

326803



CASE 5693/E

326803

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

por "PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR AGENTES ANTIPARASITARIOS",
a favor de la firma suiza CIBA SOCIETE ANONYME, domiciliada
en Basilea (Suiza).

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

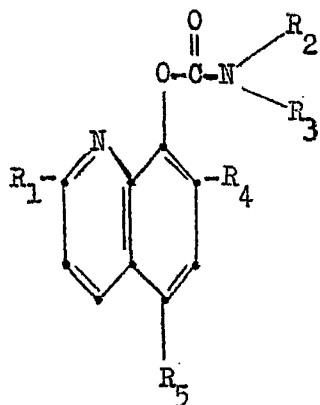
Este invento se refiere a agentes para comba-
tir a los parásitos, (en particular a los microorganismos, los
protozoos y los insectos nocivos, ácaros, nemátodos, cangre-
jos y moluscos), agentes que se caracterizan por contener, co-
5. como materia activa, un compuesto de la fórmula general

326803

16



- 2 -



(I)

5.

10.

en la que

15.

R_1 y R_2 significan un átomo de hidrógeno o un radical metílico,

20.

R_3 significa un radical alquílico inferior con 1 a 4 átomos de carbono, un radical cloroalquílico o un radical fenílico insustituido o, respectivamente, sustituido por $-NO_2$, halógeno (de preferencia, cloro), $-CF_3$ o por un radical alquílico inferior con 1 a 4 átomos de carbono, mientras que

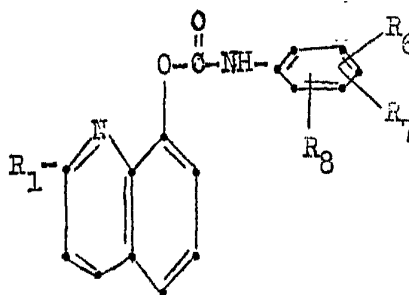
R_4 y R_5 significan un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno,

o las sales de estos compuestos con ácidos, así como, eventualmente, uno por lo menos de los aditivos siguientes: disolventes, diluentes, dispersantes, humectantes, fijadores o también otros agentes antiparasitarios.



El invento atañe en grado particular a los agentes del tipo mencionado para combatir a los microorganismos que contienen, como materia activa, un compuesto de la fórmula general

5.



10.

(II)

15.

en la que

- R_1 significa un átomo de hidrógeno o un radical metílico,
- R_6 significa un radical alquílico con 1 a 4 átomos de carbono, el grupo $-NO_2$, el grupo $-CF_3$ o un átomo de halógeno (de preferencia, cloro),
- R_7 significa un átomo de hidrógeno, un radical alquílico con 1 a 4 átomos de carbono o un átomo de halógeno y

20.

326803

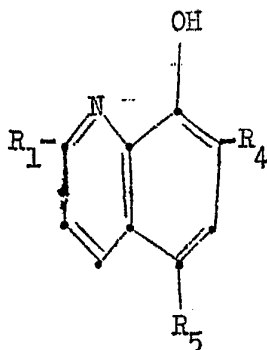
- 4 -



R_3 significa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno (de preferencia, cloro),
o una sal de un compuesto de esta índole con un ácido.

5. Los compuestos de la fórmula general (I) pueden prepararse por métodos ya de sí conocidos; por ejemplo; haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula general

10.



15.

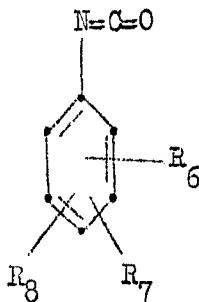
en la que

20. R_1 , R_4 y R_5 tienen el significado expuesto en el caso de la fórmula general (I),

con un isocianato de arilo, de la fórmula general



5.



- en la que
10. R significa un radical alquílico inferior con 1 a 4 átomos de carbono o un radical cloroalquílico, en presencia de un disolvente orgánico inerte, por ejemplo éter, dioxano o benceno.
15. Los compuestos de la fórmula general (1) pueden utilizarse en la lucha general contra los parásitos, en la protección de las plantas y asimismo en la higiene. En esto resulta ser sumamente ventajoso que los compuestos en cuestión, empleados, por ejemplo, en la protección de las plantas,
20. no presenten fenómenos tóxicos secundarios respecto al organismo huésped a las concentraciones con que son necesarios para la actuación antiparasitaria. El empleo de estos compuestos para combatir a los organismos nocivos es posible en amplia base; por ejemplo, también en la protección de la madera, para la conservación de los más diversos productos indus-

326803



- 6 -

triales, para proteger los materiales de fibra contra los microorganismos nocivos, para conservar los productos de la agricultura, como agentes de desinfección, en la medicina veterinaria y en el caseo corporal.

5. Particular importancia tiene para ello el hecho de que los compuestos de este invento no pierdan su actividad bactericida y fungicida ni aún en presencia de cuerpos albuminosos y jabones. Los compuestos en cuestión no tienen ningún olor propio molesto y son bien tolerables para la piel, por lo menos para la piel sana.

10. Como ejemplos para el empleo de los compuestos en la protección de las plantas, cabe citar el tratamiento de las semillas vegetales y de plantas total o parcialmente desarrolladas, así como del terreno en que crecen las plantas, 15. contra los organismos nocivos, en particular contra los hongos perjudiciales, las esporas nicóticas y las bacterias.

- Entre los productos industriales que pueden conservarse o respectivamente desinfectarse con ayuda de los compuestos de la fórmula general (I), cabe destacar, a título de ejemplos, los siguientes: agentes auxiliares y, respectivamente, agentes de acabado de la industria textil, colas, fijadores o adhesivos, pinturas, espesantes, colorantes, pastas de estampar y preparaciones semejantes a base de colorantes o pigmentos orgánicos e inorgánicos, aún de los que con-



tienen adiciones de casina u otros compuestos orgánicos.

