo 16 |  | N_D^{30} 1.4825 | |
| 5 | Ejemplo 17 |  | N_D^{30} 1.5130 |
| Ejemplo 18 |  | N_D^{30} 1.5058 | |
| Ejemplo 19 |  | N_D^{30} 1.5009 | |

| | | |
|------------|--|-------------------|
| Ejemplo 20 |  | n_D^{30} 1.4927 |
| Ejemplo 21 |  | n_D^{30} 1.4888 |
| Ejemplo 22 |  | n_D^{30} 1.4955 |
| Ejemplo 23 |  | n_D^{30} 1.5267 |
| Ejemplo 24 |  | n_D^{30} 1.5136 |
| Ejemplo 25 |  | M.P. 45-47° C. |

Evaluación de insecticidas

A. Moscas caseras (*Musca domestica* (L.)) (H.F.)

Se utilizó el siguiente procedimiento para hacer:

las comprobaciones correspondientes, tanto sobre las moscas S-clorothion resistentes como sobre las susceptibles. Los compuestos de prueba se diluyen en acetona, pipeteando luego partes alícuotas de la dilución, en cápsulas de aluminio de 55 x 15 mm. Para asegurar una distribución uniforme del producto químico en el fondo de las cápsulas, se añade también a cada una de ellas 1 ml. de acetona que contenga aceite de cacahuet 0,02 %. Una vez evaporados todos los disolventes, se colocan las cápsulas en cajas de cartón circulares que contienen 25 moscas hembras. Las cajas o jaulas se cubren por su parte inferior con celofán y por la superior con una red de tul, dejando en el interior de las mismas un algodón empapado en agua saturada de azúcar, para alimentación de las moscas. La mortalidad se registra una vez transcurridas 48 horas. En todas las soluciones madre se combinan 5 partes de activador, con 1 parte de tóxico. Los niveles de producto empleados en las pruebas, oscilan desde 1.000 ug de tóxico + 5.000 ug de activador, hasta aquel al cual se produce aproximadamente un 50 % de mortalidad. Todos los valores LD_{50} (dosis letal 50 (1/2)), se expresan en ug de tóxico/cápsula.

B. gusanos de las salinas (*Estigmene acrea* (Drury)) (SMC).

Las soluciones para comprobación se preparan disolviendo alícuotas iguales de tóxico y activador, en solución de acetona y agua a 50 - 50. Se toman hojas de romaza amarga (*Rumex obtusifolius*) y tras hacer secciones de las mismas de 2,54 cms. a 3,8 cms. de longitud, se sumergen en las soluciones a comprobar durante 1 - 2 segundos y luego se colocan a secar sobre una red de alambre. La hoja seca se coloca sobre un trozo de papel de filtro humedecido, en una placa de

Petri y se hace la infestación con cinco larvas de tercera mu da. La mortalidad se valora una vez transcurridas 48 horas y los valores LD_{50} se expresan como porcentaje del tóxico existente en las soluciones acetona-acuosas.

5 C. Oruga medidora de los repollos (*Trichoplusia ni*) (CL).

La misma técnica que con los gusanos de las salinas (C) excepto que se utilizan hojas de repollo blanco (*Brassica oleracea*) como planta hospedadora, en vez de romaza amarga.

10 D. Oruga de los brotes del tabaco (*Heliothis virescens* (F.)) (TBW),

La misma técnica que con los gusanos de las salinas (C) excepto que se utilizaron hojas de lechuga romana (*Lactuca sativa*) como planta hospedadora en lugar de romaza amarga.

15 E. Cucaracha alemana (*Blattella germanica*, Linneo) (GR).

Alícuotas iguales de tóxico y activador se diluyen en una solución acetona-agua en proporción 50 - 50. Dos cc. de las soluciones se pulverizan por medio de una pistola de pulverización manual DeVilbiss tipo EGA, en cajas de cartón circulares que contienen ninfas de cucaracha alemana de un mes de edad, en número de 10. Estas cajas o jaulas están recubiertas por su parte inferior de celofán y por su parte superior por una red de tul. Se calcula el % de mortalidad 2 días mas tarde. Las concentraciones de producto en prueba, oscilan desde el 0,1 % hasta aquella en que se produce un 50 % aproximadamente de mortalidad. Todos los valores LD_{50} se expresan en % de tóxico.

