

257762



un radical alcoholo que tiene de 1 a 6 átomos de carbonos y/o un átomo de halógeno y/o un grupo nitro, y R representa un radical alifático saturado o insaturado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono y que puede estar substituído, y cuya cadena de carbonos puede estar interrumpida por, al menos, un heteroátomo, un radical alcoholo o uno cicloalcoholo.

R representa, preferiblemente, un radical alcoholo o alqueno, tal como un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo o alcoholo.

Ar representa, preferiblemente, un radical 2:4-dinitro-6-alcoholifenilo, en el cual el grupo alcoholo es, especialmente, un grupo metilo o sec. butilo o el radical pentaclorofenilo.

Los compuestos de la invención se pueden preparar por métodos conocidos en sí mismos para la preparación de compuestos análogos,

Un método muy conveniente consiste en hacer reaccionar el compuesto OSCl_2 con un compuesto de la fórmula R-O-C-Cl , que se hace reaccionar, a continuación, con un compuesto de la fórmula Ar-OH , para obtener un compuesto que corresponde a la fórmula general I anteriormente mencionada. Otro método consiste en hacer reaccionar primero OSCl_2 con un compuesto de la fórmula ArOH para formar un compuesto de la fórmula Ar-O-C-Cl y, a continuación, hacer reaccionar este compuesto con un compuesto de la fórmula ROH , para obtener un compuesto que corresponde a la fórmula I anterior. Los siguientes ejemplos ilustran la preparación de los compuestos.

EJEMPLO I.

267762



Se añaden, gota a gota, 0,3 mol, de piridina a lo largo de unas 2 horas y a una temperatura de 10-20°C, sobre una solución de 0,3 mol. de 2:4-dinitro-6-sec.butilfenol y 0,3 mol, de etilester clorotionofórmico en 50 ml. de tetracloruro de carbono. Después de agitar durante un corto periodo de tiempo, se separa el clorhidrato de piridina. Se añade agua, mientras se agita continuamente, con lo cual se disuelve el sólido. Las capas líquidas resultantes se separan; se lava la solución, en tetracloruro de carbono, con agua y se seca sobre sulfato sódico. Después de separar el sulfato sódico, se evapora el disolvente a presión inferior a la atmosférica. El etil-(2:4-dinitro-6-sec.butilfenil)tionocarbonato residual se recoge en forma de un aceite pardo rojizo. El rendimiento es, substancialmente, 100%. El análisis cromatográfico pudo solamente mostrar trazas de dinitro sec. butilfenol. Se puede evitar la presencia de este compuesto utilizando un pequeño exceso de etilester clorotionofórmico y piridina.

20 EJEMPLO II

Se añaden gota a gota, a lo largo de una hora aproximadamente, 0,25 mol. de dimetilanilina sobre una solución de 0,25 mol. de 2:4-dinitro-ortocresol y 0,25 mol. de metilester clorotionofórmico en 250 ml. de tolueno. Después de agitar durante un corto periodo de tiempo, se separa el clorhidrato de dimetilanilina. Se añade agua, mientras se continua la agitación, con lo cual se disuelve el sólido. Se separan las capas líquidas. La solución toluénica se lava con agua y se seca con el sulfato sódico. Después de separar el sulfato sódico, se evapora

267762



el disolvente bajo presión inferior a la atmosférica.
El metil (2:4-dinitro-6-metilfenil) tionocarbonato residual, se recupera en forma de un aceite pardo rojizo que solidifica a la temperatura ambiente. El rendimiento es, substancialmente, de 100%. El análisis cromatográfico mostró solamente, una pequeña cantidad de dinitro ortocresol.

Las composiciones herbicidas y fungicidas se pueden preparar mezclando uno o más de los compuestos de dicha fórmula general con un vehículo sólido o líquido y, si se desea, un agente dispersante, emulgente, agente humectante u otro ingrediente usual en las composiciones herbicidas y fungicidas.

