



PATENTE DE INVENCION

I.C.I. Case Nº PP. 19199.

338693

Memoria Descriptiva

sobre:

"Procedimiento para la preparación de una composición fungicida"

Solicitante: IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED,
entidad inglesa, residente en
Imperial Chemical House, Millbank,
Londres, S.W.1., Inglaterra.

- - - -

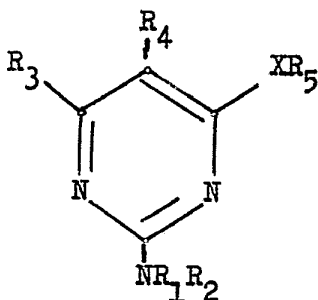
La invención se refiere a nuevos derivados de pirimidina, a procedimientos para su obtención, a formulaciones biológicamente activas que los contienen y a métodos para combatir plagas.

5. De acuerdo con esta invención se suministran,

338693 -2-



5. como compuestos nuevos, las 2-aminopirimidinas que llevan en la posición 6 un radical hidroxilo o mercapto, carboxílica ó sulfonílicamente esterificados, o las sales de las mismas. Más particularmente suministra la invención un derivado de pirimidina que tiene la fórmula

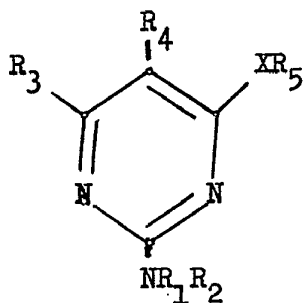


10. o una sal del mismo, en la que R_1 y R_2 significan átomos de hidrógeno, radicales de hidrocarburo sustituidos o sin sustituir, o junto con el átomo de nitrógeno adyacente forman un anillo heterocíclico que puede contener uno o más heteroátomos adicionales; R_3 y R_4 significan átomos de hidrógeno o halógeno, radicales de hidrocarburo sustituidos o sin sustituir, o radicales nitro; X significa un átomo de oxígeno o de azufre y R_5 es un radical carbonilo o sulfonilo que
15. llevan directamente, o a través de un átomo de oxígeno o de azufre, un radical hidrocarburo sustituido o sin sustituir, o un radical heterocíclico.

20. Más específicamente suministra la invención un derivado de pirimidina que tiene la fórmula



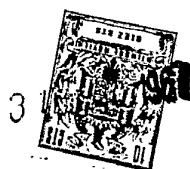
338693



- o una sal del mismo en la que R₁ y R₂ significan átomos de hidrógeno, radicales de alquilo inferior, un radical halofenilo, un radical piperidino, un radical morfolino o un radical 1-metilpiperazin-4-il,
5. R₃ representa un átomo de hidrógeno, un radical de alquilo inferior o un radical fenilo, R₄ representa un átomo de hidrógeno o bromo, un alquilo inferior, alqueno inferior o un radical bencilo, o un radical nitro, X significa un átomo de oxígeno o azufre y R₅
10. es un radical carbonilo o sulfonilo que lleva directamente, o a través de un átomo de oxígeno o azufre, un radical alquilo inferior, un radical alqueno inferior, un radical fenilo o un radical fenilo sustituido por nitro, halo o alquilo inferior, un radical piperidino, un radical furilo o un radical estirilo.
15. Derivados de pirimidina preferentes de acuerdo con la presente invención son aquellos que tienen la fórmula general arriba indicada en la que R₁ y R₂ significan hidrógeno o radicales de alquilo inferior,
20. R₃ representa hidrógeno, un radical alquilo inferior o un radical fenilo, R₄ significa un átomo de bromo,

338693

-4-



5. un radical alquilo inferior, alquenilo inferior o bencilo y R_5 es un radical carbonilo o sulfonilo llevando un radical alquilo inferior, un radical alcoxilo inferior, un radical alquiltio inferior, un radical fenilo o un radical fenilo sustituido por nitro, alquilo inferior o halo, un radical feniltio, un radical alquenilo, un radical aralquenilo o un radical piperidino o furilo, o una sal del mismo.

10. Derivados de pirimidina biológicamente especialmente activos, de acuerdo con la presente invención, son aquellos en los que R_1 y R_2 significan hidrógeno o radicales de alquilo inferior, R_3 es un radical alquilo inferior, R_4 es un radical alquilo inferior teniendo 2 a 6 átomos de carbono y R_5 es un radical carbonilo o sulfonilo llevando un radical alquilo inferior, un radical alcoxilo inferior, un radical fenilo o un radical estirilo.

15. Derivados de pirimidina biológicamente especialmente activos son aquellos en los que R_1 y R_2 son, ambos, radicales metilo o R_1 es hidrógeno y R_2 es un radical etilo, R_3 es un radical metilo, R_4 es un radical butilo o amilo, X es un átomo de oxígeno y R_5 es un radical alquilo inferior, alcoxilo inferior o fenilo.

20. Los derivados de pirimidina específicos de la invención que han demostrado ser especialmente útiles se indican en la tabla I a continuación. Los encabezamientos de las columnas de la tabla corresponden a los radicales sustituyentes en el anillo pirimidínico en la fórmula general arriba indicada.

25.

30.

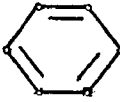
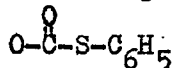

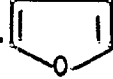
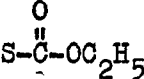
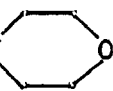
338693

-5-

31



T A B L A I

COMPUESTO Nº	NR ₁ R ₂	R ₃	R ₄	XR ₅
1	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-CO-  -NO ₂
2	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-CO-C ₆ H ₅
3	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-SO ₂ -C ₆ H ₅
4	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	O-CO-C ₆ H ₄ NO ₂ (p)
5	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-SO ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₃ (p)
6	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-SO ₂ -CH ₃
7	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	
8	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₅ H ₁₁	O-CO-C ₆ H ₅
9	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	-O-CO-C ₆ H ₄ -Cl (m)
10	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-CO-C ₆ H ₅
11	-N  -CH ₃	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-SO ₂ -CH ₃
12	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₅ H ₁₁	O-SO ₂ -CH ₃
13	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-SO ₂ -CH ₃
14	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-CO-CH ₃
15	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-SO ₂ -C ₆ H ₄ -NO ₂ (m)
16	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-CO- 
17	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	O-SO ₂ -CH ₃
18	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	
19	-N 	CH ₃	H	O-SO ₂ CH ₃

338693

-6-

31



T A B L A I (Continuación)