30

F. Pulgones de melocotón (*Myzus persicae*, Sulzer) (GPA).

Plantas de rábano (*Raphanus sativus*) de aproximadamente 2,54 - 5,08 cms. de alto, se transplantan a tierra negra, en recipientes de arcilla de 7,62 cms. y se infestan con 10 - 50 pulgones de edades diversas. 24 Horas mas tarde se aplica un spray hasta el punto de goteo, de una solución 50 % de agua - 50 % de acetona, que contiene además el compuesto o compuestos de prueba. Todas las combinaciones se hacen a concentraciones iguales de tóxico y activador, disueltos en una solución acetona - agua. Las concentraciones en prueba, tanto para el tóxico como para el activador, oscilan desde un 2 % hasta aquella a la que se consigue un 50 % de mortalidad. Esta mortalidad se registra una vez transcurridas 48 horas y los valores LD₅₀ se expresan como % de tóxico.

FACTOR ACTIVANTE

El factor de activación se deduce utilizando la fórmula que a continuación se cita, según la respuesta esperada para una determinada combinación de dos insecticidas:

$$A.F. = \frac{LD_{50} \text{ de tóxico } \frac{1}{xy + 1}}{LD_{50} \text{ experimental de la combinación}}$$

X = Proporción entre el % o peso de los sinergistas y el % o peso del tóxico.

Y = Proporción entre la LD₅₀ del tóxico y la LD₅₀ del sinergista.

La LD₅₀ experimental de la combinación, lo es en términos de tóxico solamente.

El factor activante o de activación, es por lo tanto la proporción entre la LD_{50} esperada de la combinación y la LD_{50} experimental.

5 Se observa que cuando la respuesta hallada, es superior a la esperada el Factor de activación es superior a 1. Esta respuesta supone un sinergismo. Los resultados de estas pruebas, quedan reflejados en la Tabla II.