Los polvos para fumigar pueden contener generalmente de 50 a 90% en peso de substancia activa, si ésta es un sólido, y el resto es un agente dispersante, por ejemplo, sulfonato de lignina, metoxi-celulosa o carboximetilcelulosa, un agente humectante, por ejemplo, un ester de un glocóler polietilénico o un sulfonato de alcohol-arilo, y como vehículo, por ejemplo atapulgita, una sal inorgánica o creta.

Si la substancia activa es un líquido o tiene naturaleza oleosa, su contenido, en un polvo de fumigación, puede ser inferior al 50% en peso, por ejemplo, el 25% en peso. La substancia líquida u oleosa se absorbe sobre vehículos adsorbentes, como por ejemplo, tierra de diatomeas, atapulgita y un silicato cálcico sintético.

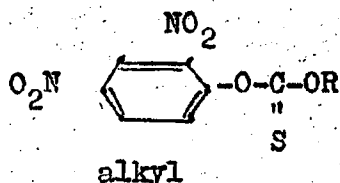
Se puede preparar una composición líquida disolviendo uno o más compuestos activos en un disolvente corriente o una mezcla de disolventes. Los alcoholes, ce-

267762



tonas, éteres, hidrocarburos aromáticos, como benceno y tolueno, y fracciones de petróleo son disolventes adecuados. Si se desea, se pueden añadir agentes dispersantes, humectantes, o emulsificantes.

5 La tabla I siguiente ilustra la acción herbicida o fungicida de cierto número de compuestos, correspondientes a la fórmula.



definiéndose en la tabla I los grupos R y alcohilo. Los ensayos, respecto de la acción herbicida, se realizaron con plantas de tomate tempranas.

15 Los compuestos se pulverizaron sobre plantas de tomate que tenían una altura de 10 a 15 cm., formando parte de líquidos para pulverizaciones con concentraciones de compuesto activo de 1/16, 1/32, 1/64, 1/128 y 1/256 %.

20 Se continuó la pulverización hasta que el líquido empezó a gotear de las hojas. El líquido de pulverización se obtuvo mezclando con agua las composiciones anteriormente mencionadas, para obtener las concentraciones deseadas.

25 En la tabla I se indican los resultados obtenidos al cabo de un día, dos días, y siete días, respectivamente, y en dicha Tabla los símbolos tienen los siguientes significados:

xxx - exterminación total.

30 xx - graves daños.



257762

x - daños ligeros

y o - sin daños

TABLA I

Alcoholo	R	Días	1/16	1/32	1/64	1/128	1/356
5 1. sec. C H 4 9	C H 2 5	1	xxx	xxx	xxx	xxx	xx
		2	xxx	xxx	xxx	xxx	xx
		7	xxx	xxx	xxx	xxx	xx
10 2. sec. C H 4 9	C H 3	1	xxx	xxx	xxx	xxx	xxx
		2	xxx	xxx	xxx	xxx	xxx
		7	xxx	xxx	xxx	xxx	xxx
15 3. CH 3	C H 3	1	xxx	xxx	xxx	xx	xx
		2	xxx	xxx	xxx	xxx	xxx
		7	xxx	xxx	xxx	xxx	xxx
20 4. CH 3	C H 2 5	1	xxx	xxx	xxx	xx	xx
		2	xxx	xxx	xxx	xx	xx
		7	xxx	xxx	xxx	xxx	xx
20 2:4-dinitro o-cresol (D.N.O.C)		1	xxx	xxx	xx	xx	x
		2	xxx	xxx	xx	xx	x
		7	xxx	xxx	xxx	xx	x

La acción fungicida de algunos de los compuestos se ha determinado ensayéndolos sobre Fusarium culmorum, empleando jugo de cereza como estimulante. Se encontró así que el valor DL_{50} del compuesto 1 de la tabla I es de 33.

Asimismo, se han obtenido resultados satisfactorios al pulverizar metil (pentaclorofenil) tionocarbonato sobre plantas de tomate tempranas. Los resultados se mues



987762

267762

tren en la tabla II.

