

P. 36.205.-

NSKK Case 178



344577

**Memoria descriptiva**

para solicitar PATENTE DE INVENCION

por 20 años

a nombre de NIPPON SODA KABUSHIKI KAISHA

entidad / ~~de nacionalidad~~ japonesa

con domicilio en No. 4,2-chome, Ote-machi, Chiyoda-ku,  
Tokyo-to, Japón

por: "UN METODO DE COMBATIR HONGOS Y BACTERIAS"  
(Clase Internacional A01n)

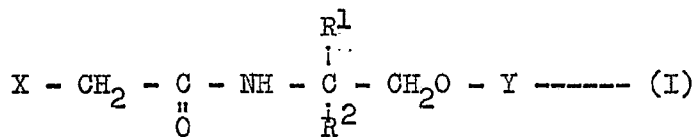
22.9.67



Este invento se refiere a un método para reprimir enfermedades o afecciones de plantas, utilizando N-haloacetamidas, y a composiciones fungicidas y bactericidas para los mismos fines.

5            Se ha descubierto que ciertas haloacetamidas de la fórmula descrita a continuación, y composiciones que contienen estos compuestos, tienen actividad superior como fungicidas y bactericidas, especialmente para la represión de enfermedades o afecciones de hongos tales como enfermedades o afecciones de mildiu pulverulento sobre pepinos  
10            y fresas, y enfermedades o afecciones bacterianas tales como el cancro o gangrena del limón y el tizón bacteriano de hojas de la planta de arroz.

15            Los compuestos de los ingredientes activos como fungicidas y bactericidas del invento tienen la siguiente fórmula (I)



en la que X es un átomo de cloro o bromo, Y es un radical hidrógeno o acetilo, y cada uno de los grupos R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> es un radical alcohilo que tiene de 1 a 3 átomos de carbono,  
20            un radical hidroxialcohilo que tiene de 1 a 3 átomos de carbono, o un radical acetoxialcohilo que tiene de 3 a 5 átomos de carbono.

Los compuestos activos del invento están ilustrados en la siguiente tabla I.

**344577**



TABLA I

Compuesto No	Fórmula	Nombre químico	Constante física
I	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	N-1,1-dimetil-2-hidroxi-etil monocloroacetamida	p. de eb. 130-134°C /6mmHg
II	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	N-1,1-dimetil-2-hidroxi-etil monobromoacetamida	ND <sub>26,5</sub> : 1,5144
III	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2-\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroxi-etil)-etil monocloroacetamida	ND <sub>20</sub> : 1,4967
IV	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2-\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroxi-etil)-etil monobromoacetamida	p. de f. 103-105°C
V	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroxi-etil)-propil monocloroacetamida	ND <sub>20</sub> : 1,4940
VI	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroxi-etil)-propil monobromoacetamida	ND <sub>26,5</sub> : 1,5163
VII	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroxi-etil)-2-hidroxi-etil monocloroacetamida	ND <sub>22</sub> : 1,4688
VIII	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroxi-etil)-2-hidroxi-etil monobromoacetamida	ND <sub>26,5</sub> : 1,5216

344577

344577

POOR QUALITY

TABLA I

Compuesto No	Fórmula	Nombre químico	Constante
I	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array}$	N-1,1-dimetil-2-hidroxi-etil monocloroacetamida	p. de eb.
II	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array}$	N-1,1-dimetil-2-hidroxi-etil monobromoacetamida	ND <sup>26,5</sup> : 1,
III	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2-\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroximetil)-etil monocloroacetamida	ND <sup>20</sup> : 1,49
IV	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2-\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroximetil)-etil monobromoacetamida	p. de f. 1
V	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroximetil)-propil monocloroacetamida	ND <sup>20</sup> : 1,49
VI	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{BrCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroximetil)-propil monobromoacetamida	ND <sup>26,5</sup> : 1.
VII	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroximetil)-2-hidroxi-etil monocloroacetamida	ND <sup>22</sup> : 1,46
VIII	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{BrCH}_2\text{C}-\text{NH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OH} \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	N-1,1-bis(hidroximetil)-2-hidroxi-etil monobromoacetamida	ND <sup>26,5</sup> : 1