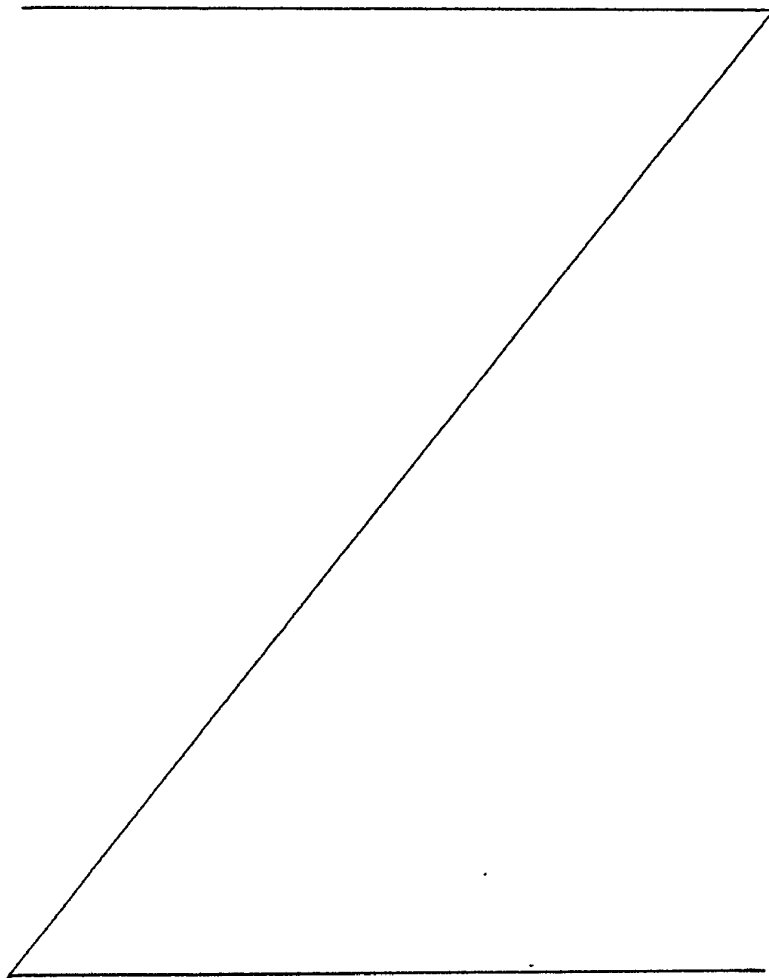


TABLA II

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC | CL | TBW | GPR |
|-------------------------|----------------|---------------|-------|------|-------|-------|-------|
| Insecticida(1) | 3,5 | >10.000 | 0,02 | >2,0 | 0,1 | 0,5 | 0,15 |
| Insecticida + Ejemplo 1 | 1,0 | <50,0 | 0,007 | >0,1 | >0,03 | 0,02 | 0,02 |
| Ejemplo 1 | 30 | 500 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | 0,1 | 0,007 |
| Fac. Activador | 2,2 | >2,0 | >2,38 | 1,0 | | 4,17 | 2,52 |
| Insecticida + Ejemplo 2 | 1,5 | <50,0 | 0,01 | 0,1 | >0,03 | 0,02 | 0,07 |
| Ejemplo 2 | 50 | 800 | >0,1 | >0,1 | 0,07 | 0,1 | 0,007 |
| Fac. Activador | 1,73 | >3,15 | >1,67 | >1,0 | | 4,17 | 6,82 |
| Insecticida + Ejemplo 3 | 2,8 | 75,0 | 0,02 | >0,1 | >0,03 | 0,05 | 0,05 |
| Ejemplo 3 | >100 | 10.000 | 0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| Fac. Activador | >1,0 | >22,22 | >1,0 | 1,0 | | >1,17 | >1,7 |
| Insecticida + Ejemplo 4 | 2,8 | 90,0 | 0,02 | 0,07 | 0,02 | 0,02 | 0,02 |
| Ejemplo 4 | >100 | 10.000 | >0,1 | 0,1 | 0,1 | >0,1 | >0,2 |
| Fac. Activador | >1,0 | >18,52 | 1,0 | 1,3 | 2,5 | >4,2 | >4,3 |
| Insecticida + Ejemplo 5 | 2,3 | 80,0 | 0,01 | >0,1 | >0,1 | 0,05 | 0,02 |
| Ejemplo 5 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | 0,18 |
| Fac. Activador | >1,3 | >20,8 | >1,67 | 1,0 | 1,0 | >1,67 | 4,8 |

TABLA II

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC |
|----------------------------|-------------------|------------------|-------|------|
| Insecticida(1) | 3,5 | >10.000 | 0,02 | >2,0 |
| Insecticida + Ejemplo 1 | 1,0 | <50,0 | 0,007 | >0,1 |
| Ejemplo 1 | 30 | 500 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 2,2 | >2,0 | >2,38 | 1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 2 | 1,5 | <50,0 | 0,01 | 0,1 |
| Ejemplo 2 | 50 | 800 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 1,73 | >3,15 | >1,67 | >1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 3 | 2,8 | 75,0 | 0,02 | >0,1 |
| Ejemplo 3 | >100 | 10.000 | 0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,0 | >22,22 | >1,0 | 1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 4 | 2,8 | 90,0 | 0,02 | 0,07 |
| Ejemplo 4 | >100 | 10.000 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | >1,0 | >18,52 | 1,0 | 1,3 |
| Insecticida + Ejemplo 5 | 2,3 | 80,0 | 0,01 | >0,1 |
| Ejemplo 5 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,3 | >20,8 | >1,67 | 1,0 |