Asimismo las pinturas para paredes y techos, por ejemplo las que contienen un aglutinante para pinturas provisto de albúmina, quedan protegidas del ataque de los parásitos por una

5. adición de estos compuestos.

Los compuestos de la fórmula general (I) pueden emplearse además para la protección de fibras y géneros textiles, en los que despliegan buena acción contra los organismos nocivos, por ejemplo los hongos y las bacterias. La

20. adición de los compuestos puede efectuarse antes del tratamiento, al mismo tiempo que el tratamiento o después del tratamiento de estos géneros textiles con otras materias, por ejemplo colorantes, pastas de estampar, aprestos, etc.

Los géneros textiles así tratados presentan

15. también protección contra la aparición de olor sudoral como el que ocasionan los microorganismos.

También puede utilizarse estos compuestos como agentes de conservación en la industria de la celulosa y del papel, entre otras cosas para prevenir la conocida formación micilaginosa originada por microorganismos en las instalaciones empleadas para la fabricación de papel.

20.

Como otros agentes antiparasitarios que pueden emplearse junto con las materias activas de la fórmula general (I), cabe citar: otros fungicidas, bactericidas y asimismo acaricidas, insecticidas y fertilizantes.

326803



- 8 -

Según la naturaleza de los aditivos con que se combinen las materias activas en los agentes según este invento, se obtienen composiciones que son sumamente aptas para la limpieza, la desinfección o el aseo corporal.

5. Asi, mediante combinación, por ejemplo, de compuestos de este invento, con materias detergentes o tensioactivas, se llega a agentes para lavado y limpieza que tienen excelente acción antibacteriana y antimicótica. Los compuestos de la fórmula general (I) pueden, por ejemplo, incorporarse a jabones, combinarse con materias detergentes o tensioactivas exentas de jabones o combinarse junto con mezclas de jabones y materias detergentes exentas de jabones.

10. Como ejemplos de compuestos detergentes exentos de jabones que pueden emplearse en mezcla con las materias utilizadas según este invento, cabe citar: sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alcohol graso, productos de condensación de ácidos grasos y metiltaurina, productos de condensación de ácidos grasos con sales de ácido oxietansulfónico, productos de condensación de albúmina y ácido graso, sulfonatos de alquilo, productos no ionógenos (por ejemplo, productos de condensación de alquifenoles y óxidos de etileno) y compuestos cationactivos. Los compuestos de la fórmula general (I) pueden emplearse también en agentes para lavado grosero, a caso junto con un fosfato condensado, por ejemplo tripolifosfato



alcalino al 20 a 50%, pero también en presencia de una materia orgánica liófila polímera, que aumente la capacidad del baño de lavado para el arrastre de la suciedad, por ejemplo una sal alcalina de la carboximetilcelulosa (ácido glicólico de celulosa).

5. No sólo la actividad antibacteriana y antimicótica de los compuestos de la fórmula general (I) no experimenta ninguna merma por la adición de agentes de limpieza (por ejemplo, de productos anionactivos, cationactivos o no ionógenos), sino que en muchos casos se logra con tal combinación un asombroso aumento de la acción.

10. Los agentes de limpieza con acción desinfectante obtenidos de esta manera pueden utilizarse, por ejemplo, en la lavandería. Para ello es una ventaja que las nuevas 15. materias activas, empleadas en la concentración correspondiente, pasan del baño de lavado al material fibroso y confieren a éste un apresto antibacteriano y antimicótico duradero.

20. Los agentes de limpieza de este invento que contienen los compuestos de la fórmula general (I) pueden utilizarse también como depuradores industriales o como agentes de limpieza doméstica, así como en las industrias alimenticias, por ejemplo granjas lecheras, fábricas de cerveza y mataderos.

También pueden utilizarse estos compuestos como parte integrante de preparaciones destinadas a fines de lim-

326803



- 10 -

- pieza o desinfección en los hospitales y en la práctica médica; así, por ejemplo, en la limpieza de la ropa de los enfermos, las sales y las instalaciones. Para ello los compuestos, si es preciso, pueden combinarse con otros agentes de desinfección y productos de actividad antiseptica, con lo cual es posible ajustarse a los requisitos de limpieza o desinfección existentes para cada caso. El hecho de que los compuestos no pierdan su actividad contra los microorganismos ni aún en presencia de sangre o suero, tiene aquí particular importancia.
- 5.
- 10.

- Los compuestos pueden emplearse también (si es preciso junto con otras materias bactericidas o fungicidas, agentes protectores de la piel, etc.) para las preparaciones que sirven para una limpieza de la piel (por ejemplo, de las manos) con efecto antibacteriano o antimicrobiano. Constituyen además agentes eficaces contra la aparición de olor corporal desagradable como el que se produce por la acción de microorganismos. Aquí es asimismo una ventaja que no se produzcan irritaciones cutáneas, por lo menos en la piel sana, y que los compuestos empleados según este invento carezcan de olor propio molesto, a diferencia de lo que ocurre, por ejemplo, con los fenoles clorados.
- 15.
- 20.

