

333149

PATENTE DE INVENCION

Le A 9689-Sp.



## Memoria Descriptiva

sobre:

"Procedimiento para preparar una composición repeledora  
de animales dañinos"

-----

*Solicitante:* FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT  
entidad alemana, residente en Leverkusen-Bayerwerk,  
Alemania.

-----

La presente invención se refiere  
al empleo de guanidinas, parcialmente conocidas,  
como medio para repeler los pájaros, los roedores  
y animales de la familia de las liebres.

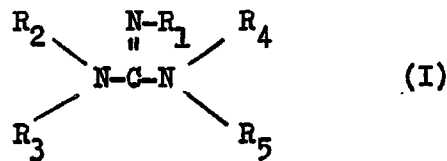
5. Ya es conocido que el disulfuro de



tetrametil-tiurámico se puede emplear para repeler los roedores. Este efecto ha alcanzado en la práctica una importancia considerable.

5. También es conocido que la antraquinona se puede emplear para repeler los pájaros. Este material activo ha logrado en la práctica una importancia considerable, pero sin embargo no muestra ningún efecto repeledor sobre los roedores.

10. Se ha descubierto que las guanidinas, parcialmente conocidas de fórmula



15. en la cual  $R_1 - R_5$  significan hidrógeno, monohalógenofenilo, sustituido en caso dado por halógeno y/o halógenoalquilo con 1 - 4 átomos de carbono, cicloalquilo y/o un resto hidrocarburo alifático sustituido en caso dado por arilo, alcoxi, ariloxi, alquilomercapto, éster carboxílico, carboxilamida, hidroximercapto, ciano y/o carboxilo, significando sin embargo solo uno de los R del grupo  $R_1 - R_5$  el resto fenilo arriba definido con exactitud,  $R_2$  y  $R_3$  así como  $R_4$  y  $R_5$  significan conjuntamente con el correspondiente átomo de nitrógeno un resto heterocíclico con 5 a 6 miembros de anillo,  $R_2$  significa además el resto de fórmula
- 20.





