



MEMORIA DESCRIPTIVA
de una Patente de Invención a nombre de:
SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT, de naciona-
lidad alemana, domiciliada en l BERLIN
65, Müllerstrasse 170-172 (Alemania); por:
"PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DEL NUEVO
COMPUESTO N-METIL-4-CLORO-2-NITROFENIL-
CARBAMATO".

-----oooo000oooo-----

30754

El presente invento se refiere a un procedimiento de preparación del nuevo N-metil-4-cloro-2-nitrofenil-carbamato, el cual se distingue por su eficacia contra hongos parásitos de las simientes.

5

Para combatir los hongos parásitos de las simientes se emplean en la práctica preferentemente sustancias activas que contienen mercurio o desinfectantes universales, los cuales adolecen sin embargo del inconveniente de una gran toxicidad. Por el contrario, los fungicidas orgánicos, como p.ej. sulfuro de tetrametiltiuramida (TMTD) y N-triclorometiltio-4-ciclohexen-

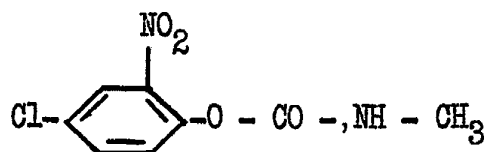
10



1,2-dicarboximida (Captan), tienen desde luego una toxicidad más reducida, pero su efecto no siempre es satisfactorio.

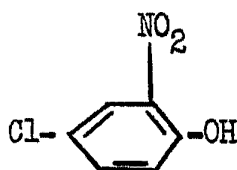
Se ha descubierto ahora un procedimiento de preparación del nuevo N-metil-4-cloro-2-nitrofenil-carbamato, eficaz contra hongos parásitos de la simiente, de la fórmula

5

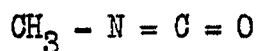


que está caracterizado porque se hace reaccionar 4-cloro-2-nitrofenol de la fórmula

10



con metilisocianato de la fórmula



en presencia de un catalizador, convenientemente de una base orgánica, de preferencia trimetilamina, disuelto convenientemente en un disolvente orgánico.

15

Los ejemplos siguientes aclaran la preparación de la sustancia activa.

17,4 g (0,1 mol) de 4-cloro-2-nitrofenol se disuelven en 60 ml de tetrahidrofurano, y la solución se mezcla con unos

20



0,1 ml de trietilamina y 6,3 ml de metilisocianato. Al cabo de 4 horas a temperatura ambiente se precipitó el N-metil-4-cloro-2-nitrofenil-carbamato por adición de bencina ligera.

Rendimiento: 20,5 g= 89 % del teórico.

5 Punto de fusión: 128 a 129° C.

La sustancia activa se disuelve bien en tetrahidrofurano, dimetilformamida, cloroformo, cloruro de etileno, cloruro de metileno, acetona, etc. con dificultad en benzol, etc., y es insoluble en agua y bencina ligera.

10 El compuesto sugerido por el invento es, por ejemplo, muy activo contra enfermedades de los cereales de las especies Fusarium, Tilletia, Helminthosporium, Ustilago, etc., y en este aspecto es superior al TMTD y Captan. Este efecto no era previsible. Aparte de lo anterior, el N-metil-4-cloro-2-nitrofenilcarbamato no adolece del riesgo de toxicidad característico de las
15 sustancias activas que contienen mercurio, lo cual es una ventaja singular, dado que en la actualidad se tienen grandes exigencias en cuanto a la toxicidad de los productos empleados en agricultura.

20 El compuesto sugerido por el invento puede ser aplicado por sí solo o mezclado con otros productos protectores de plantas, p. ej. insecticidas. La aplicación se efectúa convenientemente, de manera ya habitual en un producto para el tratamiento de simientes, en forma seca o líquida añadiendo de paso sustancias de soporte o diluyentes sólidos y/o líquidos, y en caso dado pro-



ductos adherentes, humectantes, emulgentes y/o dispersantes.

La parte de sustancia activa en el producto puede ascen-
der convenientemente al 10 a 75 % en peso, de preferencia al 20
a 50 % en peso del producto. La concentración exacta de la sus-
5 tancia activa empleada para el producto depende principalmente
de la cantidad, en la que debe utilizarse el producto para el trata-
miento de la simiente.

De los siguientes ejemplos de ensayo se desprende la
excelente eficacia del compuesto sugerido por el invento contra
10 hongos parásitos de la simiente, en comparación con otros pro-
ductos comerciales (TMTD y Captan). La sustancia activa se empleó
en forma de solución o emulsión al 20 %, o de desinfectante seco
al 50 %.