TABLA II

		Concentración, % en peso.			
5	Metil (pentaclorofenil) tionocarbonato	1 xxx	1/4 xxx	1/16 xx	1/64 o

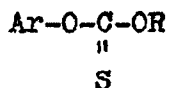
10 Los compuestos de la invención tienen una acción herbicida de contacto. Contrariamente a los compuestos herbicidas conocidos, a base de 2:4-dinitro-*o*-cresol, el cual es muy tóxico para los seres humanos, irritando las mucosas y coloreando la piel y el pelo de los trabajadores, los presentes compuestos no irritan las mucosas y no tienen propiedades colorantes.

15 Esta solicitud, que corresponde a la presentada en Gran Bretaña, el 30 de Mayo de 1960, bajo el número 19.073/60, se acoge a los beneficios del Artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

- N O T A -

25 Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

1ª.- Un método para la preparación de compuestos que corresponden a la fórmula general:



201102

267762



en la cual Ar representa un radical fenilo o naftilo, sustituido, por lo menos en una posición, por un radical alcoholilo, que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y/o un átomo de halógeno y/o un grupo nitro, preferentemente un radical 2:4 -dinitro-6-alcoholifenilo o un radical pentacloro-
5 fenilo, y R representa un radical alifático saturado o no saturado, que tiene de 1 a 10 átomos de carbono y que puede estar substituido y cuya cadena de carbonos puede estar interrumpida por, al menos, un heteroátomo, un radical
10 alcoholilo o uno cicloalcoholilo, preferentemente un radical inferior alcoholilo o alquenilo, método que comprende de la reacción de CSCl_2 con un compuesto de la fórmula R-OH , para formar un compuesto de la fórmula R-O-CS-Cl , y la reacción subsiguiente de éste compuesto con un compuesto de la fórmula ArOH , en la cual R y Ar, tienen los
15 significados que se les ha dado más arriba.

2º.- Un método para la preparación de compuestos como se indican en el punto 1, que comprende la reacción de CSCl_2 con un compuesto de la fórmula ArOH para
20 formar un compuesto de la fórmula Ar-O-CS-Cl y la reacción subsiguiente de este compuesto con un compuesto de la fórmula R-OH , en cuyas fórmulas R y Ar tienen los significados que se les da en el punto 1.

3º.- Un método para la preparación de compuestos como se indican en cualquiera de los puntos 1 ó 2, en los cuales R representa un radical etilo y Ar representa un radical 2:4-Dinitro-6-Sec.butilfenilo.
25

4º.- Un método para la preparación de compuestos como se indican en cualquiera de los puntos 1 ó 2, en los cuales R representa un radical metilo y Ar representa
30



267762

un radical como se indica en 3.

5 5^a.- Un método para la preparación de compuestos como se indica en cualquiera de los puntos 1 ó 2, en los cuales R representa un radical metilo y Ar representa un radical 2:4-dinitro-6-metilfenilo.

6^a.- Un método para la preparación de compuestos como se indican en cualquiera de los puntos 1 ó 2, en los cuales R representa un radical etilo y Ar representa un radical como se indica en 5.

10 7^a.- Un método para la preparación de compuestos como se indican en cualquiera de los puntos 1 ó 2, en los cuales R representa un radical metilo y Ar representa un radical pentaclorofenilo.

15 8^a.- Un método para preparar composiciones herbicidas o fungicidas, caracterizadas porque contienen un compuesto, como se indica en cualquiera de los puntos 1 a 7, mezclado con un vehículo sólido o líquido.

20 9^a.- Un método para preparar composiciones herbicidas o fungicidas, caracterizadas porque contienen, también, un agente dispersante, emulsificante, agente humectante u otro ingrediente de uso normal en las composiciones herbicidas o fungicidas.

25 10^a.- El método de exterminar plantas que comprende el contacto de las plantas con, por lo menos, un compuesto de los reivindicados en cualquiera de los puntos 1 a 7.

30 11^a.- El método de exterminar hongos, que comprende el contacto de los hongos con, por lo menos un compuesto de los reivindicados en cualquiera de los pun-



267762

tos 1 a 7.

12º.- Un método para la preparación de compuestos químicos.

5 Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede, con los fines que se han especificado.

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

Madrid, 27 MAY. 1961

P. A.
[Handwritten signature]

MB/ - *ho*