| SMC | CL | TBW | GPR |
|------|-------|-------|-------|
| >2,0 | 0,1 | 0,5 | 0,15 |
| >0,1 | >0,03 | 0,02 | 0,02 |
| >0,1 | >0,2 | 0,1 | 0,007 |
| 1,0 | | 4,17 | 2,52 |
| 0,1 | >0,03 | 0,02 | 0,07 |
| >0,1 | 0,07 | 0,1 | 0,007 |
| >1,0 | | 4,17 | 6,82 |
| >0,1 | >0,03 | 0,05 | 0,05 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| 1,0 | | >1,17 | >1,7 |
| 0,07 | 0,02 | 0,02 | 0,02 |
| 0,1 | 0,1 | >0,1 | >0,2 |
| 1,3 | 2,5 | >4,2 | >4,3 |
| >0,1 | >0,1 | 0,05 | 0,02 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | 0,18 |
| 1,0 | 1,0 | >1,67 | 4,8 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC | CL | TBW | GPR |
|-----------------------------|-------------------|------------------|-------|------|-------|-------|-------|
| Insecticida + Ejemplo 6 | 1,5 | 50,0 | 0,007 | 0,03 | 0,007 | 0,03 | |
| Ejemplo 6 | 33 | 3.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | |
| Fac. Activador | 1,5 | 11,3 | 2,4 | 3,2 | 9,5 | 2,8 | |
| Insecticida + Ejemplo 7 | 2,8 | 50,0 | 0,02 | 0,05 | 0,02 | - | 0,03 |
| Ejemplo 7 | >100 | 3.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| Fac. Activador | >1,0 | >11,3 | 1,0 | - | >3,33 | - | >2,9 |
| Insecticida + Ejemplo 8 | 2,0 | 75,0 | 0,01 | 0,05 | 0,02 | 0,02 | 0,01 |
| Ejemplo 8 | >100 | 10.000 | >0,1 | 0,1 | 1 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | >1,5 | >22,22 | >1,67 | 1,9 | 2,5 | >4,2 | 6,0 |
| Insecticida + Ejemplo 9 | 2,0 | <50,0 | 0,007 | 0,05 | 0,02 | - | 0,1 |
| Ejemplo 9 | 88 | 3.000 | >0,1 | >0,1 | 0,15 | - | 0,15 |
| Fac. Activador | 1,5 | >11,3 | >2,38 | >1,0 | 3,0 | - | 7,5 |
| Insecticida + Ejemplo 10 | 1,5 | 50,0 | 0,01 | 0,07 | 0,03 | 0,007 | 0,008 |
| Ejemplo 10 | >100 | 3.000 | >0,1 | 0,1 | 0,07 | >0,1 | 0,07 |
| Fac. Activador | >2,0 | >11,3 | >1,67 | 1,0 | 1,4 | >11,9 | 5,96 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC |
|-----------------------------|-------------------|------------------|-------|------|
| Insecticida + Ejemplo 6 | 1,5 | 50,0 | 0,007 | 0,03 |
| Ejemplo 6 | 33 | 3.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 1,5 | 11,3 | 2,4 | 3,2 |
| Insecticida + Ejemplo 7 | 2,8 | 50,0 | 0,02 | 0,05 |
| Ejemplo 7 | >100 | 3.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,0 | >11,3 | 1,0 | - |
| Insecticida + Ejemplo 8 | 2,0 | 75,0 | 0,01 | 0,05 |
| Ejemplo 8 | >100 | 10.000 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | >1,5 | >22,22 | >1,67 | 1,9 |
| Insecticida + Ejemplo 9 | 2,0 | <50,0 | 0,007 | 0,05 |
| Ejemplo 9 | 88 | 3.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 1,5 | >11,3 | >2,38 | >1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 10 | 1,5 | 50,0 | 0,01 | 0,07 |
| Ejemplo 10 | >100 | 3.000 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | >2,0 | >11,3 | >1,67 | 1,0 |

