



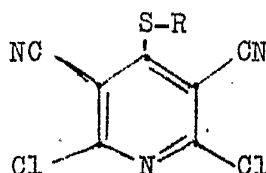
352396

P A T E N T E
D E
I N V E N C I Ó N

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE ANTIPARASITARIOS"
a favor de la firma alemana E. MERCK AKTIENGESELLSCHAFT, do-
miciliada en DARMSTADT (Alemania).

MEMORIA DESCRIPTIVA

Se ha hallado, que los compuestos de la fórmula I,



I

en la que

- R significa un radical alquílico rectilíneo o ramifica-
do con hasta 18 átomos de carbono, que puede estar
- 5.

POOR
QUALITY



5. substituído una o varias veces mediante fluor, cloro y/o R_1 ,
- o un radical bencílico o feniletílico, que puede estar substituído eventualmente en el núcleo una o varias veces mediante CN, OR_2 , NO_2 , halógeno, $COOR_2$ y/o R_2 ,
- o un radical ciclopentílico o ciclohexílico,
- R_1 significa CN, $COOR_2$ o radicales alcoxi o alquiltio inferiores con cada uno hasta 4 átomos de carbono y
10. R_2 significa radicales alquílicos inferiores con hasta 4 átomos de carbono,

15. son antiparasitarios valiosos. En especial la acción fungicida se demostró en ensayos con los mohos de prueba conocidos *Venturia inaequalis* y *Alternaria spec.* Además se comprobó que los nuevos compuestos de la fórmula I también se pueden utilizar ventajosamente en combinación con otros antiparasitarios, en especial con otros fungicidas.

20. El objeto de la invención son antiparasitarios, que poseen un contenido en por lo menos un compuesto de la fórmula I junto con vehículos y/o cuerpos de relleno usuales. Estos agentes pueden contener eventualmente todavía otras



materias activas, en especial otros fungicidas.

El objeto de la invención es además la utilización de los nuevos agentes como antiparasitarios.

- La actividad de los nuevos compuestos teniendo en cuenta su acción fungicida se averiguó por ejemplo en el ensayo de gérmenes de esporas. Se determinó el DL₅₀ es decir aquella dosis en materia activa (medida en mg/100 cm²), para impedir la formación de las esporas de moho en el 50%. Como substancias de comparación se utilizaron N-triclorometiltio-tetrahidroftalimida y dimetilditiocarbamato de zinc. Así
5. por ejemplo el 2,6-dicloro-4-metiltio-piridin-3,5-dicarbonitrilo muestra en estos ensayos unas 3 o bien 7 veces actividad fungicida más fuerte que en las substancias de comparación.
- 10.

- El radical R en los compuestos de la fórmula I puede ser por ejemplo un radical alquílico rectilíneo o ramificado con hasta 18 átomos de carbono. En particular se citan aquí por ejemplo los radicales siguientes: metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, butilo secundario y tercibutilo, isobutilo, amilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, así como los isómeros de estos compuestos y los
15. homólogos superiores con hasta 18 átomos de carbono.
- 20.



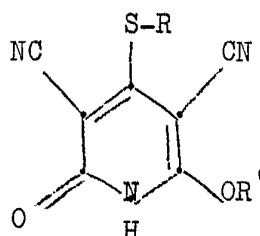
- Los radicales citados pueden estar substituídos una o varias veces mediante cloro, pero también mediante fluor. En primer lugar pueden entrar en consideración radicales alquílicos terminales substituídos mediante fluor o cloro (en especial mediante cloro), por ejemplo fluormetilo, 2-fluoretilo, 3-fluorpropilo, 4-fluorbutilo, 5-fluorpentilo, 6-fluorhexilo, clorometilo, 2-cloroetilo, 3-cloropropilo, 4-clorobutilo, 5-cloropentilo, 6-clorohexilo, 18-clorooctadecilo, 1-metil-2-cloroetilo. Como radicales, que están substituídos varias veces mediante halógeno, se citan por ejemplo: 2,2,2-trifluoretilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2,3-dicloropropilo, 3,4-diclorobutilo. En caso de que el radical R esté substituído mediante CN, pueden entrar en consideración en especial cianometilo, 2-cianoetilo y 3-cianopropilo. Radicales R típicos substituídos mediante COOR₂ son carbometoximetilo, carboetoximetilo y 2-carboetoxietilo. Como radicales alcoxi o alquiltio inferiores pueden entrar en consideración principalmente metoxi, etoxi, propoxi y butoxi o bien radicales metiltio y etiltio. En general están presentes solamente 1-2 de estos substituyentes.
5. Caso de que los radicales aralquílicos citados para R estén substituídos en el núcleo mediante grupos alquílicos inferiores, son de significación sobre todo los grupos metílico, etílico y propílico. Como radicales aralquílicos se citan por ejemplo: bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, 4-cianobencilo, 4-metoxibencilo, 4-nitrobencilo, 2,4-dinitrobencilo, 4-fluorbencilo, 2-clorobencilo, 3-clorobencilo y 4-clorobencilo
- 10.
- 15.
- 20.
- 25.