Como aditivos de acción microbicida que pueden hallarse en los agentes de este invento además de los com-



puestos de la fórmula general (I), cabe citar, a título de ejemplo:

5. El alcohol 3,4-diclorobencílico,
los compuestos de amino (como, por ejemplo, el cloruro de diisobutilfenoxietoxietil-dimetil-bencilamonio, el cloruro de cetilpiridinio y el bromuro de cetil-trimetilamonio,
los dioxidifenilmetanos halogenados,
10. el disulfuro de tetrametiltiuramo,
el 2,2'-tio-bis-(4,6-dicloro-fenol),
los compuestos orgánicos que contienen el grupo tiotridrometílico, como los que se describen en las patentes norteamericanas nº 2.553.772, 2.553.770,
15. 2.553.775, 2.553.773, 2.553.774, 2.553.777 y 2.553.778,
el yoduro de 2-nitro-2-furfurilo (véase la patente austríaca nº 210.411),
las salicilanilidas,
20. las diclorosalicilanilidas,
las dibromosalicilanilidas,
las tribromosalicilanilidas,
el ácido diclorocianúrico,
las tetraclorosalicilanilidas,
los sulfuros de tiuramo alifáticos y

326803

16



- 12 -

el hexaclorofeno (2,2'-dihidroxi-3,5,6-3',5',6'-hexa-
clorodifenilmetano).

Los agentes de acción desinfectante de este

5. invento pueden contener además como aditivos antioxidantes, agentes antiactínicos, aclaradores ópticos, desendurecedores, materias odoríferas, etc.

A tenor de sus múltiples posibilidades de aplicación, los agentes de este invento que contienen los com-

10. puestos de la fórmula general (I) pueden hallarse en las más diversas formas de empleo; por ejemplo, en forma de jabones en trozos, semisólidos y líquidos, en forma de pastas, de polvos, de emulsiones, de suspensiones, de soluciones en disolventes orgánicos, de sprays, de polvos de tocador, de granu-
15. lados, de pastillas, de lápices, en cápsulas de gelatina y otro material, en forma de pomadas, de cremas para la piel y para afeitar, de culetorios, de pastas dentífricas y otros medios de cuidado dental líquidos, semisólidos o sólidos, en champués o lociones para el cabello y otros agentes de cuida-
20. do capilar y en forma de preparados aerosólicos.

La acción de los carbamatos de este invento contra los parásitos, y en particular contra los microorganismos nocivos, puede incorporarse también a cuerpos moldeados hechos de material sintético. Cuando se emplean plastifi-



- cantes es ventajoso que el aditivo biocida se agrega al material sintético disuelto o disperso en el plastificante. Conviene procurar la dispersión más uniforme posible en el material sintético. Los materiales sintéticos con propiedades germicidas pueden hallar empleo para objetos de uso de toda clase en los que se desee una acción profiláctica contra los más diversos gérmenes, como por ejemplo las bacterias de la putrefacción o los hongos cutáneos; así, por ejemplo, pueden incorporarse a esterillas, mangos, asas, armaduras de puertas, asientos, rejillas de las piscinas, colgaduras de las paredes, etc. Por incorporación a las masas de correspondientes ceras y encáusticos, se obtienen agentes dotados de acción desinfectante para el cuidado de los suelos y de los muebles.
- 5.
 - 10.

326803

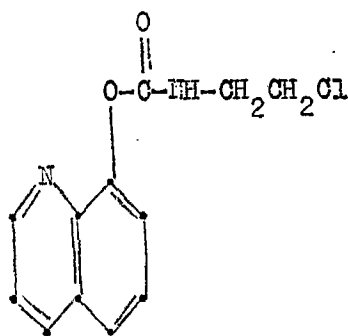
16



- 14 -

Sumamente eficaces para combatir a los protozoos, en particular la Entamoeba histolytica, son los agentes que contienen como materia activa el compuesto siguiente:

5.

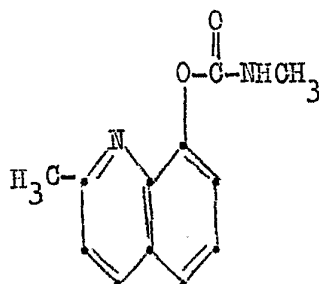


10.

15.

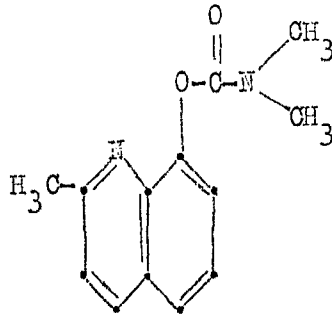
Particularmente aptos para combatir a los insectos nocivos, sobre todo los ortópteros (en particular los escarabajos, los grillos domésticos y las langostas o saltamontes) y los ácaros, son los agentes que contienen como materia activa uno de los compuestos siguientes:

20.

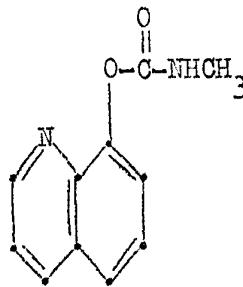




5.

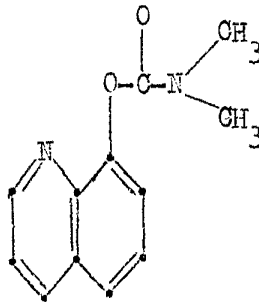


10.



15.

y



20.

Este invento concierne además a los nuevos compuestos de la fórmula general

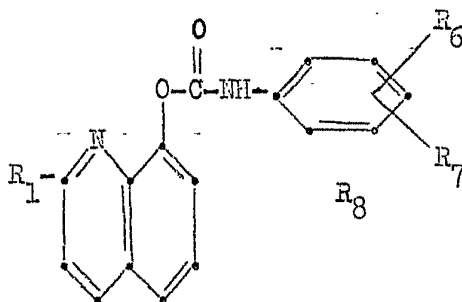
326803

16

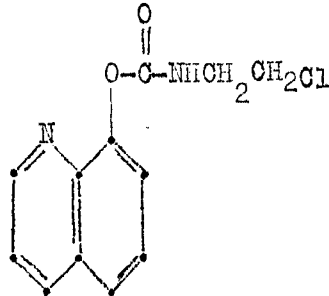


- 16 -

5.



