

PATENTE DE INTRODUCCION

SC. 2259

12 FEB



285065

285065

*Memoria Descriptiva*

*sobre:*

"Procedimiento para la obtención de productos para combatir los seres perjudiciales para los vegetales, que comprenden como cuerpos activos derivados de benzoxazolones".

*Solicitante:*

---

SOCIETE DES USINES CHIMIQUES RHONE-POULENC,  
entidad francesa, residente en 22, Avenue  
Montaigne, PARIS, Francia.

---

El presente invento tiene por objeto la obtención de ciertos derivados de benzoxazolón que constituyen cuerpos de acción biológica muy eficaz, y en particular, pueden introducirse como

5. fungicidas en la agricultura para combatir los

- 2 - 285065

12 FEB.



- seres perjudiciales. Las sustancias activas según el presente invento corresponden a la fórmula general 1 adjunta, en la que X indica unos substituyentes sobre el núcleo aromático, a saber un halógeno y/o grupos nitro y/o hidrógeno y/o radicales de hidrocarburos alifáticos que tengan de 1 a 6 átomos de C e Y el grupo triclorometilsulfenilo.
- 5.
- Los benzoxazolones se fabrican del modo conocido. La introducción del radical triclorometilsulfenilo sobre el nitrógeno puede efectuarse haciendo reaccionar el cloruro de triclorometilsulfenilo con los benzoxazolones apropiados en presencia de agentes de fijación de los ácidos, según la fórmula 2 adjunta.
- 10.
- Se sabe en verdad, que imidas cíclicas de ácidos dicarboxílicos son fáciles de condensar con el perclorometilmercaptano, pero hasta el presente esta reacción no se ha efectuado con los benzoxazolones.
- 15.
- Los derivados de benzoxazon citados poseen en particular propiedades fungicidas. Ya es conocido por diferentes publicaciones que el benzoxazon mismo desarrolla una buena actividad fungistática. Entre un gran número de derivados ensayados de otra clase que los del invento, el benzoxazon se muestra hasta el más activo, según se ha descrito en la revista "die Naturwissenschaften", 1956, página 281.
- 20.
- Las plantas soportan de un modo característico los productos del invento. Esto no sucede
- 25.
- 30.

12 FEB



5. sin relación con el hecho de que ciertos benzoxazoles constituyen productos de transformación vegetales. Los compuestos de triclorometilsulfenilo se distinguen por una reducida tensión de vapor, lo cual puede ser ventajoso en la técnica de utilización. De un modo muy general, los productos del invento se distinguen de los compuestos de tricolorometilsulfenilo conocidos por el hecho ya mencionado de que sus cuerpos de base tienen ya a su vez una acción fungicida notable.
- 10.

15. Para su utilización entre los seres perjudiciales, se pueden añadir a los productos de invento, agentes humectantes, cargas, soportes, disolventes, etc. según el uso particular al que se les destine. Se les puede utilizar en asociación con otros fungicidas conocidos, tales como por ejemplo, el derivado de la imida tetrahidroftálica con el triclorometilsulfenilo conocido con el nombre de "Captan", las sales metálicas conocidas del ácido etileno-bis-ditiocarbámico, productos cuprosos, preparaciones azufradas u otras.
- 20.

Los ejemplos no limitativos que siguen permitirán comprender con facilidad el modo en que el invento puede ejecutarse en la práctica.

25. EJEMPLO 1 -

30. Se disuelven 5 partes en peso de benzoxazolón en 81,5 partes en volumen de lejía de sosa semi normal y se mezcla con ella en el espacio de 5 minutos, con agitación, la solución de 7,43 partes en peso de perclorometilmercaptano en 50 partes



en volumen de benceno. Después de 2 horas se separa, por aspiración y luego se concentra en el vacío la fase benzólica después de secado sobre sulfato de sosa y se hace recristalizar en la ligroína el producto bruto gris manchado.

5.

El producto obtenido funde a 103-104°C.

Fórmula :  $C_8H_4C_2NSCl_3$ .

Peso molecular: 284,5.

Según el cálculo: N = 4,93%; S = 11,25%; Cl = 37,45%

10.

Según el análisis: N = 5,32%; S = 10,96%; Cl = 36,51%

El producto impide la germinación de la "alternaria tenuis" a la dosis de 2  $\gamma/cm^2$  para un período de observación de 24 horas.

EJEMPLO 2 -

15.

Se disuelven 3 partes en peso de 6-bromobenzoxazolón en 28 partes en volumen de lejía de sosa semi normal. Se introduce en ella, con agitación, en el espacio de 5 minutos, la mezcla de 2,59 partes en peso de perclorometilmercaptano en 30 partes en volumen de benceno, se separa después de 2 horas la fase orgánica, se la seca en sulfato de sodio y se retira el disolvente. Después de recristalización del producto en la ligroína, se obtiene un producto que funde a 102-105°C.

20.

En un ensayo de germinación de esporas de "alternaria tenuis" la dosis enteramente mortal es igual a 0,6  $\gamma/cm^2$  para una duración de observación de 24 horas.

25.

EJEMPLO 3 -

30.