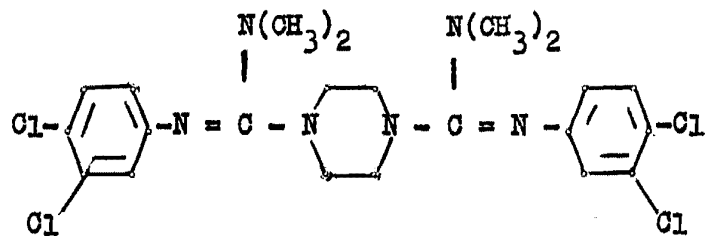
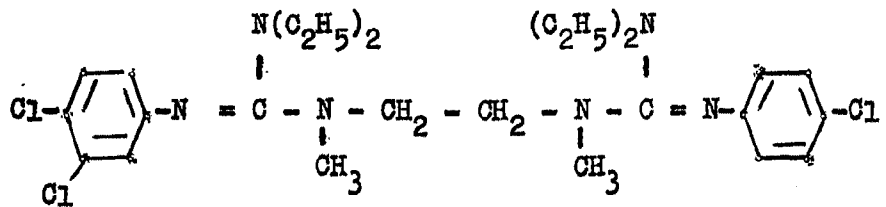
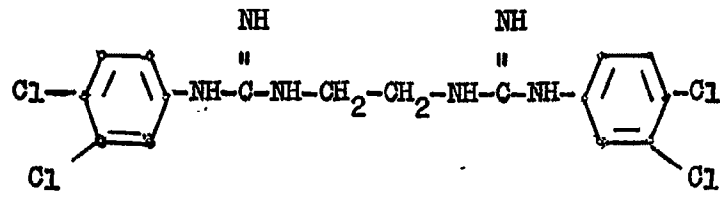
- tituidos por halógenoalquilo con 1-2 átomos de carbono y 1 - 5 átomos de cloro, bromo y/o fluor, así como por cicloalquilo con 5 - 6 átomos de carbono. Además están estos símbolos en la fórmula representados por alquilo recto y ramificado, alqueniilo y alquinilo con hasta 12 átomos de carbono. Estos restos están preferentemente sustituidos por fenilo, alcoxi con 1 - 4 átomos de carbono, fenoxi, alquilo-mercapto con 1 - 4 átomos de carbono, fenilmercapto, radicales éster alcanocarboxílico con 1 - 4 átomos de carbono, radicales alcanocarboxilamida con 1-4 átomos de carbono, así como hidróxido, mercapto, ciano y carboxilo,  $R_2$  y  $R_3$  o bien  $R_4$  y  $R_5$  significan juntos con el correspondiente átomo de nitrógeno preferentemente, restos heterocíclicos, tales como piperidilo, pirrolidilo, morfolilo y tiomorfolilo.  $X_1$  significa preferentemente alquilenno con 1 - 4 átomos de carbono,  $X_2$  y  $X_3$  significan preferentemente alquilenno con 1-3 átomos de carbono.
5. tituidos por halógenoalquilo con 1-2 átomos de carbono y 1 - 5 átomos de cloro, bromo y/o fluor, así como por cicloalquilo con 5 - 6 átomos de carbono. Además están estos símbolos en la fórmula representados por alquilo recto y ramificado, alqueniilo y alquinilo con hasta 12 átomos de carbono. Estos restos están preferentemente sustituidos por fenilo, alcoxi con 1 - 4 átomos de carbono, fenoxi, alquilo-mercapto con 1 - 4 átomos de carbono, fenilmercapto, radicales éster alcanocarboxílico con 1 - 4 átomos de carbono, radicales alcanocarboxilamida con 1-4 átomos de carbono, así como hidróxido, mercapto, ciano y carboxilo,  $R_2$  y  $R_3$  o bien  $R_4$  y  $R_5$  significan juntos con el correspondiente átomo de nitrógeno preferentemente, restos heterocíclicos, tales como piperidilo, pirrolidilo, morfolilo y tiomorfolilo.  $X_1$  significa preferentemente alquilenno con 1 - 4 átomos de carbono,  $X_2$  y  $X_3$  significan preferentemente alquilenno con 1-3 átomos de carbono.
10. Como ejemplos de los materiales activos de la presente invención sean mencionados en detalle:
15. La N-(4-cloro-fenil)-N',N'-dietil-guanidina  
La N-(2,3-dicloro-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina  
25. La N-(2,4-dicloro-fenil)-N',N'-dietil-guanidina  
La N-(2,5-dicloro-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina  
La N-(3,4-dicloro-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina  
La N-(3,5-dicloro-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina  
La N-(2,3,4-tricloro-fenil)-N',N'-dimetilguanidina  
30. La N-(2,4,5-tricloro-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina



- La N-(3,4-dibromo-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina
- La N-(pentaclorofenil)-N',N'-dimetil-guanidina
- La N-(2-cloro-4-metil-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina
- La N-(2-cloro-6-metil-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina
- 5. La N-(2,4-dicloro-5-metil-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina
- La N-(2-cloro-5-trifluormetil-fenil)-N',N'-dimetil-guanidina
- La N-(3,4-dicloro-fenil)-N'-metil-guanidina
- 10. La N-(3,4-dicloro-fenil)-N'-etil-guanidina
- "                  -N'-propil-guanidina
- "                  -N'-isopropil-guanidina
- "                  -N'-butil-guanidina
- "                  -N'-isobutil-guanidina
- 15.          "                  -N'-sec. butil-guanidina
- "                  -N'-terc. butil-guanidina
- "                  -N'-dodecil-guanidina
- "                  -N'-alil-guanidina
- "                  -N'-bencil-guanidina
- 20.          "                  -N'-(2-hidroxi-etil)-guanidina
- "                  -N'-(3-metoxi-propil)-guanidina
- "                  -N'-(2-fenoxi-etil)-guanidina
- "                  -N'-(2-mercapto-etil)-guanidina
- "                  -N'-(2-etilmercapto-etil)-guanidina
- 25.          "                  -N'-(2-fenilmercapto-etil)-guanidina
- "                  -N'-(2-cian-etil)-guanidina
- "                  -N'-(carboxime til)-guanidina
- 30.          "                  -N'-(carboe toxime til)-guanidina