| SMC | CL | TBW | GPR |
|------|-------|-------|-------|
| 0,03 | 0,007 | 0,03 | |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | |
| 3,2 | 9,5 | 2,8 | |
| 0,05 | 0,02 | - | 0,03 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| - | >3,33 | - | >2,9 |
| 0,05 | 0,02 | 0,02 | 0,01 |
| 0,1 | 1 | >0,1 | 0,1 |
| 1,9 | 2,5 | >4,2 | 6,0 |
| 0,05 | 0,02 | - | 0,1 |
| >0,1 | 0,15 | - | 0,15 |
| >1,0 | 3,0 | - | 7,5 |
| 0,07 | 0,03 | 0,007 | 0,008 |
| 0,1 | 0,07 | >0,1 | 0,07 |
| 1,0 | 1,4 | >11,9 | 5,96 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC | CL | TBW | GPR |
|--------------------------|----------------|---------------|-------|------|-------|-------|------|
| Insecticida + Ejemplo 11 | 2,0 | <50,0 | 0,01 | 0,05 | >0,03 | - | 0,02 |
| Ejemplo 11 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | - | 0,18 |
| Fac. Activador | >1,49 | >33,3 | >1,67 | >1,9 | - | - | 4,1 |
| Insecticida + Ejemplo 12 | 1,8 | 50 | 0,02 | 0,1 | 0,03 | 0,05 | 0,02 |
| Ejemplo 12 | >100 | 800 | >0,1 | >0,1 | 0,05 | >0,1 | 0,2 |
| Fac. Activador | >1,65 | >3,15 | 1,0 | >1,0 | 1,1 | >1,67 | 4,3 |
| Insecticida + Ejemplo 13 | 1,8 | <50,0 | 0,02 | 0,1 | 0,03 | 0,02 | 0,08 |
| Ejemplo 13 | 80 | 3.000 | >0,1 | >0,1 | 0,1 | >0,1 | 0,01 |
| Fac. Activador | 1,6 | >11,32 | 1,0 | >1,0 | 1,67 | >4,17 | 5,2 |
| Insecticida + Ejemplo 14 | 2,01 | 80 | 0,02 | >0,1 | >0,03 | 0,08 | 0,02 |
| Ejemplo 14 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | 0,15 | >0,1 | 0,18 |
| Fac. Activador | >1,48 | >20,83 | 1,0 | 1,0 | 2,0 | >1,04 | 4,1 |
| Insecticida + Ejemplo 15 | 2,5 | 100 | 0,02 | 0,1 | >0,03 | 0,007 | 0,02 |
| Ejemplo 15 | >100 | 10.000 | >0,1 | >0,1 | 0,2 | >0,1 | 0,15 |
| Fac. Activador | >1,2 | >16,67 | 1,0 | 1,0 | - | >12,0 | 3,75 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC |
|-----------------------------|-------------------|------------------|-------|------|
| Insecticida + Ejemplo 11 | 2,0 | <50,0 | 0,01 | 0,05 |
| Ejemplo 11 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,49 | >33,3 | >1,67 | >1,9 |
| Insecticida + Ejemplo 12 | 1,8 | 50 | 0,02 | 0,1 |
| Ejemplo 12 | >100 | 800 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,65 | >3,15 | 1,0 | >1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 13 | 1,8 | <50,0 | 0,02 | 0,1 |
| Ejemplo 13 | 80 | 3.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 1,6 | >11,32 | 1,0 | >1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 14 | 2,01 | 80 | 0,02 | >0,1 |
| Ejemplo 14 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,48 | >20,83 | 1,0 | 1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 15 | 2,5 | 100 | 0,02 | 0,1 |
| Ejemplo 15 | >100 | 10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,2 | >16,67 | 1,0 | 1,0 |