Se disuelven 10 partes en peso de 6-ni-



285065

- trobenzoxazolón en 108 partes en volumen de lejía de sosa semi-normal y después de añadir 100 partes de agua, se añaden gota a gota en el espacio de 5 minutos y con agitación, 10,04 partes en peso de
5. perclorometilmercaptano disueltas en 100 partes en volumen de benceno, lo cual da un precipitado amarillo. Después de 2 horas, se separa por aspiraciones y se concentra la fase orgánica en vacío. Los productos brutos reunidos dan después de recristalización en la ligroína una substancia que funde a
10. 138-140°C.
- EJEMPLO 4 -
- En una solución de 14,8 partes en peso de 5-ter-butilbenzoxazolón-(2) en 155 partes en volumen de lejía de sosa semi-normal, después de dilución con 100 partes en peso de agua se vierte gota a gota a la temperatura de 5°C, una solución de 14,4 partes en peso de perclorometilmercaptano en 300 partes en volumen de benceno. Después de seguir agitado durante 3 horas a 10°C, se separa, se seca y se concentra en vacío la fase benzólica. El residuo cristaliza por enfriamiento; se le vuelve a tratar con 50 cm<sup>3</sup> de ligroína y se le hace cristalizar en vacío. El punto de fusión de los cristales es de 87-90°C.
20. La proporción en azufre se eleva a 9,3% (9,4% según el cálculo).
- 25.

EJEMPLO 5 -

- Se hacen reaccionar 4,1 partes en peso de 5,7-diclorometilmercaptano en 50 partes en peso de perclorometilmercaptano en 50 partes en volu-
- 30.

285065



- men de benceno en presencia de 40 partes de volumen de lejía de sosa seminormal, a una temperatura de 5 l 10°C. Cuando no se puede descubrir vestigio alguno de perclorometilmercaptano, se trata como en el
5. Ejemplo 4. Después de recistralización en una mezcla ligrofina-benceno, se obtienen cristales que funden a 105-110°C. Este producto impide muy bien la germinación de las esporas de "Alternaria tenuis".

N O T A

10. 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
15. principio fundamental, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Introducción por 10 años en España: "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE PRODUCTOS PARA COMBATIR LOS SERES PERJUDICIALES PARA LOS VEGETALES,
20. QUE COMPRENDEN COMO CUERPOS ACTIVOS DERIVADOS DE BENZOXAZOLONES"; caracteriznacodse por lo siguiente:
- 1ª.- Procedimiento para la obtención de
25. productos para combatir los seres perjudiciales para los vegetales, que comprenden como cuerpos activos derivados de benzoxazolones, substituídos que responden a la fórmula l adjunta, en la que X indica substituyentes sobre el núcleo aromático, a saber un halógeno y/o grupos nitro y"o hidrógeno y/o
30. radicales de hidrocarburos alifáticos que tengan



de 1 a 6 átomos de carbono e Y el grupo triclorometilsulfenilo, caracterizado porque la introducción del radical triclorometilsulfenilo sobre el nitrógeno puede efectuarse haciendo reaccionar el cloruro

5. de triclorometilsulfenilo con los benzoxazolones apropiados en presencia de agentes de fijación de los ácidos según la fórmula 2 adjunta.

2ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado porque los cuerpos activos van asociados con agentes humectantes, cargas, soportes o disolventes y/o otros fungicidas.

10.

3ª.- Procedimiento para la obtención de productos para combatir los seres perjudiciales para los vegetales, que comprenden como cuerpos activos derivados de benzoxazolones, tal y como queda substancialmente descrito en la presente Memoria.

15.

Esta memoria consta de siete hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 12 FEB. 1953

SOCIÉTÉ DES USINES CHIMIQUES  
RHONE-POULENC.

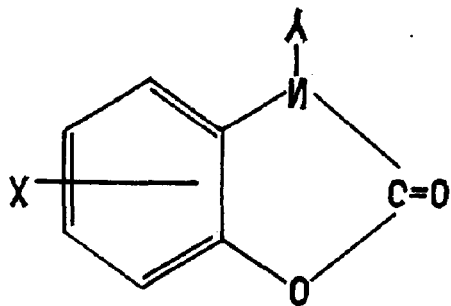
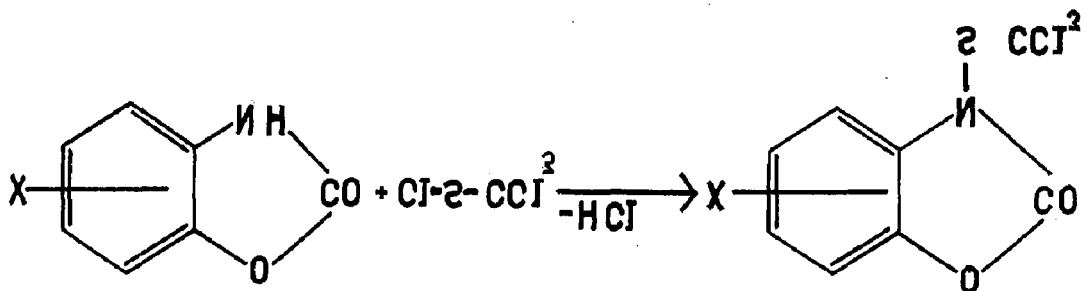
GOMEZ ACEBO Y MODET

1° GOMES ~~WESLEY~~ ~~MODES~~

СНОМЕ ВОЛГЕНС  
СОЦИЕТЕ ДЕС НАИЕС ИХИМИЧЕС

MADRID DE 1883

1883



1883

1883