- La N-(3,4-dicloro-fenil)-N'-(metilcarbamido)-guanidina
5. " -N'-ciclohexil-guanidina  
" -N',N'-dietil-guanidina  
" -N',N'-dipropil-guanidina  
" -N',N'-diisobutil-guanidina  
" -N',N'-dialil-guanidina  
" -N'-metil-N'-(2-hidroxi-etil)-  
guanidina  
" -N'-metil-N'-(2-cian-etil)-gua-  
10. nidina  
" -N',N'-pentametilén-guanidina  
" -N',N'-3-oxa-pentametilén-gua-  
nidina  
" -N',N'-3-sulfapentametilén-gua-  
15. nidina  
" -N',N''-dietil-guanidina  
" -N',N''-dipropil-guanidina  
" -N',N',N''-trietil-guanidina  
" -N',N',N'',N''-tetrametil-guani-  
20. dina  
" -N',N',N'',N''-tetraetil-guanidina  
" -N',N',N'',N''-tetrapropil-guani-  
dina  
" -N',N',N'',N''-bis-pentametilén-  
25. guanidina  
" -N',N',N'',N''-bis-3-oxa-penta-  
metilén-guanidina



Las guanidinas solo se conocen en

parte de la literatura, Las nuevas guanidinas se pueden obtener en forma sencilla según los mismos métodos como las guanidinas conocidas. Las guanidinas se obtienen por ej. por adosamiento de aminas a

5. N-cian-anilinas, mediante reacción de S-alkil-isotiocúreas con aminas o mediante reacción de dicloruros isocianílicos o bien cloro-formamidininas con aminas (véase por ej. Houben-Weyl, Métodos de la química orgánica, Tomo VIII, Compuestos de oxígeno, parte 3, pág. 180-188, además las patentes alemanas 1.170.931 y 1.125.908).
- 10.

Las guanidinas no solo se pueden emplear como bases libres sino también en forma de

15. sus sales. Aquí no tiene importancia alguna el anión



- del ácido. Como ácidos formadores de sales entran por lo tanto todos los ácidos en consideración. Se pueden emplear ácidos inorgánicos, tales como el ácido clorhídrico, sulfúrico, fosfórico, nítrico, perclórico y ferrocianhídrico. En igual forma entran también en consideración los ácidos orgánicos, por ej. el ácido acético, benzoico, tartárico, cítrico, pícrico, galicílico, metilsulfúrico, metanosulfónico y bencenosulfónico.
- 5.
10. Los materiales activos según la presente invención poseen, con reducida toxicidad para los animales de sangre caliente, un efecto repeledor contra los pájaros dañinos, tales como los ánades, gallináceas, carádridas, cucúlidas así como los fringílidos.
15. Entre los ánades se encuentran principalmente los Anseridae, tales como Anatinae. Entre las gallináceas se cuentan especialmente las mismas gallinas (Gallidae) así como el Phasianus colchicus.
20. Entre las carádridas son de importancia las palomas (Columbae), tales como Columba palumbus y Columba livia con sus formas de aves caseras. Entre los cucúlidos son de importancia los Cuculi, por ej. Musophagidae, así como también los papagayos (Psittaci), por ej. Psittacinae. Entre los fringílidos se encuentran principalmente los Corvidae, tales como el Corvus corone y Corvus grugilegus, los Sturnidae, Icteridae, Fringillidae y Passer spec. así como los Ploceidae tal como Quelea quelea.
- 25.
30. Los compuestos de la presente inven-



ción muestran también un efecto repeledor contra los animales de la clase de las liebres (Lagomorpha) y los roedores (Rodentia) tales como Sciuroidae, Geomyidae y Muridae, entre los que se encuentran principalmente los Muscardinidae y Muridae.

5. Entre los animales de la clase de las liebres se encuentran principalmente los Leporidae, tales como el *Oryctolagus cuniculus*, el *Citellus citellus* y el *Citellus lateralis*, así como también por ej. el *Thomomys talpides*. También el *Glis glis*.

10. Los ratones comprenden principalmente el grupo de los Murinae y *Rattus spec.* tales como *Rattus rattus*, *Rattus norvegicus*, *Mus spec.* tal como *Mus musculus*, los Cricetinae, tal como *Cricetus cricetus* y los Microtinae, tales como *Microtus arvalis*, *Microtus agrestis* y *Arvicola terrestris*.