- en la que
10. R_1 significa un átomo de hidrógeno o un radical metílico,
- R_6 significa un radical alquílico con 1 a 4 átomos de carbono, el grupo $-NO_2$, el grupo $-CF_3$ o un átomo de halógeno,
15. R_7 significa un átomo de hidrógeno, un radical alquílico con 1 a 4 átomos de carbono o un átomo de halógeno y
- R_8 significa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno,
20. y las sales de estos compuestos con un ácido, así como al compuesto de la fórmula



10. Conciérne asimismo este invento a los compuestos de la fórmula general (I) en que R_1 representa el radical metílico y a las sales de estos compuestos, de preferencia a los sulfatos y clorhidratos. Las sales, a causa de su solubilidad en el agua, pueden utilizarse directamente como soluciones acuosas. Una ventaja especial de las sales (sobre todo del sulfato y del yodato) es su superior estabilidad o respectivamente su acción perdurable.
- 15.

Los compuestos de la fórmula general (I) pueden emplearse también como desecantes o respectivamente desfoliadores, por ejemplo en el algodón.

20. El invento se describe con mayor detalle en los ejemplos que siguen. Las temperaturas están indicadas en grados centígrados, las partes significan partes en peso y los porcentajes significan porcentajes en peso.

326803



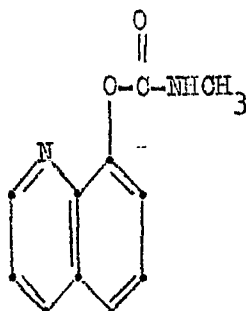
- 18 -

EJEMPLO 1.

- 1) Se disuelven en 100 cc de éter 29 g de 8-oxi-quinolina y, después de añadir 100 mg de trietilendiamina, se instilan 12,5 g de isocianato de metilo y se agita durante 16 horas. Luego se destila el éter y se recristaliza el residuo en acetona/bencina.

Punto de fusión: 162-163°

10.



15.

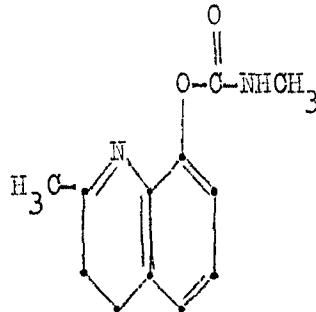
- 2) Se disuelven en 150 cc de benceno 31,8 g de 8-oxiquinaldina y, después de añadir 150 mg de trietilendiamina, se trata la solución con 12,5 g de isocianato de metilo.

Al cabo de 16 horas de agitación se filtra el producto reaccional precipitado, se le lava con bencina y se le seca.

Punto de fusión: 130-132°.



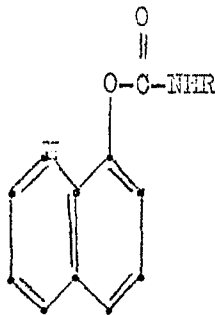
5.



10.

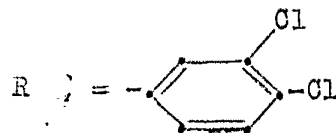
De manera análoga se prepararon también los compuestos siguientes:

15.



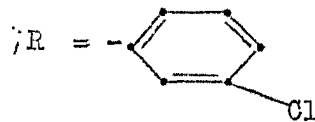
20.

3)



punto de fusión 187-189°

4)




punto de fusión 142-144°

326803



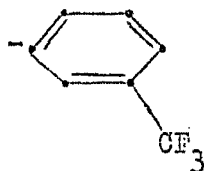
- 20 -

5) R =  punto de fusión 169-171°

5.

6) R =  punto de fusión 160-163°

10.

7) R =  punto de fusión 117-119°

15.

8) R = $-C_2H_5$ punto de fusión 150-151°

20.

9) R = CH_2CH_2Cl punto de fusión 106-108°

326803



- 21 -

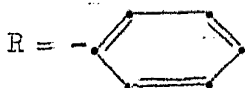
10)



punto de fusión 190-193°

5.

11)



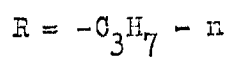
punto de fusión 153-154°

10.

Br

15.

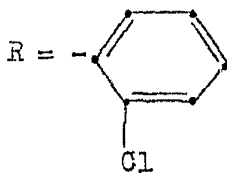
12)



punto de fusión 96-97°

20.

13)



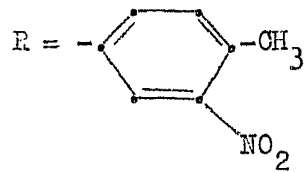
punto de fusión 116-119°

326803



- 22 -

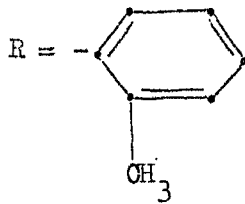
14)



punto de fusión 161-165°

5.

15)

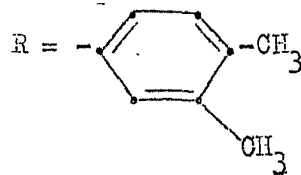


punto de fusión 130-131°

10.

15.

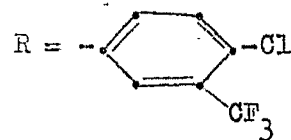
16)



punto de fusión 156-158°

20.

17)



punto de fusión 177-179°

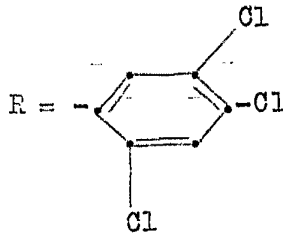
326803

16



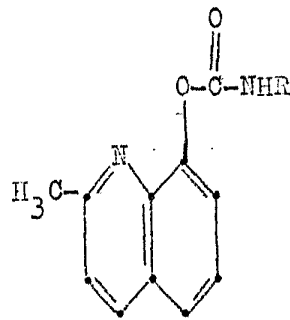
- 23 -

18)
5.