344577



30	Constante física
il-2-hidro cloroaceta	p. de eb. 130-134°C /6mmHg
il-2-hidro bromoaceta	ND <sup>26,5</sup> : 1,5144
idroxime- onocloroace	ND <sup>20</sup> : 1,4967
idroxime- onobromoace	p. de f. 103-105°C
idroxime- monocloroace	ND <sup>20</sup> : 1,4940
idroxime- monobro-	ND <sup>26,5</sup> : 1,5163
idroxime- oxietil mo- amida	ND <sup>22</sup> : 1,4688
hidroxime- roxietil cetamida	ND <sup>26,5</sup> : 1,5216

344577

POOR  
QUALITY



Tabla I (continuación)

Compuesto nº	Fórmula	Nombre químico	Constante física
IX	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{C}-\text{NH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	N-1,1-bis(acetoximetil)-etil monocloroacetamida	ND <sup>25,5</sup> : 1,4397
X	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	N-1,1-bis(acetoximetil)-etil monocloroacetamida	ND <sup>25</sup> : 1,4779
XI	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	N-1,1-bis(acetoximetil)-2-acetoxietil monocloroacetamida	FD <sup>25,5</sup> : 1,4452
XII	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CN}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	N-1,1-dimetil-2-acetoxietil monocloroacetamida	ND <sup>25,5</sup> : 1,4650

344577

344577

POOR QUALITY

Tabla I (continuación)

Compuesto nº	Fórmula	Nombre químico	Constante
IX	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{C}-\text{NH}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	N-1,1-bis(acetoximetil)-etil monocloroacetamida	ND <sup>25,5</sup> : 1
X	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	N-1,1-bis(acetoximetil)-etil monocloroacetamida	ND <sup>25</sup> : 1
XI	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CNH}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	N-1,1-bis(acetoximetil)-2-acetoxietil monocloroacetamida	ND <sup>25,5</sup> : 1
XII	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{ClCH}_2\text{CN}-\text{C}-\text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \\   \\ \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array}$	N-1,1-dimetil-2-acetoxietil monocloroacetamida	ND <sup>25,5</sup> : 1

344577

POOR  
QUALITY

uación)

uímico	Constante física
is(acetoxi- etil mono- etamida	ND <sup>25,5</sup> : 1,4397
is(acetoxi- etil mono- etamida	ND <sup>25</sup> : 1,4779
is(acetoxi- -acetoxie- ocloroaceta	ND <sup>25,5</sup> : 1,4452
imetil-2-ace l monocloro	ND <sup>25,5</sup> : 1,4650

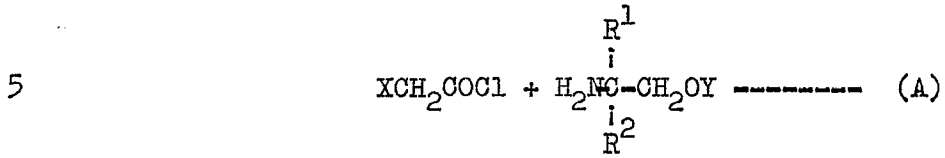


344577



5 OCT.

Los compuestos anteriores pueden ser preparados de acuerdo con un método conocido, por ejemplo el mostrado en la siguiente ecuación (A):



En este invento, usualmente una cantidad pequeña pero eficaz de los compuestos es aplicada por pulverización, a la superficie de las plantas y por riego sobre o dentro del suelo, cerca de las raíces de las plantas, para protegerlas de los hongos y bacterias, o para reprimirlos.