2-(4-clorofenil)-etilo, 2,4-diclorobencilo, 2,6-diclorobencilo, 4-bromobencilo, 4-carboetoxibencilo, 4-metilbencilo.

Los nuevos compuestos pueden prepararse por ejemplo, al tratar un derivado de piridona de la fórmula

5.



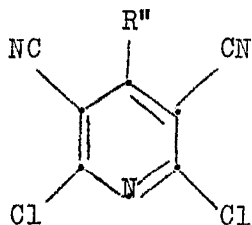
II

10. en la que

R tiene la significación indicada, y

R' significa hidrógeno o un equivalente de un catión alcalino, alcalinotérreo o de amonio, con un agente de cloración

15. o al hacer reaccionar en presencia de una base un compuesto de la fórmula III



III

20.



en la que

R" significa un grupo hidroxil esterificado apto para reacción, de preferencia un átomo de halógeno como cloro,

5. con un mercaptano de la fórmula R-SH,
o al substituir en el 2,6-dicloro-4-mercaptopiridin-3,5-dicarbonitrilo, el átomo de hidrógeno con ayuda de métodos de por sí conocidos por el substituyente R para la formación de tioéteres,
10. y/o al transformar en caso deseado en un compuesto de la fórmula I los substituyentes R, en forma de por sí conocida en otros substituyentes R.

- La cloración de un compuesto de la fórmula II se efectúe en forma de por sí conocida mediante acción de agentes de cloración como por ejemplo PCl_5 , PCl_3 , POCl_3 o SOCl_2 o bien mezclas de estas sustancias. Como disolventes pueden utilizarse todos los disolventes orgánicos inertes bajo estas condiciones, por ejemplo benceno; tolueno, xileno, piridina, dimetilformamida o dimetilnilina o mezclas de estos disolventes. Varias veces también se ha mostrado como ventajoso utilizar el propio agente de cloración como disolvente. Así por ejemplo se alcanzan buenos rendimientos bajo
- 15.
 - 20.



acción de PCl_5 en POCl_3 hirviente. Las temperaturas reaccionales en estas cloraciones se hallan en general entre 50 y 160° , los tiempos de reacción de aproximadamente 30 minutos a 6 horas. La elaboración se efectúa en forma de por sí conocida, por ejemplo mediante descomposición de la mezcla reaccional con agua helada o alcoholes, por ejemplo metanol o etanol, con lo cual ya precipitan en general los compuestos deseados de la fórmula I.

10. Las piridonas de la fórmula II a utilizar como material de partida pueden prepararse mediante reacción de éster metílico del ácido 3,3-bis-(alquiltio)-2-cian-acrílico con cianoacetamida y a continuación ciclización del dinitrilo del ácido 2-carbometoxi-3-alquiltio-4-carbamoil-glutacónico con ello obtenido, con amoníaco metanólico (véase método J. Pharm. Soc. Japan. Tomo 85, página 387 (1965)).

20. En la transformación de los compuestos de la fórmula III en las substancias de la fórmula I pueden usarse todos los métodos que hallan utilización usualmente en la reacción de compuestos de halógeno con mercaptanos. Como material de partida se utiliza aquí de preferencia el compuesto de cloro (III, $\text{R}'' = \text{Cl}$), ya que éste es en especial preparable en forma sencilla por ejemplo mediante acción de cloruro sulfúrico sobre 4-alquiltio-2,6-dicloropiridin-3,5-carbonitrilo. La reacción con los mercaptanos R-SH se efectúa en



medio básico, de preferencia en presencia de bases fuertes, como NaOH, KOH, Ba(OH)₂, Ca(OH)₂, bases amónicas como hidróxido trimetilbencilamónico o aminas terciarias como trietilamina. Como disolventes pueden utilizarse por ejemplo

5. éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano, benceno, tolueno, xileno o éter de petróleo. Los tiempos reaccionales se encuentran entre aproximadamente 30 minutos y 12 horas, la temperatura entre -20° y +30°.