| SMC | CL | TBW | GPR |
|------|-------|-------|------|
| 0,05 | >0,03 | - | 0,02 |
| >0,1 | >0,2 | - | 0,18 |
| >1,9 | - | - | 4,1 |
| 0,1 | 0,03 | 0,05 | 0,02 |
| >0,1 | 0,05 | >0,1 | 0,2 |
| >1,0 | 1,1 | >1,67 | 4,3 |
| 0,1 | 0,03 | 0,02 | 0,08 |
| >0,1 | 0,1 | >0,1 | 0,01 |
| >1,0 | 1,67 | >4,17 | 5,2 |
| >0,1 | >0,03 | 0,08 | 0,02 |
| >0,1 | 0,15 | >0,1 | 0,18 |
| 1,0 | 2,0 | >1,04 | 4,1 |
| 0,1 | >0,03 | 0,007 | 0,02 |
| >0,1 | 0,2 | >0,1 | 0,15 |
| 1,0 | - | >12,0 | 3,75 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC | CL | TBW | GPR |
|--------------------------|----------------|---------------|-------|------|-------|-------|-------|
| Insecticida + Ejemplo 16 | 3,0 | 100 | 0,02 | 0,05 | 0,02 | 0,02 | 0,07 |
| Ejemplo 16 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| Fac. Activador | >1,0 | >16,67 | 1,0 | >1,9 | >3,33 | >4,2 | >1,22 |
| Insecticida + Ejemplo 17 | 2,0 | 50,0 | 0,007 | 0,03 | 0,02 | 0,05 | 0,002 |
| Ejemplo 17 | 85 | 3.000 | >0,1 | 0,1 | 0,15 | >0,1 | 0,07 |
| Fac. Activador | 1,4 | >11,32 | >2,4 | 3,2 | 3,0 | >1,67 | 23,9 |
| Insecticida + Ejemplo 18 | 1,8 | 30 | 0,007 | 0,02 | 0,02 | 0,007 | 0,003 |
| Ejemplo 18 | 80 | 800 | >0,1 | 0,1 | 0,08 | 0,1 | 0,07 |
| Fac. Activador | 1,6 | >5,2 | >2,4 | 4,7 | 2,22 | 12,0 | 15,9 |
| Insecticida + Ejemplo 19 | 2,0 | 70,0 | 0,02 | 0,05 | >0,03 | 0,05 | 0,003 |
| Ejemplo 19 | >100 | 3.000 | >0,1 | >0,1 | 0,03 | >0,1 | 0,08 |
| Fac. Activador | >1,5 | >8,1 | 1,0 | >1,9 | - | >1,67 | 17,4 |
| Insecticida + Ejemplo 20 | 2,0 | 50 | 0,007 | 0,1 | 0,02 | 0,008 | 0,003 |
| Ejemplo 20 | >100 | 7.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | 0,15 |
| Fac. Activador | 1,5 | >24,5 | >2,4 | >1,0 | 3,33 | >10,4 | 25,0 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC |
|-----------------------------|-------------------|------------------|-------|------|
| Insecticida + Ejemplo 16 | 3,0 | 100 | 0,02 | 0,05 |
| Ejemplo 16 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,0 | >16,67 | 1,0 | >1,9 |
| Insecticida + Ejemplo 17 | 2,0 | 50,0 | 0,007 | 0,03 |
| Ejemplo 17 | 85 | 3.000 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | 1,4 | >11,32 | >2,4 | 3,2 |
| Insecticida + Ejemplo 18 | 1,8 | 30 | 0,007 | 0,02 |
| Ejemplo 18 | 80 | 800 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | 1,6 | >5,2 | >2,4 | 4,7 |
| Insecticida + Ejemplo 19 | 2,0 | 70,0 | 0,02 | 0,05 |
| Ejemplo 19 | >100 | 3.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,5 | >8,1 | 1,0 | >1,9 |
| Insecticida + Ejemplo 20 | 2,0 | 50 | 0,007 | 0,1 |
| Ejemplo 20 | >100 | 7.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 1,5 | >24,5 | >2,4 | >1,0 |