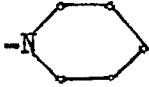



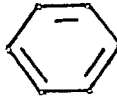

COMPUESTO Nº	NR ₁ R ₂	R ₃	R ₄	XR ₅
20			H	O-SO ₂ CH ₃
21		CH ₃	H	O-SO ₂ -C ₂ H ₅
22	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	O-CO-
23		CH ₃	H	O-SO ₂ --CH ₃
24		CH ₃	H	O-SO ₂ -
25	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	SecC ₅ H ₁₁	O-CO-
26	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-CO-CH=CH-CH ₃
27	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	O-CO-CH=CH-
28	-NH-C ₂ H ₅	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-CO-

338693

-7-

31 MAR 1967

T A B L A I (Continuación)

COMPUESTO Nº	NR ₁ R ₂	R ₃	R ₄	XR ₅
29		CH ₃	H	O-CO- 
30	-N(CH ₃) ₂	H	H	O-SO ₂ -CH ₃
31	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	Br	O-CO- 
32	-NH-  -Cl	CH ₃	H	O-CO- 
33	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	S-CO- 
34	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	O-CO-OC ₂ H ₅
35	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	O-CO-OnC ₄ H ₉
36	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	S-CO-OnC ₃ H ₇
37	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₃ H ₇	S-CO-OnC ₃ H ₇
38	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-CO-OC ₂ H ₅
39	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-CO-OnC ₃ H ₇
40	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	O-CO-OnC ₄ H ₉
41	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	nC ₄ H ₉	S-CO-OnC ₃ H ₇

338693

-8-

31

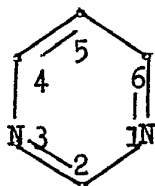


T A B L A I (Continuación)

COMPUESTO Nº	NR ₁ R ₂	R ₃	R ₄	XR ₅
42		nC ₃ H ₇	H	O-CO-
43	-N(CH ₃) ₂	nC ₃ H ₇	C ₂ H ₅	O-CO-
44		CH ₃	nC ₄ H ₉	O-CO-
45	-NH ₂		H	O-CO-
46	-N(CH ₃) ₂	CH ₃		O-CO-
47	-N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	O-SO ₂ -
48	-N(CH ₃) ₂	H	NO ₂	O-CO-

El compuesto nº 14 en la tabla I se puede hidrolizar fácilmente con agua.

En esta especificación, la numeración del anillo pirimidínico es como sigue:

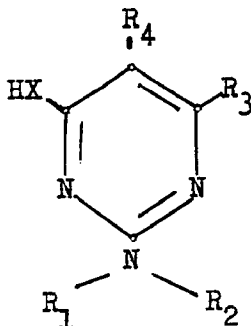


5. Se observará que las posiciones 4 y 6 son equivalentes.

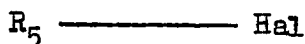
Como sales adecuadas de los derivados de pirimidina de esta invención se han de mencionar, por ejemplo, los hidroccloruros.

10. Según una ulterior característica de la invención se suministran los nuevos derivados de pirimidina señalados en la Tabla I.

La invención suministra también un procedimiento para la obtención de los derivados de pirimidina de esta invención que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula



en la que R_1, R_2, R_3, R_4 y X tienen cualquiera de los significados arriba indicados, con un haluro de acilo o de sulfonilo de fórmula



5. en la que R_5 tiene cualquiera de los significados arriba indicados y Hal significa un átomo de halógeno, bajo condiciones en las cuales el haluro de hidrógeno que se forma es retirado según se vá produciendo.

- El procedimiento arriba indicado se efectúa preferentemente en presencia de un diluyente como medio de reacción y los disolventes adecuados comprenden sustancias que actúan como disolventes para cualquiera o ambos reactivos. Disolventes adecuados son los disolventes orgánicos, por ejemplo el benceno, tolueno, las cetonas alifáticas inferiores, tales como la metiletil cetona o el acetonitrilo. Un disolvente especialmente preferido es el acetato de etilo.
- 10.
- 15.

- El haluro de hidrógeno producido durante la reacción se puede retirar, por ejemplo, efectuando la reacción en presencia de un aceptor de ácido. Aceptores de ácido adecuados son bases o las sales de una base fuerte y un ácido débil. Si se emplea una base, ésta puede ser, por ejemplo una amina terciaria. Aminas terciarias preferentes son la trietilamina y la piridina. La base puede ser también, por ejemplo, un hidróxido de metal alcalino o alcalinotérreo, por ejemplo hidróxido sódico. Si se emplea una sal de una base fuerte y de un ácido débil como aceptor de ácido entonces una sal adecuada es un carbonato de metal alcalino o alcalinotérreo. Como tal sal se dá prefe-
- 20.
- 25.

338693

-11-

34



rencia el carbonato de potasio.

- La invención comprende además un procedimiento para la obtención de los derivados de pirimidina de la invención que comprende hacer reaccionar el haluro de acilo o de sulfonilo adecuado con una sal metálica de la pirimidina 6-hidroxi ó 6-mercapto adecuada, si es necesario en presencia de un disolvente para facilitar la reacción. Los disolventes adecuados incluyen aquellos arriba mencionados.
- 5.
10. Los derivados de pirimidina de la invención poseen una gran actividad contra una gran variedad de enfermedades provocadas por los hongos, incluyendo las enfermedades específicas a continuación:
- Puccinia recondita (tizón) en el trigo
15. Phytophthora infestans (añublo tardío) en los tomates
Sphaerotheca fuliginea (moho pulverulento) en los pepinos
Erysiphe graminis (moho pulverulento) en el trigo y la cebada
20. Podosphaera leucotricha (moho pulverulento) en las manzanas
Uncinula necator (moho pulverulento) en la vid
Plasmopara viticola (moho lanuginoso) en la vid
Piricularia oryzae (blasto) en el arroz
25. Venturia inaequalis (escara) en la manzana
Pythium ultimum (podredumbre del tallo de semilla) en los guisantes
Fusarium culmorum (podredumbre del tallo) en el trigo
30. Los compuestos de la presente invención son tóxicos contra una variedad de plagas de insectos

338693

-12-



5. incluyendo las larvas de mosquito (*Aedes aegypti*), afidios negros (*Aphis fabae*), afidios verdes (*Macrosiphum pisi*), ácaros de araña roja (*Tetranychus telarius*), los escarabajos *Phaedon cochleariae* y los nematodos de nudos de raíces (*Meloidogyne incognita*).

10. Una característica especialmente útil de la actividad de los derivados de pirimidina de la presente invención es su efecto sistémico, es decir, su capacidad de moverse a través de la planta hasta alcanzar cualquier parte de la misma que tenga una infección provocada por hongos y/o los insectos y combatir la misma.