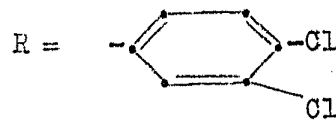
punto de fusión 164-167°

10.



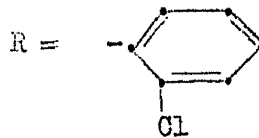
15.

19)
20.



punto de fusión 151-154°

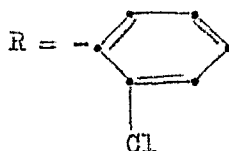
20)



punto de fusión 89-90°



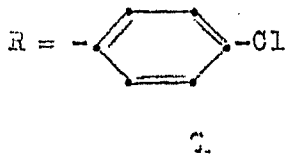
21)



punto de fusión 131-134°

5.

22)

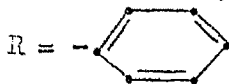


punto de fusión 148-151°

10.

15.

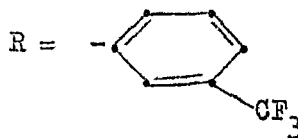
23)



punto de fusión 149-151°

20.

24)



punto de fusión 130-132°

326803



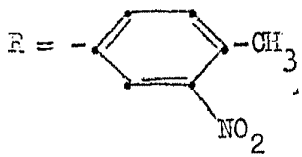
- 25 -

25) $R = -C_2H_5$ punto de fusión 124-126°

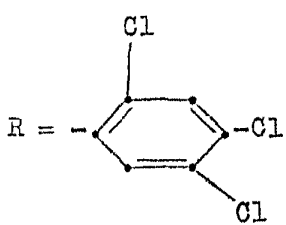
5.

26) $R = -CH_2CH_2Cl$ punto de fusión 113-115°

10.

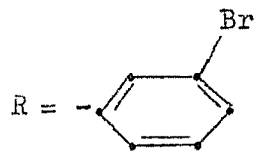
27) $R = -$  punto de fusión 125-128°

15.

20. 28) $R = -$  punto de fusión 125°



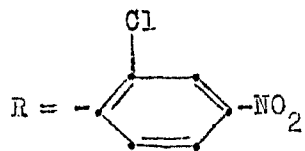
29)



punto de fusión 134-137°

5.

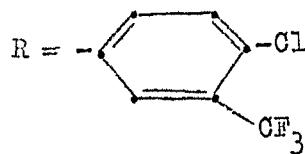
30)



punto de fusión 136-137°

10.

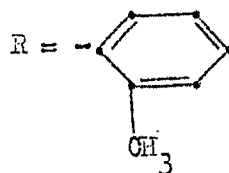
15. 31)



punto de fusión 124-126°

20.

32)

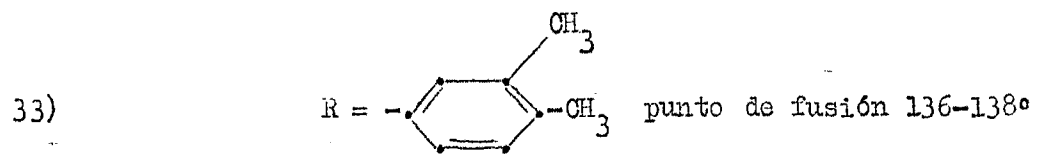


punto de fusión 103-104°

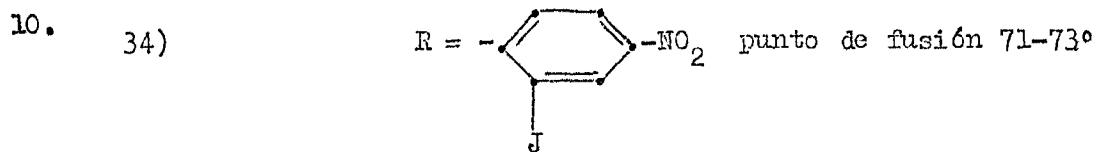
326803



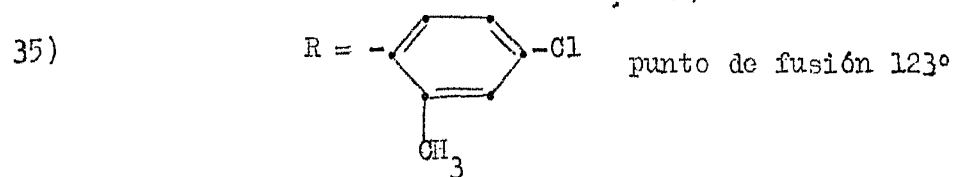
- 27 -



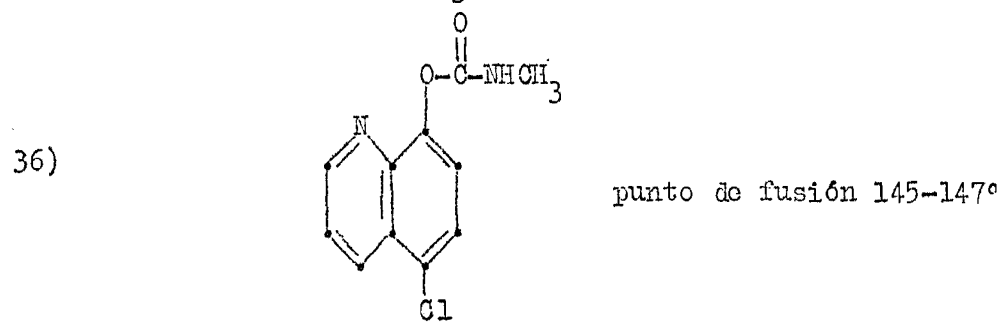
5.



15.