10. El 2,6-dicloro-4-mercaptopiridin-3,5-dicarbonitrilo pueden transformarse en forma análoga mediante reacción con compuestos de la fórmula R - R'', de preferencia con RCl, RBr o RJ, en los tioéteres de la fórmula I.

15. Fundamentalmente, para las reacciones últimamente citadas pueden utilizarse los métodos descritos en Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart (1955), tomo 9, página 103 y siguientes.

20. Además, los compuestos de la fórmula I mediante alteración de los sustituyentes R en la posición 4 pueden transformarse en otros compuestos de la fórmula I. Así por ejemplo, pueden introducirse por ejemplo mediante halogenación en forma usual, un sustituyente halógeno en el núcleo de un radical bencilico o feniletílico.



- En caso de que los nuevos compuestos de la fórmula I se utilicen combinados con otros fungicidas, pueden entrar en consideración en especial los siguientes (solo o en mezcla): fungicidas conteniendo cobre (por ejemplo óxido de cobre (I),
5. oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, cromato de cobre y zinc carbonato de cobre básico, mezcla de sulfato de cobre, sal y agua, nafteno de cobre, sal de cobre de la 8-hidroxiquinolina), fungicidas conteniendo azufre (por ejemplo azufre humectante, polisulfuros, soluciones de polisulfuros de calcio y tiosulfato cálcico)),
 10. fungicidas conteniendo mercurio (por ejemplo cloruro mercúrico, acetato fenilmercúrico, benzoato fenilmercúrico y cloruro fenilmercúrico, acetato etilmercúrico y cloruro etilmercúrico, cloruro 2-metoxietilmercúrico, silicato 2-metoxietilmercúrico o fosfato 2-metoxietilmercúrico, acetato 3-
 15. -clorometoxipropilmercúrico, 2,3-dihidroxiopropilmercaptida etilmercúrica, anilida N-(etilmercúrica) de ácido p-toluensulfónico, 1,4,5,6,7,7-hexaclorobiciclo-[2,2,1]-5-hepten-2,3-dicarboximida N-(etilmercúrica), 1,4,5,6,7,7-hexaclorobiciclo-[2,2,1]-5-hepten-2,3-dicarboximida N-(etilmercúrica) y 1,4,5,6,7,7-hexaclorobiciclo-[2,2,1]-5-hepten-2,3-dicarboximida N-(fenilmercúrica), sal sódica del ácido S-(etilmercuro)-tiosalicílico, 8-hidroxiquinolato metilmercúrico, ciandiamida metilmercúrica, urea fenilmercúrica, lactato de trietanolamoniufenilmercúrico,
 20. acetato de monoetanolamoniufenilmercúrico), fungicidas conteniendo estaño (hidróxido o acetato trifenilestánnico);
 - 25.



- además fungicidas orgánicos, como tiocarbamatos (sales sódica, potásica, amónica, de zinc, de hierro y de manganeso de ácidos monometilditiocarbámico, dimetilditio carbámico, y etilen-bis-ditiocarbámico), tiurames (disulfuro de tetrametiltiuram, disulfuro de polietilentiuram); 2-mercaptobenzotiazol y sus sales; pentaclorofenol; cloronitrobencenos (por ejemplo pentacloronitrobenceno, 2,3,5,6-tetracloronitrobenceno, triclorodinitrobenceno y triclorotrinitrobenceno); tricloronitrometano; 2-butil secundario-4,6-dinitrofenil-3'-metil-2'-butenoato, 1-tiocian-2,4-dinitrobenceno; hexaclorobenceno; 7-metil-1,3-ditiole[4,5-b]-quinoxalinon-(2); N,N-dimetil-N'-fenil-N'-diclorofluormetiltio)-sulfamida; derivados de quinona (por ejemplo tetracloro-p-benzoquinona, 2,3-dicloro-1,4-naftoquinona, 1,4-ditianantraquinon-2,3-dicarbonitrilo); N-triclorometiltiotetrahidroftalimida; N-triclorometiltioftalimida; N-(1,1,2,2-tetracloroetiltio)-tetrahidroftalimida; crotonato 2,4-dinitro-6-(alfa-metilheptil)-fenílico; N-dodecilguanidinacetato; 3,5-dimetiltetrahidro-1,3,5-tiadiazin-2-tiona; 2,4-dicloro-6-(2-cloroanilino)-1,3,5-triazina; 5-amino-1-[bis-(dimetilamino)-fosfinil]-3-fenil-1,2,4-triazol; además antibióticos (tetraciclina, clorotetraciclina, hidroxitetraciclina, estreptomina, cicloheximida).