15. Se ha descubierto que la actividad biológica de los nuevos derivados de pirimidina de la invención decrece si ambos R_3 y R_4 son hidrógeno, o si R_4 es un radical alquilo que contiene más de 7 átomos de carbono.

20. Un derivado de pirimidina especialmente útil es aquél en el que R_1 y R_2 significan ambos metilo, R_4 es nC_4H_9 y XR_5 es $O-CO-C_6H_5$, es decir el compuesto nº 10 en la tabla I anterior.

25. Según una característica preferente de la invención se suministran formulaciones fungicidas que contienen como ingrediente activo la 2-dimetil-amino-4-metil-5-n-butil-6-fenilcarboniloxi-pirimidina.

Otros derivados de pirimidina particularmente útiles son los compuestos numerados 8, 10, 12, 13, 27, 28, 39, 40, y 41 en la tabla I de arriba.

30. Los derivados de pirimidina biológicamente activos de esta invención se pueden emplear para com-



3
-13338693

batir las plagas en las plantas en varias formas. Así se pueden aplicar sobre las hojas de las plantas infectadas, a las semillas o al suelo sobre el cual crece o se han de plantar las plantas.

5. Según otro aspecto, por lo tanto, la invención incluye un método para combatir las plagas indeseadas provocadas por hongos en las plantas, que comprende la aplicación sobre el lugar de la planta de un compuesto de pirimidina según anteriormente definido o una formulación según se define más adelante.
- 10.

Según otro aspecto de la invención se incluye un método para combatir las infecciones por insectos en las plantas que comprende aplicar en el lugar de la planta un derivado de pirimidina insecticidamente activo según anteriormente descrito o una formulación según se defina más adelante.

- 15.
- Según otro aspecto más, la invención incluye un método para tratar el suelo agrícola que comprende el aplicar sobre el suelo un derivado de pirimidino según arriba definido o una formulación según se define más adelante.
- 20.

- La invención incluye por lo tanto un método para combatir los patógenos de las plantas que comprende aplicar a una planta, o a la semilla de la misma, un derivado de pirimidina según arriba se define o una formulación según se define más adelante.
- 25.

- Los derivados de pirimidina de esta invención son preferentemente empleados en forma de formulaciones y estas formulaciones se pueden emplear para fines agrícolas u hortícolas. El tipo de la formulación
- 30.

330693

-14-



empleada en cualquiera de los casos dependerá de las finalidades en particular para las que se vayan a emplear.

- Las formulaciones se pueden presentar en forma
5. de polvos de espolvoreo o gránulos en el cual el ingrediente activo se mezcla con un disolvente sólido o vehículo. Diluyentes sólidos o vehículos pueden ser por ejemplo: caolín, bentonita, kieselgur, dolomita, carbonato de calcio, talco, magnesia en polvo, tierra
10. de Fuller, yeso, tierra de Hewitt, tierra de diatomeas y caolín. Las formulaciones para el tratamiento de semillas por ejemplo pueden comprender un agente que ayude a la adhesión del compuesto sobre la semilla, por ejemplo un aceite mineral.
15. Las formulaciones se pueden presentar también en forma de polvos dispersables o granos que comprenden, además del ingrediente activo, de un agente humectante que facilita la dispersión del polvo o del grano en los líquidos. Tales polvos o gránulos pueden incluir materiales de carga y similares.
20. Las formulaciones pueden presentarse también en forma de preparados líquidos para ser empleados como baños o pulverizados que generalmente son dispersiones o emulsiones acuosas que contienen el ingrediente activo en presencia de uno o varios agentes humectantes, agentes de dispersión, agentes emulsionadores o agentes de suspensión.
25. Los agentes humectantes, los agentes de dispersión y emulsión pueden ser del tipo catiónico, aniónico o no iónico. Agentes adecuados del tipo ca-
- 30.

- tiónico comprenden por ejemplo los compuestos amónicos cuaternarios, por ejemplo el bromuro cetiltrimetilamónico. Agentes adecuados del tipo aniónico comprenden por ejemplo los jabones, las sales de los monoésteres alifáticos del ácido sulfúrico, por ejemplo el sulfato laurilsódico, las sales de los compuestos aromáticos sulfonados, por ejemplo el dodecil-bencenosulfonato de sodio, el lignosulfonato de sodio, de calcio o amonio, el sulfonato de butil-naftaleno y una mezcla de
5. las sales sódicas de los ácidos diisopropil- y triisopropil-naftaleno. Agentes adecuados del tipo no iónico comprenden por ejemplo los productos de condensación de óxido de etileno con los alcoholes grasos, tales como el alcohol oleico o el alcohol cetílico, o con fenoles alquílicos, tales como el octifenol, nonilfenol y octilcresol. Otros agentes no iónicos son los ésteres parciales derivados de los ácidos grasos de cadena larga y los anhídridos de hexitol, los productos de condensación de tales ésteres parciales con óxido etilénico, y las lecitinas.
- 10.
- 15.
- 20.

Agentes de suspensión adecuados son, por ejemplo, los coloides hidrofílicos, por ejemplo, la polivinilpirrolidona, las carboximetilcelulosa de sodio, y las gomas vegetales, por ejemplo la goma arábiga y la goma tragacanto.

25. Las dispersiones acuosas o las emulsiones se pueden preparar disolviendo el ingrediente activo, o los ingredientes, en un disolvente orgánico que puede contener uno o más agentes de humectación, de dispersión o de emulsión y después agregar la mezcla, así
- 30.

338693



31 MAR 1951

-16-

5. obtenida, a agua, que asi mismo puede contener uno o más agentes de humectación , dispersión o emulsión. Disolventes orgánicos adecuados son el dicloruro de etileno, el isopropanol, el propilenglicol, el diacetanol, el tolueno, el queroseno, el metilnaftaleno, los xilenos, el tricloroetileno.

10. Las formulaciones se pueden emplear como pulverizados o también en forma de aerosoles en los cuales la formulación se mantiene en un recipiente bajo presión en presencia de un agente de impulsión, tal como fluortriclorometano o diclorodifluormetano.

15. Mediante la inclusión de aditivos adecuados, por ejemplo para mejorar la distribución, polvos adhesivos y resistentes a la lluvia, sobre las superficies tratadas, se pueden adaptar las distintas formulaciones a los varios usos para los cuales están destinados.

20. Los derivados de pirimidina se pueden formular asimismo convenientemente mezclándolos con fertilizantes. Una formulación preferente de este tipo comprende los gránulos de fertilizantes que incorporan por ejemplo mediante revestimiento, un derivado de pirimidina. El material fertilizante puede comprender por ejemplo substancias que contengan nitrógeno o fosfato.