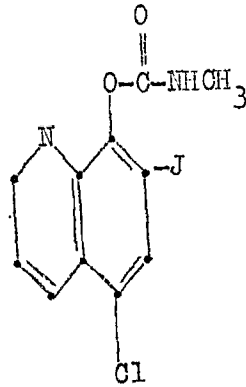


20.





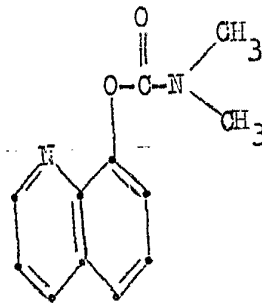
5. 37)



punto de fusión 172-174°

10.

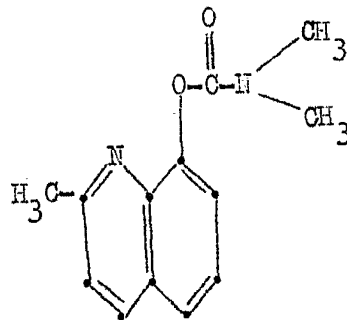
15. 38)



punto de fusión 74-78°

20.

39)



punto de fusión 76-77°

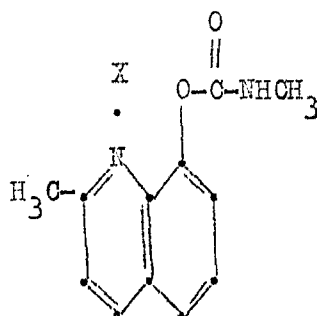
326803 10



- 29 -

Sales:

5.



10.

40)	X = HCl	punto de fusión: 143-144°
41)	H ₃ PO ₄	punto de fusión: 151-153°
42)	H ₂ SO ₄	punto de fusión: 142-144°
43)	HJO ₃	punto de fusión: 132°
44)	HNO ₃	punto de fusión: 150-152°
15. 45)	H ₃ AsO ₄	punto de fusión: 200-207°

20.

46)



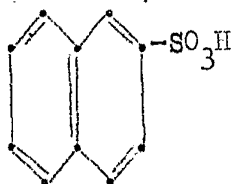
punto de fusión: 155-157°

326803



- 30 -

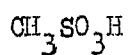
47)



punto de fusión: 110-117°

5.

10. 48)



punto de fusión: 147-148°

15. EJEMPLO 2.

a) Se preparó un polvo para aspersiones de la composición siguiente:

- 20.
- 50% de uno de los compuestos según el ejemplo 1
 - 40% de Bolus alba (caolín)
 - 5% de SiO_2 finamente dividido (producto que se halla en el comercio con la marca "Hisil")

326803



- 31 -

- 3,5% de un producto de condensación de 1 mol de p-oc-
til-fenol terciario con 9 moles de óxido de eti-
leno
- 1,5% de ácido l-bencil-2-estearil-bencimidazol-6,3'-
disulfónico sódico.
- 5.

La mezcla finamente molida que así se obtiene
se diluye con agua de la manera que se quiera, formando un
caldo de aspersion listo para el uso.

10.

- b) Se hicieron mezclas con 10 partes cada vez de
uno de los compuestos según el ejemplo 1, 30 partes de dime-
tilformamida y 15 partes de un emulgente ("Toximul Q, de la
firma Ninol Corp. de Chicago) constituido por una mezcla de
una substancia tensioactiva no iónica con una substancia
tensioactiva aniónica y se diluyeron las mezclas hasta 100
cc con xileno. Se obtuvo en cada caso una solución límpida,
que se empleó como concentrado para agente de aspersiones y
que se puede emulsionar vertiéndola en agua.

15.

- c) Se disuelve en un poco de acetona 1 parte de
uno de los compuestos según el ejemplo 1, se rocía la solu-
ción sobre 99 partes de caolín y se muele el conjunto para
formar un polvo homogéneo para espolvoreo.

20.

326803°



- 32 -

d) Las sales, a causa de su solubilidad en agua, pueden emplearse directamente o con adición de un compuesto tensioactivo.

5. EJEMPLO 3.

Se preparó un cebo para esparcir de la composición siguiente:

10. 1,45 % de uno de los compuestos nº 2 y 40 a 48 del ejemplo 1
0,025% de hollín
0,1% de amargante (octaacetato de sacarosa)
2% de vaselina
15. 96,425% de azúcar.

La mezcla molida que así se obtiene sirve admirablemente como cebo para esparcir contra las moscas y otros insectos.

20.

EJEMPLO 4.

a) Acción antibacteriana

Se disolvieron en 10 cc de propilenglicol 20

326803 16



- 33 -

mg de materia activa y 0,25 cc de la solución se añadieron a 4,75 cc de caldo glucosado estéril y se diluyó todavía la mezcla en saltos decimales.

Después de inocular son *Staphylococcus* y res-

5. pectivamente *Escherichia coli*, se incubó a 37°C durante 48 horas (bacteriostasis). Al cabo de 24 horas de crecimiento, se extendió sobre placas de agar-glucosa un asa de estos cultivos y se incubó a 37°C durante 24 horas (bactericida).

La Tabla I muestra las concentraciones límites en ppm.

10.