15. Los materiales activos según la presente invención se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. Estas se preparan en forma conocida, por ej. mezclando los materiales activos con agentes de carga o excipientes, también en disolventes líquidos y/o materiales de carga sólidos, en caso dado empleando agentes tensioactivos, es decir agentes de emulsión y/o de dispersión. En el caso de emplearse agua como agente excipiente se pueden emplear simultáneamente por ej. también disolventes orgánicos como auxiliares para la solución. Como disolventes líquidos entran esencialmente en consideración: los aromatos, tales

20.

25.

30.



- como el xileno y el benceno, los aromatos clorados, tales como los clorobencenos, las parafinas, tales como las fracciones del petróleo crudo, los alcoholes, tales como el metanol y el butanol, los disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido dimetílico, así como el agua;
5. como materiales de carga sólido se emplean los minerales sintéticos molturados, tales como la caolina, las arcillas, el talco y la creta y los minerales sintéticos molturados, tales como el ácido silícico altamente dispersado y los silicatos; como agentes de emulsión sean mencionados los emulsionadores no ionógenos y aniónicos, tales como el éster del polioxietileno-ácido graso, el éster de polioxietileno-alcohol graso, por ej. el éster alquilaril-poliglicólico, los arilsulfonatos y los alquilsulfonatos; como
10. agentes de dispersión sean mencionados por ej. la lignina, las desliviaciones sulfíticas y la metilcelulosa.
- 15.
20. Los materiales activos según la presente invención se pueden emplear en combinación con otros insecticidas, fungicidas, herbicidas y nematocidas conocidos.
25. Las formulaciones contienen por lo general entre 0,001 y 95% en peso de material activo, preferentemente entre 0,005 y 90.
30. La aplicación de los materiales activos de la presente invención, de sus formulaciones y de las formas de aplicación preparadas de ellos se efectúa en la forma usual, por ej. mediante tratamien-



- to del material de simiente, mediante aspersión, espolvoreado o esparsión de los preparados de material activo adecuados sobre las plantas o partes de las plantas expuestas a ser devoradas por los pájaros y/o los roedores, mediante tratamiento del terreno, mediante fumigación en los recintos o construcciones subterráneas, mediante aplicación encima o debajo de la tierra de revestimientos y barreras, así como mediante impregnación de los materiales
5. expuestos a los pájaros y los roedores, tales como la madera, papel, caucho y materiales sintéticos. Para el tratamiento de las semillas se emplean generalmente de 0,01 - 5% en peso de material activo por 100 g de sementera, preferentemente de 0,025 a 1.
- 10.
- 15.

Los caldos de rociado para lograr revestimiento repeledores de los pájaros y roedores por ej. sobre las plantas o partes de las plantas expuestas contienen por lo general entre 0,1 y 20% en peso de material activo preferentemente entre 0,5 y 10. Los materiales que están impregnados con los materiales activos deberán mostrar en su superficie una concentración de material activo de aprox. 0,1-5,0 % en peso.

25. Ejemplo 1 -

A. Ensayo repeledor (Paloma casera)

Animal de ensayo: Columba livia

Para la obtención de un preparado adecuado de material activo se mezclan 3 partes en peso de material activo con 2,8 partes en peso de

30.



- ácido silícico altamente dispersado y 4,3 partes en peso de talco: 6 partes en peso de este concentrado de material activo se mezclan íntimamente con 1000 partes en peso de trigo para simiente y después de
5. agregar 11 partes en peso de polietilenoglicol como adhesivo, se agita la mezcla intensamente hasta lograr una impregnación igualada de las simientes. El contenido en material activo asciende por lo tanto a 0,18%.
10. 120 g del trigo así impregnado se llenan en un recipiente de material sintético, transparente, provisto de abertura redonda en la pared delantera.
- Este recipiente se pone ante dos pa-
15. lomas mantenidas juntas, acostumbradas a la libertad. Los animales no disponen de alimento sin tratar, pero disponen de toda el agua que deseen. El ensayo se realiza con luz continua durante 60 horas.
- La cantidad restante pesada del mate-
20. rial de simiente tratado en % de la cantidad empleada indica la medida del efecto repeledor. 100% significa por lo tanto que no se comió nada de trigo, el efecto repeledor fué por lo tanto total.
- Los materiales activos, el efecto re-
25. peledor y el número de ensayos individuales se desprenden de las columnas I, II y III de la tabla 1 a continuación.