25. Según otro aspecto de la invención, por lo tanto, se suministra un fertilizante que comprende un compuesto de pirimidina según está aquí definido.

30. Las formulaciones que se han de emplear en forma de dispersiones acuosas o emulsiones se sumi-

338693

-17-



1967

- nistran generalmente en forma de un concentrado que contiene una elevada proporción de material activo, debiéndose diluir con agua dicho concentrado antes de su empleo. Estos concentrados deben frecuentemente resistir el almacenamiento durante largos periodos de tiempo y después de tales almacenamientos ser aún capaces de disolverse en agua para formar un preparado acuoso que se mantenga homogéneo durante un período de tiempo suficiente para que pueda ser aplicado mediante un equipo pulverizador convencional. Los concentrados pueden contener convenientemente de 10 - 85% en peso de ingrediente o de ingredientes activos y generalmente del 25-60% en peso de ingrediente o ingredientes activos. Cuando se diluyen para formar preparados acuosos, tales preparados pueden contener cantidades variables de ingrediente o ingredientes activos, dependiendo del objeto para el cual se hayan de emplear, pero se puede emplear un preparado acuoso que contenga entre 0,001 % y 1,0% en peso de ingrediente o ingredientes activos.
- 5.
 - 10.
 - 15.
 - 20.

- Debe quedar entendido que los compuestos biológicamente activos de esta invención pueden comprender, además de un derivado de pirimidina, uno o más compuestos de otra clase que tengan actividad biológica. Asimismo pueden incorporar uno o varios agentes estabilizadores, por ejemplo epóxidos, tal como epiclorohidrina.
- 25.

- La invención se ilustra por los ejemplos siguientes, los numerados del 1 al 5 ejemplifican métodos para preparar los compuestos de pirimidina que se
- 30.

338693

-18-

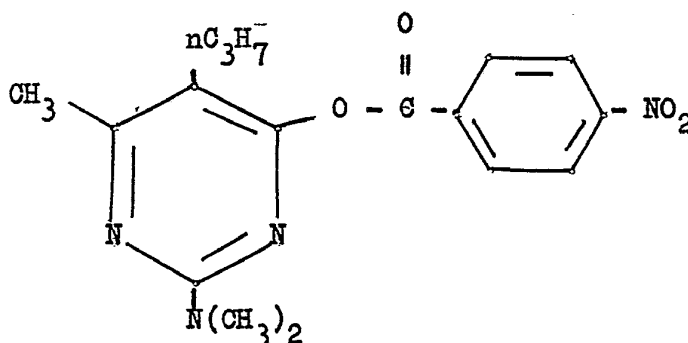


mencionan en la tabla I de arriba, mientras que los numerados del 6 al 13 ilustran formulaciones que contienen varios de los derivados de pirimidina como ingrediente activo. En este último grupo todas las referencias a las cantidades porcentuales de los constituyentes son en peso y se basan en el peso del compuesto en su totalidad.

5.

Ejemplo 1 -

10. La 2-dimetilamino-4-metil-6-(4'-nitrofenil)-carboniloxi-5-n-propilpirimidina (compuesto nº 1, tabla I) de la fórmula



15. se preparó de la manera siguiente: 2-dimetilamino-4-metil-6-hidroxi-5-n-propilpirimidina (1,95 g, 0,01 moles) se agregó a una solución de sodio (0,23 g 0,01 moles) en etanol seco (25 ml). La solución se mantuvo a 40°C durante 1 hora, el disolvente se retiró en vacío y el residuo se secó por destilación azeotrópica con benceno. Al residuo se le agregó benceno seco (25 ml) y cloruro p-nitrobenzoílico recién preparado (2,3 g, 0,012 moles) y la mezcla de reacción se agitó y se trató al reflujo durante 4 horas.
- 20.

338693

-19-



- La mezcla enfriada se agitó con solución acuosa al 5% de hidróxido sódico, frío como el hielo, se lavó con agua hasta que los lavados estaban neutros, y la capa de benceno se secó (Na_2SO_4). La eliminación del benceno, seguido de la eliminación de los últimos restos de disolvente en la bomba de aceite, dió un residuo viscoso que cristalizó al triturar con éter de petróleo. La recristalización en etanol dió un producto del p.f. 109°C (1,8 g, 53%).
- 5.
10. Aunque la reacción de arriba se realizó en benceno, se pueden emplear otros disolventes tales como tolueno, las cetonas alifáticas inferiores, tales como metiletilcetona, acetonitrilo y acetato de etilo se encontraron adecuados para esta finalidad.
15. El disolvente preferido es acetato de etilo.
- Los siguientes compuestos se prepararon asimismo según el método del ejemplo 1.

338693-20-



Compuesto Nº	Características físicas	Disolvente de cristalización
2	p.f. 58º	EtOH
3	p.f. 72º	EtOH
4	p.f. 114º	EtOH
5	p.f. 68º	EtOH
6	p.f. 71º	EtOH
7	p.e. 150-155º/ 0.1mm.	-
8	p.f. 57º	EtOH
9	p.f. 89º	EtOH
10	p.f. 59º	EtOH
11	p.f. 162º	EtOH
13	p.f. 67º	EtOH
14	p.f. 69º	EtOH
15	p.f. 109º	EtOH
16	p.f. 71º	EtOH
17	p.f. 87º	EtOH
22	p.f. 89º	EtOH
23	p.f. 104-105º	MeOH
25	p.f. 63º	EtOH
26	$n_D^{21} = 1.5282$	-
27	p.f. 88º	EtOH
28	p.f. 69-70º	EtOH/H ₂ O
29	p.f. 120º	EtOH
30	p.f. 76º	EtOH
31	p.f. 128-129º	EtOH
32	p.f. 114-116º	EtOH
42	p.f. 40-46º	EtOH

338693

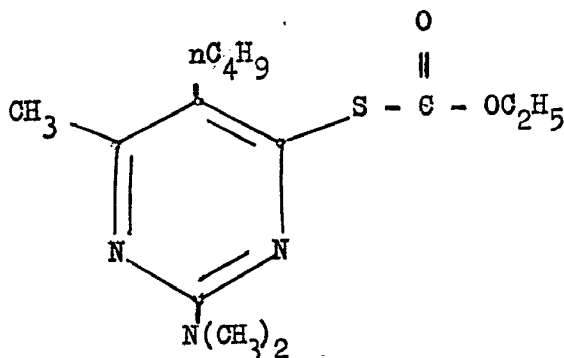
-21-



43	p.f. 62°	EtOH
44	p.f. 45°	<u>iso</u> -propil- alcohol
45	p.f. 122-123°	<u>iso</u> -propil- alcohol
46	p.f. 92°	EtOH
47	n _D ²⁰ = 1.5251	-
48	p.f. 125-126°	EtOH

Ejemplo 2 -

El S-(5-n-butil-2-dimetilamino-4-metil-6-pirimidil)O-etiltiolcarbonato (compuesto n° 18, tabla I) con la fórmula



5. se preparó de la manera siguiente: 5-n-butil-2-dimetilamino-4-metil-6-mercapto-pirimidina (6,75 g) se disolvió en una solución de hidróxido sódico (1,3 g) en agua (100 ml.). Se agregó cloroformato de etilo (3,3 g) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. El producto se obtuvo
- 10.

mediante extracción con éter. El éter se extrajo entonces con agua, se secó (Na_2SO_4) y el disolvente se retiró dejando un aceite viscoso, n_D^{26} 1,5444.