EJEMPLO 1

15 Efecto contra el hongo blanco del centeno (*Fusarium nivale*)

Metódica de ensayo:

Semilla de centeno atacada por vía natural por el hon-
go blanco (*Fusarium nivale*) fué sembrada, sin tratar de una parte
y, de otra, tratada conforme se indica en el Cuadro, en recipien-
tes de arcilla con tierra no estéril, y en la cámara frigorífica
20 a 7 hasta 12°C se sometió diariamente, durante 14 horas en el cur-
so de 2 meses, a una iluminación artificial. Durante el período
de ensayo se valoró el ataque del hongo blanco en las plantas de
centeno. El ataque pertinente se señala como valor relativo (con-



trol sin tratamiento = 100). Se hicieron dos ensayos.

Resultados de ensayo

5	Sustancia activa	g sustancia activa/ 100 kg simiente	Ataque relativo en las plantas de cente- no.	
			Ensayo 1	Ensayo 2
	N-metil-4-cloro-2-nitro- fenilcarbamato	244 130 65	0 14	0 35
	TMTD	262	20	
10	Captan	250 125		36 52
	Control sin tratamiento	-	100	100

EJEMPLO 2

Efecto contra el tizón del trigo (Tilletia caries)

15 Metódica de ensayo:

Después de la infección artificial por agitación con 3 g de esporas del tizón del trigo (Tilletia caries) por 1 kg de simiente se sembró en terreno natural trigo sin tratar y trigo tratado conforme al Cuadro. En la época de cosecha se procedió al

20 recuento de las raspas atacadas por el tizón.



Resultados de ensayo:

	Sustancia activa	g sustancia activa/ 100 Kg simiente	Número de raspas atacadas por el tizón en %
5	N-metil-4-cloro-2-nitro- fenilcarbamato	100	0,10
	Captan	200	0,69
	Control sin tratamiento	-	59,75

EJEMPLO 3

10 Efecto contra la helmintosporiosis de la cebada (*Helminthosporium*
gramineum)

Metódica de ensayo:

15 En terreno natural se sembró semilla de cebada atacada de helmintosporiosis (*Helminthosporium gramineum*) por vía natural, sin haberla sometido a tratamiento alguno, y otra tratada conforme a los datos consignados en el cuadro. Una vez brotada la semilla se contaron los tallos enfermos de helmintosporiosis.

Resultados de ensayo

	Sustancia activa	g sustancia activa/ 100 kg simiente	Número de tallos en- fermos en %
20	N-metil-4-cloro-2-nitro- fenilcarbamato	250	0,2
	TMTD	300	1,2
	Control sin tratamiento	-	4,2



EJEMPLO 4

Efecto contra el ustilago de la avena (Ustilago avenae)

Metódica de ensayo.

5 Semilla de avena atacada por vía natural de ustilago
 (Ustilago avenae) fue infectada artificialmente además por el
 método húmedo al vacío (PURDY, 1958, Plant Dis. Repr. pág. 233
 a 237). Avena no tratada y otra avena tratada conforme a los da-
 tos consignados en el Cuadro se sembraron en terreno natural.
 En la época de cosecha se contaron las panículas atacadas de us-
 10 tilago. Se hicieron tres ensayos.

Resultados de ensayo

15	Sustancia activa	g sustancia activa 100 Kg simiente	Número de panículas atacadas de ustilago		
			E n s a y o		
			1	2	3
	N-metil-4-cloro-2-nitro-	375			1,9
	fenilcarbamato	225			3,8
		150	10,6	4,6	
20	TMTD	450			13,8
	Captan	600	29,5	9,1	
	Control sin tratamiento	-	36,9	15,8	32,2

Los ensayos anteriores revelan tanto la buena eficacia
 del compuesto sugerido por el invento contra las enfermedades de
 25 los cereales, como su superioridad frente a los productos conoci-
 dos tomados como comparación.

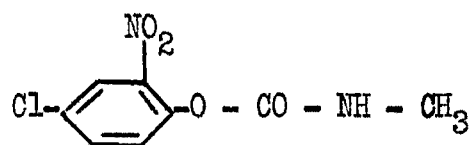
30 AGO 1966

-----N O T A-----

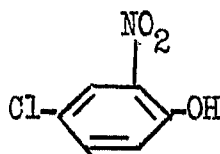
Se reivindica como nuevo y de propia invención:

1.- Procedimiento de preparación del nuevo compuesto
N-Metil-4-cloro-2-nitrofenil-carbamato de la fórmula

5

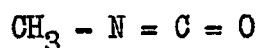


caracterizado porque se hace reaccionar 4-cloro-2-nitrofenol de
la fórmula



10

con metilisocianato de la fórmula



en presencia de un catalizador, de preferencia con una base orgánica, ventajosamente trietilamina, disuelto convenientemente en un disolvente orgánico.

15

2.- PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DEL NUEVO COMPUESTO
N-METIL-4-CLORO-2-NITROFENIL-CARBAMATO.

Tal como se describe y reivindica en la presente Memoria Descriptiva, que consta de ocho hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 30 AGO. 1966

CARLOS FERNANDEZ CANDELA
P. P.