B. Ensayo repeledor (Ratón casero)

- Animal de ensayo *Mus musculus*
30. Concentración del material activo en



el alimento de ensayo: 5%.

- Para la obtención de un preparado adecuado de material activo se mezclan 3 partes en peso de material activo con 2,8 partes en peso de ácido silícico altamente disperso y 4,2 partes en peso de talco. Para la preparación del cebo de ensayo se mezclan intensamente 1,67 partes de este concentrado de material activo con 95 partes en peso de un alimento standard, harinoso, usual para el mantenimiento de los animales de ensayo, bajo adición de 3,33 partes en peso de celulosa metilica y algo de agua. De 6 g de substancia seca se moldean dos píldoras esféricas de cebo que antes de comenzar el ensayo se secan durante 24 horas a temperatura ambiente.
- 5.
  - 10.
  - 15.

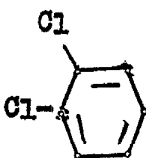
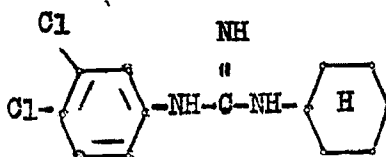
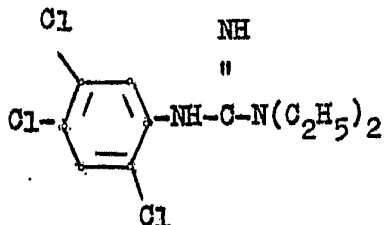
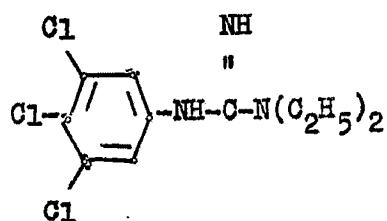
- Las píldoras se ponen delante de 2 ratones de laboratorio mantenidos juntos sin otro alimento secundario durante un período de 24 horas. Disponen de toda el agua que deseen. Los restos de las píldoras se vuelven a secar una vez terminado el ensayo y se pesan.
- 20.

- Como medida del efecto repeledor vale la cantidad residual pesada, expresada en porcentajes de la cantidad empleada originalmente. 100% de efecto repeledor significa que no se comieron nada de las píldoras.
- 25.

Los materiales activos, el número de ensayos y los resultados se desprenden de las columnas I, IV y V de la tabla 1 a continuación.

T a b l a 1



Material activo	Ensayo repeledor/ Paloma casera		Ensayo repeledor/ Ratón casero	
	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)
I	II	III	IV	V
Disulfuro de tetrametiltiurano (Conocida)	2	57,1	3	67,0
Antraquinica (Conocida)	2	30	4	0
 <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> $\text{CH}_3\text{SO}_3\text{H}$ F 176-177 <sup>2</sup>	5	93,8	3	92,8
 <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> <chem>C1CCCCC1</chem> F 146-147 <sup>2</sup>	4	92,0	3	88,9
 <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> F 82-84 <sup>2</sup>	4	83,3	3	95,0
 <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> <chem>Clc1cc(NC(=O)N(C2H5)2)ccc1Cl</chem> F 132-135 <sup>2</sup>	3	92,7	3	96,6



T a b l a 1

Material activo	Ensayo repeledor/ Paloma casera		Ensayo repeledor/ Ratón casero		
	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	
I	II	III	IV	V	
	F 93-95,5 <sup>a</sup>	4	92,9	3	92,2
	Ö1	4	95,2	3	96,6
	Ö1	1	80,8	2	81,7
	Ö1	4	94,1	3	99,4
	F 66-68 <sup>a</sup>	1	71,6	2	75
	Ö1	2	94,5	3	95,6



T a b l a 1

Material activo	Ensayo repeledor/ Paloma casera		Ensayo repeledor/ Ratón casero		
	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	
I	II	III	IV	V	
	Ö1	2	93,2	3	87,8
	Ö1	4	93,9	3	81,7
	Ö1	1	80,0	3	92,8
	Ö1	3	86,1	3	92,2
	Ö1	2	88,3	3	88,8
	Ö1	4	91,8	2	69,1