Los compuestos de la fórmula I se dejan elaborar para todas las formas de aplicación usuales para antiparasitarios.



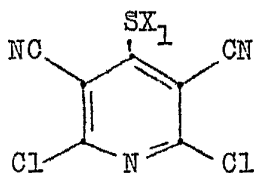
- Bajo adición de vehículos y/o materias de relleno usuales pueden prepararse por ejemplo agentes de rociado o de espolvoreo, además asimismo desinfectantes cáusticos para la conservación de simientes, y que pueden contener eventualmente otros aditivos como agentes de dispersión o humectantes.
5. También la elaboración para formar soluciones o emulsiones, que por ejemplo también pueden rociarse como aerosoles, da buen resultado bajo utilización de los aditivos correspondientes. Todas las formas de utilización contienen en general de 1 al 95% de materia activa. En los preparados de combinación, la parte de los compuestos de la fórmula I en la parte total de materia activa alcanza normalmente entre 5 y 95%.
- 10.

- Los nuevos compuestos se utilizan en la lucha contra los parásitos. Son en especial ventajosos para utilizar como fungicidas, en donde pueden hallar utilización no solo en el campo sino también como desinfectante caustico en simientes. Sin embargo también pueden utilizarse los compuestos como antielmínticos, agentes antipolilla, nematocidas, herbicidas y microbicidas, en especial bactericidas, por lo cual pueden utilizarse asimismo en cada caso de preferencia en combinación con otras materias activas. En especial los nuevos compuestos de la fórmula I se han acreditado para la lucha contra bacterias fitopatógenas, por ejemplo de *Xanthomonas oryzae* y *Xanthomonas citri*, que atacan frecuentemente como ya se sabe por ejemplo los cultivos de arroz y los cultivos cítricos.
- 15.
- 20.
- 25.



Productos del procedimiento ventajosos son los de la fórmula Ia, Ib y Ic:

5.



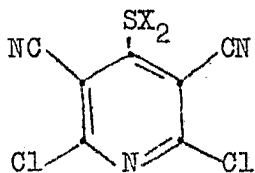
Ia

en la que

10.

X_1 significa alquilo con 1 a 18 átomos de carbono o bencilo o feniletilo eventualmente substituído una vez en el núcleo mediante CH_3 , CH_2O , F, Cl, Br, CN o NO_2 ;

15.

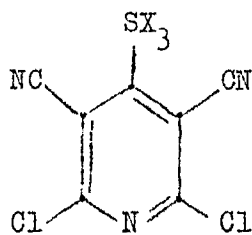


Ib

en la que

20.

X_2 significa alquilo primario o secundario con 1 a 12 átomos de carbono, bencilo o feniletilo;



Ic

5. en la que

X₃ significa alquilo primario o secundario con 1 a 4 átomos de carbonc.

Ejemplos de formulación:

Ejemplo 1

10.

Polvo de rociado

- 50 % de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
- 0,5 % de dialquilnaftalinsulfonato sódico
- 12 % de polvo de lejía sulfítica
- 37,5 % de caolín

15.

Ejemplo 2

Polvo de rociado

- 80 % de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
- 8 % de N-metiltaururo de ácido oleico
- 12 % de bentonita.



Ejemplo 3

Polvo de rociado

- 30 % de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
50 % de N-triclorometiltio-tetrahidroftalimida
5. 1 % de alquilbencensulfonato sódico
3 % de polvo de lejía sulfítica
16 % de cretasilíceas (mezcla natural de cuarzo fino y cao-
lín).

Ejemplo 4

10.