10

Las concentraciones de los ingredientes activos de los compuestos en estas composiciones de este invento varían según el tipo de la formulación, y se utilizan en un margen de 10 a 80%, más preferiblemente de 20 a 60%, en el polvo humectable, en uno de 0,5 a 10%, más preferiblemente de 1 a 5%, en la formulación de polvo para espolvorear, y en uno de 10 a 70%, más preferiblemente de 10 a 50%, en el concentrado emulsificable. Los ejemplos no limitativos de las composiciones del invento están ilustradas seguidamente:

15

20

Ejemplo 1. Polvo humectable

	Partes en peso
Compuesto I	30
25 Alcohilsulfonato de sodio	5
Dinaftilmetanodisulfonato de sodio	2
Tierras de diatomeas	63

Estos compuestos fueron mezclados y reducidos o des-

344577



menuzados a tamaño de micras en un pulverizador de chorro, hasta un tamaño de partículas de 4 a 20 micras. En la utilización práctica, la mezcla desmenuzada hasta tamaño de micras fué diluida con agua hasta una concentración de 0,01 a 0,05% de ingrediente activo, La suspensión fué aplicada por pulverización o riego.

Ejemplo 2: Formulación de polvo para espolvorear

		Partes en peso
	Compuesto V	5
10	Talco	94,8
	Alcoholarilpolioxietileno	0,2

Estos compuestos fueron mezclados y triturados en forma de polvo fino. La formulación de polvo para espolvorear fué aplicada espolvoreando en una dosis de 3 a 5 kg por 10 áreas.

Ejemplo 3: Concentrado emulsificable

		Partes en peso
	Compuesto III	20
	Xileno	50
20	Ciclohexanona	20
	Alcoholarilpolioxietileno	10

Estos compuestos fueron mezclados y disueltos. En la utilización práctica, esta solución fué diluida con agua en una concentración de 0,01 a 0,05% de ingrediente activo, y esta suspensión fué pulverizada o aplicada por riego.

En los ejemplos 1 a 3, no se pretende limitar los agentes emulsificantes, humectantes o dispersantes, vehí

**344577**



culos y disolventes, a los allí descritos.

Los superiores efectos fungicidas y bactericidas de los compuestos o ingredientes activos, de las composiciones y de los métodos de este invento, están ilustrados con claridad por los siguientes ensayos.

Ejemplo 4

Los compuestos fueron ensayados para reprimir la enfermedad o afección del mildiú pulverulento en pepinos. Plantas de pepino de 20 días de edad fueron pulverizadas con la solución diluída de cada compuesto, dos veces en el intervalo de 10 días. Al comienzo del ensayo, plantas de pepino gravemente infectadas con mildiú pulverulento Sphaerotheca fuligines, fueron colocadas al azar entre las plantas tratadas para ensayar o figurar una infección natural. El índice de afección o enfermedad de las hojas de pepino, que se determina por graduación según el grado de la zona afectada comparado con el de las plantas no tratadas, fué estimado el día 20 después de la primera pulverización. El índice de represión fué calculado por la siguiente ecuación.

$$\text{Indice de represión (\%)} = \left(1 - \frac{\text{suma de índices de afectadas en las plantas tratadas}}{\text{suma de índices de afectadas en las plantas no tratadas}}\right) \times 100$$

Los resultados están mostrados en la tabla II

344577



Tabla II

Represión de mildiú pulverulento en pepinos

	Compuesto	Concentracion de Ingrediente acti- vo (ppm)	Indice de re- presión (%)	Fitotoxici- dad
5	I	300	100	ninguna
	II	300	100	ninguna
	III	300	100	ninguna
10	IV	300	97	ninguna
	V	300	100	ninguna
	VI	300	96	ninguna
	VII	300	83	ninguna
	VIII	300	89	ninguna
15	IX	300	91	ninguna
	X	300	95	ninguna
	XI	300	86	ninguna
	XII	300	98	ninguna
	XIII	300	81	ninguna
20	Crotonato de 2-(1-me- til n-hep- til)-4,6-di- nitro feni- lo *	200	76	ninguna
25	No trata- das	-	0,0	-

Nota: \* El compuesto es un fungicida comercial bien conocido como Karathane para la represión de la enfermedad o afección de mildiú pulverulento, producido y vendido por Rohm & Haas Co.

30

344577



Ejemplo 5

Los compuestos fueron ensayados para reprimir la enfermedad del tizón bacteriano de las hojas en plantas de arroz. Plantas de arroz de 60 días de edad fueron inoculadas con la suspensión de bacterias causantes de Xanthomonas oryzae. Las composiciones preparadas de acuerdo con el método del ejemplo 1 fueron diluidas con agua y pulverizadas sobre estas plantas. Se efectuó una investigación a los 27 días después del tratamiento. Los resultados están mostrados en la tabla III.