| SMC | CL | TBW | GPR |
|------|-------|-------|-------|
| 0,05 | 0,02 | 0,02 | 0,07 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| >1,9 | >3,33 | >4,2 | >1,22 |
| 0,03 | 0,02 | 0,05 | 0,002 |
| 0,1 | 0,15 | >0,1 | 0,07 |
| 3,2 | 3,0 | >1,67 | 23,9 |
| 0,02 | 0,02 | 0,007 | 0,003 |
| 0,1 | 0,08 | 0,1 | 0,07 |
| 4,7 | 2,22 | 12,0 | 15,9 |
| 0,05 | >0,03 | 0,05 | 0,003 |
| >0,1 | 0,03 | >0,1 | 0,08 |
| >1,9 | - | >1,67 | 17,4 |
| 0,1 | 0,02 | 0,008 | 0,003 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | 0,15 |
| >1,0 | 3,33 | >10,4 | 25,0 |

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC | CL | TBW | GPR |
|--------------------------|----------------|---------------|-------|------|-------|-------|-------|
| Insecticida + Ejemplo 21 | 2,0 | 80,0 | 0,02 | 0,01 | 0,005 | >0,1 | 0,07 |
| Ejemplo 21 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | 0,2 | >0,1 | 0,15 |
| Fac. Activador | >1,5 | >20,83 | 1,0 | >1,0 | 13,33 | - | 1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 22 | 1,5 | 50,0 | 0,007 | 0,1 | 0,007 | 0,1 | |
| Ejemplo 22 | >100 | 8.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | |
| Fac. Activador | >2,0 | 727,58 | >2,4 | >1,0 | >9,5 | >1,0 | |
| Insecticida + Ejemplo 23 | 2,0 | 300,0 | 0,007 | >0,1 | >0,03 | 0,007 | 0,003 |
| Ejemplo 23 | 100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | 0,18 |
| Fac. Activador | 1,5 | >5,55 | >2,4 | - | - | >11,9 | 27,27 |
| Insecticida + Ejemplo 24 | 2,0 | 300,0 | 0,015 | >0,1 | - | 0,01 | 0,007 |
| Ejemplo 24 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| Fac. Activador | >1,5 | >5,55 | 1,0 | - | - | >8,3 | >12,2 |
| Insecticida + Ejemplo 25 | 2,8 | >1.000 | - | 0,1 | 0,03 | 0,05 | 0,1 |
| Ejemplo 25 | >100 | >10.000 | >0,1 | 0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| Fac. Activador | 1,0 | - | - | - | >2,2 | >1,67 | 1,0 |

(1) Insecticida = N-(mercaptometil)ftalimida-S-(8,0-dimetil:osforoditioato).

TABLA II (Continuación)

| | Susceptible HF | Resistente HF | GR | SMC |
|-----------------------------|-------------------|------------------|-------|------|
| Insecticida + Ejemplo 21 | 2,0 | 80,0 | 0,02 | 0,01 |
| Ejemplo 21 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,5 | >20,83 | 1,0 | >1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 22 | 1,5 | 50,0 | 0,007 | 0,1 |
| Ejemplo 22 | >100 | 8.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >2,0 | 727,58 | >2,4 | >1,0 |
| Insecticida + Ejemplo 23 | 2,0 | 300,0 | 0,007 | >0,1 |
| Ejemplo 23 | 100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | 1,5 | >5,55 | >2,4 | - |
| Insecticida + Ejemplo 24 | 2,0 | 300,0 | 0,015 | >0,1 |
| Ejemplo 24 | >100 | >10.000 | >0,1 | >0,1 |
| Fac. Activador | >1,5 | >5,55 | 1,0 | - |
| Insecticida + Ejemplo 25 | 2,8 | >1.000 | - | 0,1 |
| Ejemplo 25 | >100 | >10.000 | >0,1 | 0,1 |
| Fac. Activador | 1,0 | - | - | - |