T a b l a 1

Material activo	Ensayo repeledor/ Paloma casera		Ensayo repeledor/ Ratón casero		
	Número de ensayos indivi- duales	Efecto repeledor en % (promedio)	Número de ensayos indivi- duales	Efecto repeledor en % (promedio)	
I	II	III	IV	V	
	F 126-129 <sup>a</sup>	3	92,1	3	88,9
	F 217-219 <sup>a</sup>	1	80,0	3	88,9
	Ö1	2	89,1	4	84,6
	Ö1	2	94,9	2	91,7
	Ö1	2	95,8	4	78,4



Tabla 1

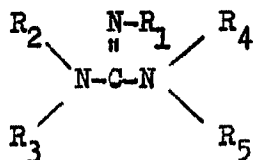
Material activo	Ensayo repeledor/ Paloma casera		Ensayo repeledor/ Ratón casero		
	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	Número de ensayos individuales	Efecto repeledor en % (promedio)	
I	II	III	IV	V	
	F:80-85°	4	87,3	3	75,0
	F:109-110°	4	89,8	4	87,9
	Ö1	1	85,8	1	67,0
	Ö1	3	80,5	3	82,8
	Ö1	2	92,0	2	77,5
	Ö1	2	84,6	3	85,0



N O T A

5.4 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. También se hace constar que el invento corresponde a una Solicitud de Patente presentada en Alemania nº F 47.626 IVa/45 l de 9 de noviembre de 1.965 acogiéndose, por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España: "PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR UNA COMPOSICION REPELEDORA DE ANIMALES DAÑINOS"; caracterizándose por lo siguiente:

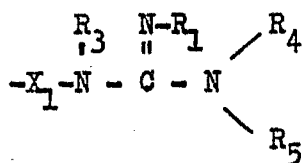
1ª - Procedimiento para preparar una composición repeledora de animales dañinos, de fórmula



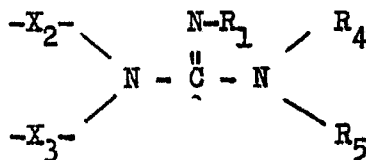
20. en la cual R<sub>1</sub>-R<sub>5</sub> significa hidrógeno, monohalogenofenilo, sustituido en caso dado por halógeno y/o haloalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo y/o un resto de hidrocarburo alifático, sustituido en caso dado, por arilo, alcoxi, ariloxi, alquilo-mercapto, ester carboxílico, carboxilamida, hidroxil, mercapto, ciano y/o carboxilo, significando sin embargo, solo uno de los R del grupo R<sub>1</sub>-R<sub>5</sub>, el resto



5. fenilo arriba definido con exactitud;  $R_2$  y  $R_3$ , así como  $R_4$  y  $R_5$ , significan, conjuntamente con el correspondiente átomo de nitrógeno, un resto heterocíclico con 5 a 6 miembros de anillo,  $R_2$ , significa además, el resto de fórmula:



en la cual  $X_1$  significa alquileo, interrumpido en caso dado, por oxígeno, azufre o nitrógeno y  $R_2$  y  $R_3$ , significan conjuntamente el resto de fórmula:



10. en la cual  $X_2$  y  $X_3$  significan alquileo, tanto en forma de bases libres como en forma de sales, se mezcla con agua y/o disolventes que contienen un material tensioactivo, o con materiales de carga sólidos e inertes que, en caso dado, contienen un material tensioactivo, empleándose 0,1-95 partes en peso de material activo por 99,9-5 partes en peso de material auxiliar.
- 15.

20. 2ª - Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado porque como disolventes se emplean aromatos, aromatos clorados, parafinas, alcoholes, aminas o derivados amínicos, como medios de



carga sólidos, molturaciones de minerales sintéticos o naturales y como materiales tensioactivos emulsionadores no ianógenos o aniónicos o lignina, desliviaciones sulfíticas o metilcelulosa.

5. 3ª - Procedimiento para preparar una composición repeledora de animales dañinos, tal y como queda substancialmente descrito en la presente Memoria.

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

Madrid, 8 NOV. 1966

FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT,

L. GOMEZ AC BO Y MODEI  
p. p. Firmado: F. Hernández Ruiz