El siguiente compuesto se preparó asimismo según el método del ejemplo 2.

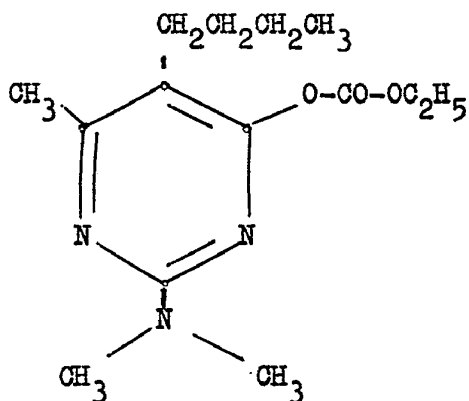
5.

Compuesto	Características físicas
33	p.e. 174-177°/0,12 mm. $n_D^{20} = 1,6008$

Ejemplo 3 -

Este ejemplo ilustra la preparación de la 5-n-butil-2-dimetilamino-4-etoxicarboniloxi-6-metilpirimidina (compuesto nº 38, Tabla I) de la siguiente estructura:

10.



A una solución de 5-n-butil-2-dimetilamino-4-hidroxi-6-metilpirimidina (5,0 g) en piridina (100 cc) se agregó gota a gota cloroformato de etilo

338693

-23-

31 MAR.



(2,9 g) y la mezcla se agitó y se mantuvo a temperatura ambiente durante 72 horas. La piridina se retiró de la mezcla por evaporación a presión reducida, y la mezcla residual se distribuyó entre agua y cloruro metilénico. La capa acuosa se desechó y la solución de cloruro metilénico se lavó dos veces con agua, después dos veces con igual volumen de una solución al 4% de hidróxido sódico, y finalmente con agua hasta que los lavados estaban neutros.

5. Después de secar la solución de cloruro metilénico sobre sulfato sódico anhidro y filtrar para retirar el sólido, se evaporó el cloruro metilénico y el aceite residual se destiló. La 5-n-butil-2-dimetilamino-4-etoxi-carboniloxi-6-metilpirimidina se obtuvo como aceite incoloro del p.e. 109-110° a 0,01 mm. Hg, $n_D^{22,5} = 1,5034$.

15.

Los siguientes compuestos se obtuvieron asimismo según el método del ejemplo 3.

Compuesto nº	p.e.
34	106-109°C/0.01 mm.
35	105°C/0.03 mm.
36	119-120°C/0.05 mm.
37	99-101°C/0.02 mm.
39	118-119°C/0.04 mm.
40	122-123°C/0.01 mm.
41	132-134°C/0.015 mm.

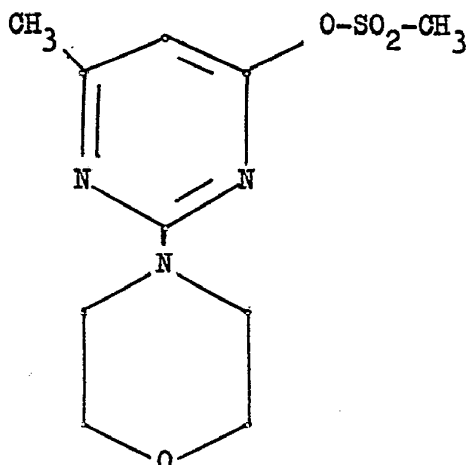
338693

-24-

31 MAR

Ejemplo 4 -

La 4-metil-6-metilsulfoniloxi-2-morfolino-pirimidina (compuesto nº19, tabla I) que tiene la fórmula



5. se preparó como sigue: 4-hidroxi-6-metil-2-morfolino-pirimidina (4,87 g, 0,025 moles) se suspendió en dimetilformamida seca (25 ml) y a la suspensión agitada se agregó, en una sola vez, 2 ml, 0,025 moles, de cloruro metano-sulfónico. A la mezcla agitada se
10. agregaron gota a gota desde una probeta, 3,5 ml 0,025 moles de trietilamina. La temperatura de la mezcla de reacción se elevó a 42°C y la mezcla se volvió casi clara. Se continuó la agitación durante 2 horas, la solución se filtró y el filtrado se vertió en
15. agua de hielo. El material filtrado se separó por filtración, se lavó con un poco de agua fría como el hielo y se secó. La recrystalización en etanol dió el producto, 4,05 g (68%) p.f. 131°C.

Los siguientes compuestos se prepararon así-

338693

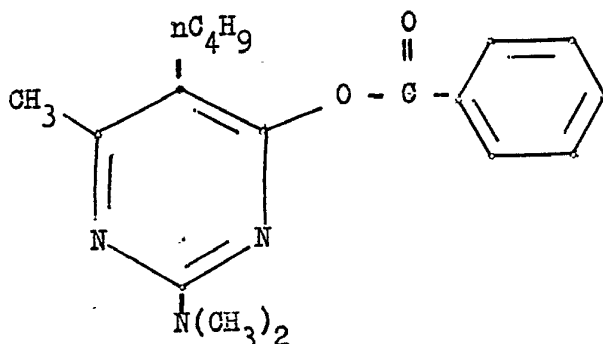
-25-



mismo según el método del ejemplo 4.

Compuesto Nº	Características físicas	disolvente de cristalización
20	p.f. 138°C	EtOH
21	p.f. 76°C	EtOH
24	p.f. 113-114°C	EtOH

Ejemplo 5 -



- La 5-n-butyl-2-dimetilamino-4-metil-6-fenil-carboniloxipirimidina (compuesto nº 10, Tabla I),
5. que tiene la fórmula de arriba, se preparó de la manera siguiente: Una mezcla de 5-n-butyl-2-dimetilamino-4-hidroxi-6-metilpirimidina (4,18 g, 0,02 moles) carbonato potásico anhidro (2,76 g, 0,02 moles) cloruro benzoílico (2,81 g, 0,02 moles) y acetato de etilo
10. (50 ml) se agitó y se calentó bajo reflujo durante 7 horas. La mezcla de reacción se dejó durante la noche a temperatura ambiente, el disolvente se retiró en vacío, el residuo se recibió entonces en tolueno (100 ml). El tolueno se lavó con solución acuosa al 5%, fría como el hielo, de hidróxido sódico,
- 15.