(1) Insecticida = N-(mercaptometil)ftalimida-S-(0,0-dimetilfosforodi

| SMC | CL | TBW | GPR |
|------|-------|-------|-------|
| 0,01 | 0,005 | >0,1 | 0,07 |
| >0,1 | 0,2 | >0,1 | 0,15 |
| >1,0 | 13,33 | - | 1,0 |
| 0,1 | 0,007 | 0,1 | |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | |
| >1,0 | >9,5 | >1,0 | |
| >0,1 | >0,03 | 0,007 | 0,003 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | 0,18 |
| - | - | >11,9 | 27,27 |
| >0,1 | - | 0,01 | 0,007 |
| >0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| - | - | >8,3 | >12,2 |
| 0,1 | 0,03 | 0,05 | 0,1 |
| 0,1 | >0,2 | >0,1 | >0,2 |
| - | >2,2 | >1,67 | 1,0 |

i:osforoditioato).

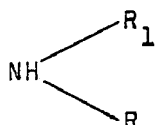
La forma precisa en la que deben utilizarse los compuestos pesticidas de este invento, en algún caso particular, son fáciles de adivinar por los técnicos en este campo. Generalmente, los compuestos pesticidas activos, serán incluidos en alguna forma de composición líquida; por ejemplo, una emulsión, suspensión o spray, Mientras que la concentración del compuesto pesticida activo de la presente formulación puede variar dentro de límites bastante amplios, ordinariamente, la composición pesticida no supondrá mas de un 50 % en peso de la formulación total.

En el término "alquilos inferiores" se trata de incluir grupos alquilos de cadena recta o ramificada, con 1 - 6 átomos de carbono. El término "alquil" se refiere a grupos alquilos de cadena recta o ramificada, con 1 - 10 átomos de carbono. El término "alcoxi inferiores" incluye un radical que tenga de 1 a 6 átomos de carbono; y el término "cicloalquil" incluye un radical con 3 - 8 átomos de carbono.

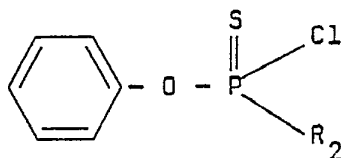
Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.

REIVINDICACIONES

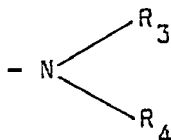
1a.- Procedimiento para la obtención de una com
posición insecticida activada, caracterizado porque, en una
 primera etapa, comprende hacer reaccionar una amina de fórmu-
 la general:



en la que R se elige del grupo formado por hidrógeno y alqui-
 lo inferior con 1 a 6 átomos de carbono; R₁ se elige del gru-
 po formado por hidrógeno, alquilo con 1 a 10 átomos de carbo-
 no y cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, con un compues-
 to de fórmula general:

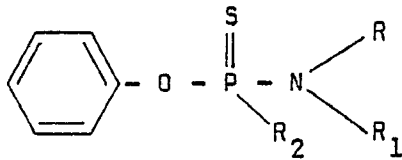


en la que R₂ se elige del grupo formado por alcoxi inferior
 con 1 a 6 átomos de carbono y un radical de fórmula general:



en la que R₃ y R₄ pueden ser idénticos o diferentes y se eli-
 gen del grupo formado por hidrógeno y alquilo inferior con 1
 a 6 átomos de carbono, en el seno de un disolvente y, en una

segunda etapa, mezclar un insecticida de la serie de los ftalimidotiofosfatos en una cantidad comprendida entre 1 a C,1 y 1 a 10 partes de compuesto insecticida por cada parte del producto de la reacción, de fórmula general:



en la que R, R₁ y R₂ tienen los significados anteriormente indicados.

2a.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque el insecticida es el N-(mercaptometil)ftalimida-S-(O,O-dimetilfosforoditioato).

10

3a.- Procedimiento para la obtención de una composición insecticida activada, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 21 hojas escritas a máquina por una sola cara.

15

Madrid 24 OCT. 1977
STAUFFER CHEMICAL.

J. W. GOMEZ ACEBO Y COMPA
p. p. Firmado: J. Suarez Diaz