Tabla III

Represión del tizón bacteriano de hojas de plantas de arroz.

	Compuesto	Concentración de ingrediente activo. (ppm)	Indice de re- presión	Pitotoxicidad
15	II	500	94,7	ninguna
	III	500	80,6	ninguna
	IV	500	96,4	ninguna
20	V	500	84,8	ninguna
	VII	500	83,3	ninguna
	VIII	500	98,1	ninguna
	XI	500	90,5	ninguna
	Cloramfenicol	200	76,7	ninguna
25	Comparación o testigo	-	0	-

Ejemplo 6. Los compuestos fueron ensayados para reprimir la enfermedad o afección del cancro o gangrena del limón sobre plantas de limonero. Plantas de limonero



5 sembradas en maceta, de 10 años de edad, fueron pulverizadas con la solución diluida de concentrado emulsificable preparado en el ejemplo 3. 5 días después de la pulverización, estas plantas fueron inoculadas con la suspensión de bacterias causantes, Xanthomonas citri. Finalmente se realizó la investigación a los 20 días después de la inoculación. Los resultados están mostrados en la tabla IV.

10 Tabla IV  
Represión del cancro o gangrena del limón.

Compuesto químico número	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Índice de represión	Fitotoxicidad
15 I	500	76,6	ninguna
II	500	90,9	ninguna
IV	500	80,2	ninguna
VI	500	91,5	ninguna
VII	500	83,9	ninguna
20 VIII	500	96,7	ninguna
Dihidro-estreptomina	200	80,2	ninguna
Comparación o testigo	-	0	-

25 Esta solicitud que corresponde a la presentada en el Japón el 30 de Agosto de 1966, bajo el Núm. 56676/66, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

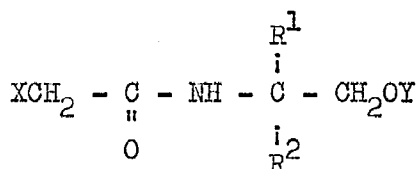
**344577**

22.9.67



Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

1º.- Un método de combatir hongos y bacterias que comprende aplicar a plantas o a suelos cultivados una cantidad pequeña pero eficaz, del ingrediente activo del compuesto que tiene la fórmula



en que X es un átomo de cloro o bromo, Y es un radical hidrógeno o acetilo, y cada uno de los grupos  $R^1$  y  $R^2$  es un radical alcohilo que tiene de 1 a 3 átomos de carbono, un radical hidroxialcohilo que tiene de 1 a 3 átomos de carbono, o un radical acetoxialcohilo que tiene de 3 a 5 átomos de carbono.

2º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-dimetil-2-hidroxietilmonocloroacetamida.

3º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-dimetil-2-hidroxietilmonobromoacetamida.

4º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(hidroximetil)-etil monocloroacetamida.

5º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente ac-

344577



tivo es N-1,1-bis(hidroxi metil)-etil monobromoacetamida.

5 6º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(hidroxi metil)propil monocloroacetamida.

7º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(hidroxi metil)-propil monobromoacetamida.

10 8º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(hidroxi metil)-2-hidroxi etilmonocloroacetamida.

15 9º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(hidroxi metil)-2-hidroxi etilmonobromoacetamida.

20 10º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(acetoxi metil)-etilmonocloroacetamida.

11º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(acetoxi metil)-etil monocloroacetamida.

25 12º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-bis(acetoxi metil)-2-acetoxi etilmonocloroacetamida.

30 13º.- Un método de combatir hongos y bacterias de acuerdo con la reivindicación 1, en que el ingrediente activo es N-1,1-dimetil-2-acetoxi etil monocloroacetamida.

344577

149.- Un método de combatir hongos y bacterias.

VI 5 00



Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

5 Esta Memoria consta de trece hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

5 OCT 1967

P.A.

Alberto de Echebur  
*[Handwritten signature]*

344577