332693

-26-

después con agua hasta que los lavados estaban neutros, y finalmente se secó ($MgSO_4$). Retirando el tolueno en vacío quedó el producto como un sólido cristalino blanco (5,2 g, 83%) que se recristalizó en etanol, p.f. 59°C.

5.

Se encontró que la reacción de arriba transcurre favorablemente con los disolventes benceno, tolueno, etilmetilcetona y acetonitrilo. El acetato de etilo fué también un disolvente adecuado.

10.

En los ejemplos siguientes las palabras "LUBROL", "AROMASOL", "DISPERSOL", "LISSAPOL", "CELLOFAS" son marcas registradas.

Ejemplo 6 -

15.

Se preparó un concentrado de emulsión mezclando juntos los ingredientes indicados más abajo en las proporciones indicadas y agitando la mezcla hasta que todos los constituyentes se habían disueltos:

20.

Compuesto nº 10	10%
Dicloruro de etileno	40%
Sulfonato dodecibencénico de calcio	5%
"Lubrol" I	10%
"Aromasol" H	35%

Ejemplo 7 -

25.

Una formulación en forma de gránulos fácilmente dispersables en un líquido, por ejemplo agua, se preparó molido conjuntamente, primero, tres de los ingredientes mencionados más abajo, en presencia de agua, y después mezclando con acetato sódico. La mezcla resultante se secó y se pasó a través de un tamiz

30.

338693

31 MAR



-27-

de malla British Standard, tamaño 44-100, para obtener el tamaño de grano deseado.

5.	Compuesto nº 10	50%
	"Dispersol" T	25%
	"Lubrol" APN5	1,5%
	Acetato sódico	23,5%

Ejemplo 8 -

10. Los ingredientes mencionados más abajo se moliden conjuntamente en las proporciones indicadas para producir una formulación en polvo fácilmente dispersable en líquidos.

15.	Compuesto nº 10	45%
	"Dispersol" T	5%
	"Lissapol" NX	0,5%
	"Cellofas" B600	2%
	Acetato de sodio	47,5%

Ejemplo 9 -

20. El ingrediente activo (compuesto nº 10 de la tabla I) se disolvió en un disolvente y el líquido resultante se pulverizó sobre gránulos de tierra de Fuller. Se dejó entonces evaporar el disolvente para producir una formulación granular.

25.	Compuesto nº 10	5%
	Tierra de Fuller o gránulos de caolín	95%

Ejemplo 10 -

30. Una formulación adecuada para empleo como revestimiento de semillas se preparó mezclando los tres sustituyentes mencionados más abajo en las proporciones señaladas.

338693

-28-

31 MAR. 1967
50%



Compuesto n° 10	
Aceite mineral	2%
Caolín	48%

Ejemplo 11 -

5. Un polvo de espolvoreo se preparó mezclando en las proporciones indicadas, el ingrediente activo con talco.

Compuesto n° 10	5%
Talco	95%

10. Ejemplo 12 -

Se prepara una formulación Col molturando en un molino de bolas los constituyentes mencionados más abajo y después formando una suspensión acuosa de la mezcla molturada con agua.

15.	Compuesto n° 10	40%
	"Dispensol"	10%
	"Lubrol"	1%
	Agua	49%

Ejemplo 13 -

20. Formulaciones similares a las indicadas en los ejemplos 6 - 12 de arriba, pero conteniendo como ingrediente activo un compuesto n° 5, 6, 8, 9, 11 a 13, 27, 28, 35 a 41 respectivamente de la tabla I de arriba se prepararon según métodos similares a los descritos en cada uno de los ejemplos en particular.

25. Las formulaciones de acuerdo con la invención se prepararon en la forma siguiente y se ensayaron contra varias enfermedades producidas por hongos, y los resultados de estos ensayos se muestran en las tablas II y III a continuación. En los ensayos, se
- 30.

338693
-29-



- efectuó tanto un ensayo protectivo como un ensayo eradicativo y en el ensayo protectivo se rociaron las plantas de manera que las hojas quedasen humedecidas con una solución o suspensión conteniendo 500 partes por millón del compuesto activo y 0,1% de un agente humectante y después de 24 horas se inoculó con la enfermedad cuya extensión se determinó visualmente al final del ensayo. En el ensayo eradicativo se inocularon las plantas con la enfermedad y después de un número de días dependiendo de la enfermedad se pulverizaron (de manera que las hojas quedasen húmedas) con una solución o suspensión conteniendo 500 partes por millón del compuesto activo y 0,1% de agente humectante. Los resultados se muestran en la tabla II a continuación como una graduación que indica el porcentaje de enfermedad como sigue:
- 5.
- 10.
- 15.

	<u>Graduación</u>	<u>Porcentaje de enfermedad</u>
	0	61 a 100
	1	26 a 60
20.	2	6 a 25
	3	0 a 5

POOR QUALITY

338693

-30-

T A B L A II

COMPUES TO	NUMERO	PUCINIA RECONDITA (tizón)		PHYTOPHTHORA INFESTANS (Anubio tardío)		SPHAEROBLECA FULGINEA (Moho pulverulento)		ERYSIPHE GRAMINIS (Moho pulverulento)		ERYSIPHE GRAMINIS (Moho pulverulento)		PODOSPHAERA LEUCOPERICHA (Moho pulv. verulento)		UNGUICULA NEGATOR (Moho pulverulento)		PLASMOPIRA VITICOLA (Moho lanuginoso)		PERICULARIA GRYZAE (Elasto)		VENTURIA INAEQUALIS (Escara)		
		Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	
1		0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
2		0	0	0	0	3	0	0	0	3	0	3	0	1	0	2	0	0	0	0	0	0
3		0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
4		0	0	1	0	3	0	2	0	2	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
5		0	0	2	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
6		0	0	3	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
7		0	0	2	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
8		1	0	2	0	3	0	3	0	3	0	3	0	3	0	0	0	3	0	0	0	0
9		1	0	2	0	3	0	3	0	3	0	3	0	1	0	1	0	3	0	0	0	0
10		2	0	2	0	3	0	3	0	3	0	3	0	3	0	1	0	1	0	0	0	0
11		0	0	2	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
12		1	0	3	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
13		0	0	3	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
14		0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
15		0	0	0	0	3	0	2	0	0	0	0	0	1	0	0	0	1	0	0	0	0
16		1	0	0	0	3	0	0	0	3	0	3	0	1	0	0	0	1	0	0	0	0
17		0	0	3	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
18		0	0	1	0	1	0	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	3	0	0
19		1	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	1	0	3	0	0	0	1	0	0
20		1	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0
21		2	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0
22		0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	1	0	0	0