T A B L A 1

Materia activa

15. Carbamato de quinolil-N-3,4-diclorofenilo

Los compuestos que siguen mostraron acción igualmente buena:

	<i>Staph. aureus</i> Estasis/Cidia	<i>Esch. coli</i> Estasis/Cidia
20.	1/1	100/100
carbamato de quinolil-N-3-clorofenilo		
carbamato de quinolil-N-4-clorofenilo		
carbamato de quinolil-N-fenilo		
carbamato de quinolil-N-3-trifluorometilfenilo		

326803 10



- 34 -

- carbamato de quinolil-N-metilo
- carbamato de quinolil-N-etilo
- carbamato de quinolil-N-cloroetilo
- carbamato de quinolil-N-cloroetilo
- 5. carbamato de quinolil-N-4-nitrofenilo
- carbamato de quinolil-N-3-bromofenilo
- carbamato de quinolil-N-n-propilo
- carbamato de quinolil-N-2-clorofenilo
- carbamato de quinolil-N-3-nitro-4-metilfenilo
- 10. carbamato de quinolil-N-2,4,5-triclorofenilo
- carbamato de quinolil-N-4-cloro-3-trifluorometilfenilo
- carbamato de quinaldól-N-3,4-diclorofenilo
- carbamato de quinaldól-N-3-clorofenilo
- carbamato de quinaldól-N-4-clorofenilo
- 15. carbamato de quinaldól-N-3-trifluorometilfenilo

b) Acción antimicótica

- La determinación de la fungistasis se efectuó
- 20. en tubitos con solución esteril de mosto de cerveza (al 10%) en concentraciones decrecientes. Después de inocular con *Aspergillus niger* o respectivamente *Rhizopus nigricans*, se incubó a 25°C durante 72 horas y se averiguó la concentración límite (en ppm) de la fungistasis.

326803



- 35 -

La determinación de la actividad contra el *Trichophyton interdigitale* se efectuó con la prueba de difusión en agar; se indican en milímetros las zonas de inhibición.

5. Materia activa
- carbamato de quinolil-N-3,4-diclorofenilo
 - carbamato de quinolil-N-4-clorofenilo
 - carbamato de quinolil-N-fenilo
 - carbamato de quinolil-N-3-trifluorometilfenilo
10. carbamato de quinolil-N-2-clorofenilo
- carbamato de quinaldil-N-3,4-diclorofenilo
 - carbamato de quinaldil-N-2-clorofenilo
 - carbamato de quinaldil-N-4-clorofenilo.

15. Acción igualmente buena manifestaron también los demás compuestos que se describen en la Tabla I.

Los ejemplos señalados con los números 10 y 11 en el ejemplo 1 manifestaron buena acción microbicida contra los hongos fitopatógenos; por ejemplo, con una concentración de 0,2% de materia activa (ejemplo 1, nº 10), se comprobó una acción del 95% contra la *Alternaria solani*, en los tomates, y con una concentración de 0,2% de materia activa (ejemplo 1, nº 11), una acción del 100% contra el *Septoria apii*, en el apio, sin que se produjera perjuicio perceptible a las plantas tratadas.

326803



c) Acción contra los protozoos

- El compuesto descrito con el nº 9 en el ejemplo 1 mostró todavía a concentración de 10 ppm plena eficacia
5. contra la Entamoeba Histolytica.

d) Acción insecticida

- Contra los crisomélidos, la Gastroidea viridula y la Orgyia gonostigma (lepidópteros), los compuestos descritos en el ejemplo 1 con los núms. 1, 2, 28 y 29 manifestaron, en una concentración de 0,08% de materia activa, un efecto exterminador del 100% al cabo de 5 días.
- 10.

- Los compuestos descritos en el ejemplo 1 con los núms. 2 y 40 a 48 manifestaron contra el escarabajo alemán, americano y ruso (Phylodromia germanica, Periplaneta americana y Blatta orientalis) con empleo de un agente de espolvoreo al 1%, preparado según el ejemplo 2 c), un exterminio del 100% al cabo de 1 hora.
- 15.

- El mismo resultado se logró contra los escarabajos resistentes a la diazinona y el malatión.
- 20.

Contra la Locusta migratoria, los compuestos descritos en el ejemplo 1 con los números 2 y 40 a 48, en concentración de 0,005% de materia activa, mostraron al cabo de 24 horas un efecto exterminador del 100%.



326803

e) Acción nematozida

Se disolvieron en 50 g de acetona 2 g del compuesto núm. 1 o núm. 2 del ejemplo 1, y, con adición de un emulgente soluble en acetona, se diluyó con agua hasta la concentración deseada. La materia activa así formulada actúa de nematocida. En arenas de cuarzo lavada, se puso en contacto *Panagrellus redivivus* con concentraciones de 25 ppm, 50 ppm y 100 ppm de dicha materia activa y al cabo de 48 horas se comprobó la mortalidad siguiente:

	25 ppm	50 ppm	100 ppm
Nº 1.	50%	81%	-
Nº 2	50%	-	96%

= . =

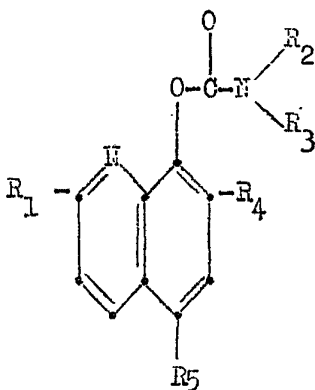


N O T A

5. Descrito el invento se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, con prioridad de las demandas de patentes suizas N° 6838/65 del 17 de mayo de 1965 y N° del 25 de abril de 1966, existiendo en ambas unidad de invención.

1. Procedimiento para preparar agentes antiparasitarios, caracterizado porque a una materia activa que corresponde a un compuesto de la fórmula general

10.



15.

20.

en la que

R_1 y R_2 significan un átomo de hidrógeno o un radical metílico,



326803

5. R_3 significa un radical alquílico inferior con 1 a 4 átomos de carbono, un radical cloroalquílico o un radical fenílico, insustituido, o, respectivamente, sustituido por $-NO_2$, halógeno (de preferencia, cloro), $-CF_3$ o por un radical alquílico inferior con 1 a 4 átomos de carbono, mientras que

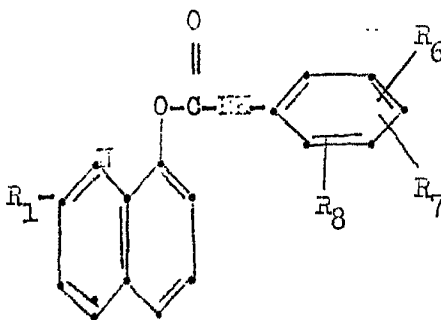
R_4 y R_5 significan un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno,

10. o sales de dichos compuestos con ácidos, se le incorporan eventualmente, uno por lo menos de los aditivos siguientes: disolventes, diluentes, dispersantes humectantes fijadores o también otros agentes antiparasitarios.