31

338693

T A B L A II

COMPUESTO - NUMERO	PUCCINIA RECONDITA (Tizón)		PHYTOPHTHORA INFESTANS (Añublo tardío)		SPHAEROTHECA FULIGINEA (Moho pulverulento)		ERYSIPHE GRAMINIS (Moho pulverulento)		ERYSIPHE GRAMINIS (Moho pulverulento)		PODOSYPHE LEUCOTRI (Moho pulverulento)	
	Trigo 10		Tomates 4		Pepinos 10		Trigo 10		Cebada 10		Manzanilla 7-14	
	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad
1	0	0	0	-	3	-	-	-	-	-	-	-
2	0	0	0	-	3	3	3	-	3	-	3	3
3	0	0	0	-	3	1	-	-	-	-	-	-
4	0	0	1	-	3	3	2	-	2	-	1	-
5	0	0	2	-	3	2	-	-	-	-	-	-
6	0	0	3	-	3	2	-	-	-	-	-	-
7	0	0	2	-	3	3	-	-	-	-	-	-
8	1	0	2	-	3	3	3	-	3	-	3	3
9	1	0	2	-	3	3	3	-	3	-	3	-
10	2	0	2	-	3	3	3	-	3	-	3	-
11	0	0	2	-	2	2	-	-	-	-	-	-
12	1	0	3	-	3	3	-	-	-	-	-	-
13	0	0	3	-	3	3	-	-	-	-	-	-
14	-	-	-	-	3	3	-	-	-	-	-	-
15	0	0	0	-	3	2	-	-	-	-	-	-
16	1	0	0	-	3	3	2	0	3	-	3	-
17	0	0	3	-	2	0	-	-	-	-	-	-
18	0	0	-	-	1	3	0	-	0	-	3	-
19	1	0	0	-	0	0	1	-	0	-	0	-
20	1	0	0	-	0	0	1	-	0	-	2	-
21	2	0	1	-	0	0	0	-	0	-	0	-
22	0	0	0	-	-	1	0	-	0	-	3	-

POOR QUALITY

538693



Erad	PODOSPHAERA LEUCOTRICHA (Moho pulve- rulento)		UNCINULA NECATOR (Moho pul- verulento)		PLASMOPARA VITICOLA (Moho lanu- ginoso)		PIRICULARIA ORYZAE (Blasto)		VENTURIA INAEQUALIS (Escara)	
	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad
	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
3	3	1	-	2	-	-	-	-	0	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
1	-	0	-	0	-	-	-	-	0	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
3	3	3	-	0	-	3	-	0	0	-
3	-	1	-	1	-	3	-	0	0	-
3	-	3	-	1	-	1	-	0	0	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
3	-	1	-	0	-	1	-	0	0	-
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
3	-	2	-	0	-	0	-	0	3	-
0	-	1	-	3	-	0	-	0	1	-
2	-	0	-	1	-	0	-	0	0	-
0	-	0	-	2	-	0	-	0	3	-
3	-	0	-	1	-	1	-	1	1	-

338693

91 MAR

T A B L A II (continua)

COMPUESTO NUMERO	PUCCINIA RECONDITA (tizón)	PHYTOPHTHORA INFESTANS (Añublo tar- dio)	SPHAEROTHECA FULGINEA (Moho pulve- ruento)	ERYSIPHE GRAMINIS (Moho pulve- ruento)	CEBADA GRAMINIS (Moho pul- verulento)	PODOSPHAERA LEUCOTRICHA (Moho pulve- ruento)	UNCINULA NECATOR (Moho pul- verulento)	PLASMOPARA VITICOLA (Moho lanu- ginoso)	PERICULARIA ORYZAE (Elasto)	VENTURIA INAEQUALIS (Escara)
	Trigo 10	Tomates 4	Pepinos 10	Trigo 10	Cebada 10	Manzana 7-14	Vid 14	Vid 7	Arroz 7	Manzana 14
	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad	Prot Erad
23	0 0	0 -	0 0	0 -	2 -	1 -	1 -	2 -	1 -	0 -
24	0 0	1 -	0 0	1 -	0 -	1 -	0 -	2 -	0 -	0 -
25	0 0	0 -	3 2	3 -	1 -	-	-	-	0 -	-
26	0 0	0 -	3 3	1 -	2 -	2 -	0 -	0 -	2 -	3 -
27	0 0	0 -	3 2	3 -	3 -	3 -	2 -	1 -	1 -	0 -
28	0 0	1 -	3 3	3 -	3 -	3 -	3 -	2 -	3 -	1 -
29	2 -	1 -	1 0	0 -	2 -	0 -	1 -	0 -	-	1 -
30	1 0	1 -	0 0	-	-	-	-	-	-	-
33	0 0	1 -	3 3	0 -	0 -	1 -	0 -	2 -	0 -	0 -
34	0 0	1 -	0 3	1 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -	1 -
35	0 0	0 -	0 2	0 -	1 -	0 -	1 -	0 -	0 -	1 -
36	0 0	1 -	0 1	1 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -
37	0 0	-	3 3	0 -	2 -	0 -	0 -	0 -	0 -	0 -
38	0 0	-	3 3	2 -	3 -	3 -	1 -	0 -	0 -	2 -
39	0 0	-	3 3	0 -	1 -	3 -	1 -	0 -	0 -	3 -
40	0 0	-	3 3	2 -	1 -	3 -	1 -	0 -	0 -	3 -
41	0 0	1 -	3 3	3 -	2 -	3 -	2 -	0 -	0 -	1 -
44	0 0	0 -	3 3	-	-	-	-	-	-	-

POOR
QUALITY

338693

-31-

338693

T A B L A II (continuación)

COMPUESTO NUMERO	PUCCINIA RECONDITA (Tizón)		PHYTOPHTHORA INFESTANS (Añublo tar- dío)		SPHAEROTHECA FULIGINEA (Moho pulve- rulento)		ERYSIPIHE GRAMINIS (Moho pulve- rulento)		ERYSIPIHE GRAMINIS (Moho pulve- rulento)	
	Trigo		Tomates		Pepinos		Trigo		Cebada	
	10		4		10		10		10	
	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad	Prot	Erad
23	0	0	0	-	0	0	0	-	2	-
24	0	0	1	-	0	0	1	-	0	-
25	0	0	0	-	3	2	3	-	1	-
26	0	0	0	-	3	3	1	-	2	-
27	0	0	0	-	3	2	3	-	3	-
28	0	0	1	-	3	3	3	-	3	-
29	2	-	1	-	1	0	0	-	2	-
30	1	0	1	-	0	0	-	-	1	-
33	0	0	1	-	3	3	0	-	0	-
34	0	0	1	-	0	3	1	-	0	-
35	0	0	0	-	0	2	0	-	1	-
36	0	0	1	-	0	1	1	-	0	-
37	0	0	-	-	3	3	0	-	2	-
38	0	0	-	-	3	3	2	-	3	-
39	0	0	-	-	3	3	0	-	1	-
40	0	0	-	-	3	3	2	-	1	-
41	0	0	1	-	3	3	3	-	2	-
44	0	0	0	-	3	3	-	-	-	-

POOR
QUALITY

338693

-32-

31



- La toxicidad de un número de compuestos de esta invención contra una variedad de plagas de insectos fué objeto de investigación y los ensayos realizados y los resultados obtenidos se indican más abajo. Los compuestos de la invención se emplearon en cada caso en forma de un preparado líquido conteniendo 0,1% en peso del compuesto activo. Los preparados se obtuvieron disolviendo cada uno de los compuestos en una mezcla de disolventes, compuesta de 4 partes en volumen de acetona y 1 parte en volumen de alcohol diacetónico. Las soluciones se diluyeron entonces con agua conteniendo 0,01% en peso de un agente de humectación vendido bajo el nombre registrado "LISSAPOL" NX hasta que las preparaciones líquidas contenían la concentración del compuesto deseada (LISSAPOL es una marca registrada).
- 5.
- 10.
- 15.

- El procedimiento de ensayo adaptado con relación a cada insecto de ensayo fué básicamente el mismo y comprendía el mantener un número de insectos en algún medio, que podía ser una planta hospedantes o algún alimento del cual se alimente el insecto, y tratar cada uno o ambos, el insecto y el medio, con la preparación. La mortalidad de los insectos fué entonces determinada en períodos que varían entre una a tres días después del tratamiento.
- 20.
- 25.

- Los resultados de los ensayos se indican más abajo en la tabla III. En esta tabla indica la primera columna el compuesto empleado. Cada una de las columnas siguientes indica el nombre del insecto ensayado, la planta hospedante o el medio en el que se man-
- 30.

332693



-33-

tuvo el insecto y el número de días que se dejaron transcurrir después del tratamiento antes de determinar el porcentaje de los insectos que se habían matado. Esta determinación se expresó en números enteros que van del 0 al 3.

5.

0	significa	que	se	mataron	menos	del	30%
1	"	"	"	"	del	30	al 49%
2	"	"	"	"	del	50	al 90%
3	"	"	"	"	más	del	90%

10.

La concentración del compuesto de la invención en las soluciones empleadas era de 1.000 partes por millón para todas las plagas, excepto en los casos de *Aedes aegypti* y *Meloidogyne incognita* en los cuales la concentración del compuesto de la invención empleada fué de 100 partes por millón.

15.

332693

-34-

31 MAR



T A B L A III

Compueto No.	AEDES AEGYPTA	APHIS FABAE	MACROSIPHUM PISI	TETRANYCHUS TELARIUS	TETRANYCHUS TELARIUS	PHAEDON COCHLE- ARIAE	MELOIDOGY NE INCOGNITA
	larva de mosqui- to.	Afidio negro	Afidio verde	Acaro de araña roja	Huevos de araña roja	Escara bajo	Nematodos de nudo de raíz
	Agua	Judía ancha	Judía ancha	Judía francesa	Judía francesa	Papel de mostaza	Agua
	-	2 dias	2 dias	3 dias	3 dias	2 dias	2 dias
5	0	2	3	2	0	-	-
6	0	2	3	0	0	-	-
9	0	2	2	0	0	-	-
17	0	2	2	0	0	-	-
19	2	0	0	2	0	-	-
22	1	0	0	2	3	2	-
30	3	1	1	0	0	-	-
35	-	-	2	0	0	-	1
36	3	-	-	-	-	-	3
37	-	-	-	-	-	-	3
38	3	-	-	-	-	-	-
40	2	-	-	-	-	-	-
41	2	-	-	-	-	-	-
45	2	-	-	-	-	-	-

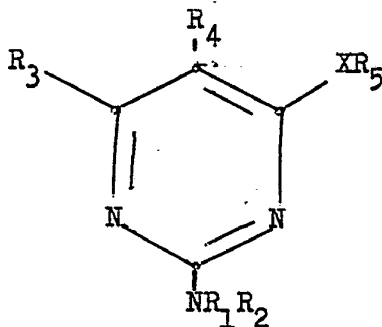
31 MAR. 1967



-35-
N O T **338693**

- 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 Inglaterra nº 14270/66 de 31 de marzo de 1966, que fué completada el 10 de marzo de 1967 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 LA PREPARACION DE UNA COMPOSICION FUNGICIDA"; caracterizándose por lo siguiente:
- 5.
- 10.
- 15.

- 1^a - Procedimiento para la preparación de una composición fungicida, caracterizado porque un derivado de pirimidina que tiene la fórmula
- 20.



338693



-36-

31 MAR 1967

- o una sal del mismo, en la que R_1 y R_2 representan átomos de hidrógeno, radicales de hidrocarburo sustituidos o sin sustituir, o junto con el átomo de nitrógeno adyacente forman un anillo heterocíclico que puede contener uno o más heteroátomos adicionales; R_3 y R_4 significan átomos de hidrógeno o halógeno, radicales de hidrocarburo sustituidos o sin sustituir, o radicales nitro; X significa un átomo de oxígeno o de azufre y R_5 es un radical carbonilo o sulfonilo que
5. llevan directamente, o a través de un átomo de oxígeno o de azufre, un radical hidrocarburo sustituido o sin sustituir, o un radical heterocíclico, se mezcla con un vehículo para el ingrediente activo y que comprende un diluyente sólido o un diluyente líquido
10. que contiene un agente humectante.
- 15.

2* - Procedimiento para la preparación de una composición fungicida, tal y como queda substancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de treinta y seis hojas escritas a máquina por una sola cara

Madrid,

31 MAR 1967

IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED,

J. GOMEZ ACERO Y MODEX
c/ San Mateo, 10 - Madrid - España