15.

2. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa un compuesto de la fórmula general

20.





326803

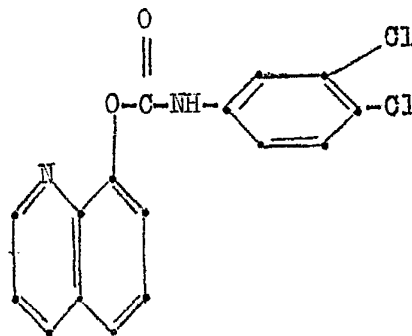
en la que

- R_1 significa un átomo de hidrógeno o un radical metílico,
 R_6 significa un radical alquílico con 1 a 4 átomos de carbono, el grupo $-NO_2$, el grupo $-CF_3$ o un átomo de halógeno (de preferencia, cloro),
5. R_7 significa un átomo de hidrógeno, un radical alquílico con 1 a 4 átomos de carbono o un átomo de halógeno (de preferencia, cloro) y
 R_8 significa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno (de preferencia, cloro),
10.

o una sal de un compuesto de tal índole con un ácido, para combatir a los microorganismos.

3. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para
15. combatir a los microorganismos el compuesto de la fórmula

20.



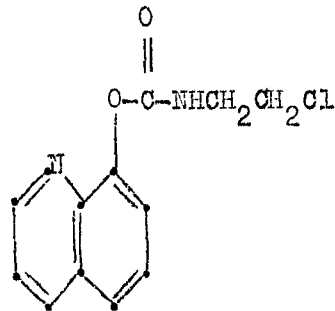
o una sal de este compuesto con un ácido.



326803

4. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para combatir a los protozoos, el compuesto de la fórmula

5.



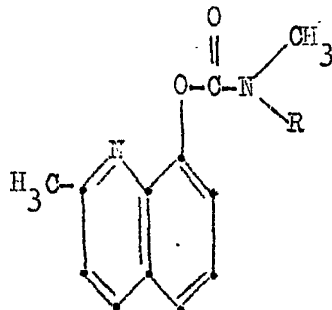
10.

o una sal de este compuesto con un ácido.

15.

5. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para combatir a los insectos nocivos un compuesto de la fórmula general

20.



en la que

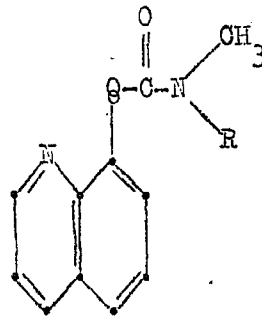


326803

R significa un átomo de hidrógeno o el grupo $-CH_3$,
o una sal de un compuesto de tal índole con un ácido.

5. 6. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes ... contienen como materia activa para combatir a los insectos nocivos, un compuesto de la fórmula general

10.



15.

en la que

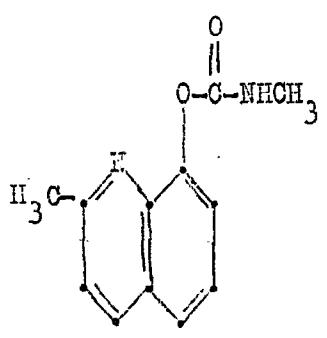
20. R significa un átomo de hidrógeno o el grupo $-CH_3$,
o una sal de un compuesto de tal índole con un ácido.

7. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para combatir a los insectos nocivos el compuesto de la fórmula



326803

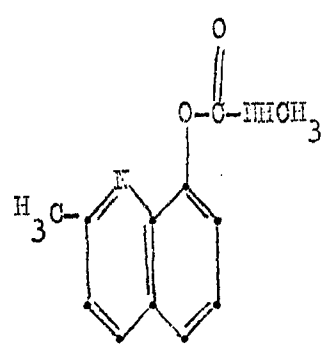
5.



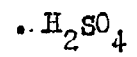
10.

8. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para combatir a los insectos nocivos el compuesto de la fórmula

15.



20.

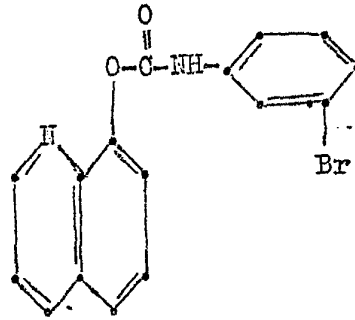


9. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para combatir a los microorganismos el compuesto de la fórmula



326803

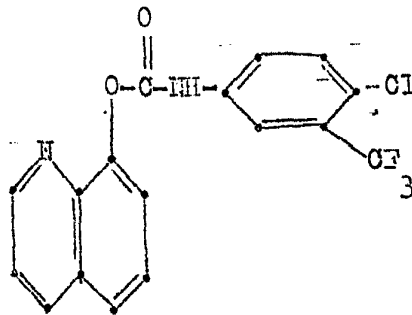
5.



10. o una sal de este compuesto con un ácido.

10. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque los agentes contienen como materia activa para combatir a los microorganismos el compuesto de la fórmula

15.



20.

o una sal de este compuesto con un ácido.



326803

11. Procedimiento para preparar agentes antiparasitarios.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 45 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 16 MAYO 1966

p. a.

JAIMESERVA

Firmado: LUIS RAY PADILLA