Dispersión

- 20 % de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
20% de 1,4-ditianantraquinon-2,3-dicarbonitrilo
1 % de carboximetilcelulosa
2 % de éter alquilfenolpoliglicólico
15. 1 % de bentonita
56 % de agua

EJEMPLO 5

Dispersión

- 20% de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
20% de 2,6-dicloro-4-fenilpiridin-3,5-dicarbonitrilo
20. 1 % de carboxi metilcelulosa



= 15 =

2% de éter alquifenoipoliglicólico

1% de bentonita

56% de agua

Ejemplo 6

5. Agente de espolvoreo

10% de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo

25% de azufre molido

65% de talco

Ejemplo 7

10. Análogamente al ejemplo 1 se formula polvo de rociado al 50%, que contiene como componente activo uno o más de los compuestos siguientes, aislados o bien en mezcla:

el 2,6-dicloro-4-etiltio-piridin-3,5-dicarbonitrilo

el 2,6-dicloro-4-(n o iso)-propiltio-piridin-3,5-dicarbonitrilo

el 2,6-dicloro-4-(n o iso)-butiltio-piridin-3,5-dicarbonitrilo

15.

el 2,6-dicloro-4-(n o iso)-amiltio-piridin-3,5-dicarbonitrilo

el 2,6-dicloro-4-benciltio-piridin-3,5-dicarbonitrilo

el 2,6-dicloro-4-(2-feniletiltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo

Ejemplo 8

Análogamente al ejemplo 3 se formula un polvo de rociado al 80%, que contiene junto a 50% de N-triclorometiltio-tetrahidro-



ftalimida, 30% de las substancias siguientes (solos o en mezcla):

- el 2,6-dicloro-4-(4-nitrobenciltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo
- el 2,6-dicloro-4-(4-fluorbenciltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo
- el 2,6-dicloro-4-(2-clorobenciltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo
- 5. el 2,6-dicloro-4-(3-clorobenciltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo
- el 2,6-dicloro-4-(4-clorobenciltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo
- el 2,6-dicloro-4-(2,6-diclorobenciltio)-piridin-3,5-dicarbonitrilo.

EJEMPLO 9.

- 10. Análogamente al ejemplo 4 se prepara concentrados de dispersión que contienen junto al 20% de 1,4-ditioantraquinon-2,3-dicarbonitrilo, 20% de las substancias siguientes (solos o eventualmente en mezcla con otros compuestos de la fórmula I):

- el 2,6-dicloro-4-n-hexiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
- 15. el 2,6-dicloro-4-n-octadeciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
- el 2,6-dicloro-4-ciclopentiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo
- el 2,6-dicloro-4-ciclohexiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo.

Ejemplos de preparación:

Ejemplo A

- 20. 230 gramos de la sal sódica de 4-metiltio-6-hidroxi-2-piridon-3,5-dicarbonitrilo [punto de descomposición por encima de 300°C; se obtiene mediante reacción de 1-cian-1-carboetoxi-2,2-bis(metiltio)-etileno con cianoacetamida y ciclización subsi-



guiente del dinitrilo del ácido 2-carboetoxi-3-metiltio-4-carbamoil-glutacónico obtenido, no aislado] se disuelven en 5 litros de POCl_3 . Tras adición de 2080 gramos de PCl_5 se calienta a reflujo durante 2 horas, luego se destila el POCl_3 .

5. El residuo se deslía cuidadosamente con agua helada, con lo cual precipita el 2,6-dicloro-4-metiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo. Rendimiento 239 gramos; punto de fusión 153° (isopropanol).

Ejemplo B

10.

114 gramos de la sal potásica del 4-etiltio-6-hidroxi-2-piridon-3,5-dicarbonitrilo bruta [obtenida mediante reacción de 1-cian-1-carboetoxi-2,2-bis(etiltio)-etileno con cianoacetamida y ciclización subsiguiente] se disuelven en caliente en 500 cc de POCl_3 . En esta solución se adiciona a gotas a 80° ,

15. 100 cc de dimetilformamida y la mezcla se deja durante una hora a esta temperatura. Luego el POCl_3 en exceso se destila bajo presión reducida, hasta que queda una papilla de cristales. Esta se vierte sobre hielo, con lo cual precipita el 2,6-dicloro-4-etiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo. Rendimiento 95 gramos, punto de fusión 114° (isopropanol).
- 20.

Análogamente se obtienen:

el 2,6-dicloro-4-etiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 114° ;

el 2,6-dicloro-4-n-propiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 107° ;



- el 2,6-dicloro-4-isopropiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 139°;
- el 2,6-dicloro-4-n-butiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 73°;
5. el 2,6-dicloro-4-isobutiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo; punto de fusión 90°;
- el 2,6-dicloro-4-n-amiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 40°;
- el 2,6-dicloro-4-isoamiltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 39°;
10. el 2,6-dicloro-4n-dodeciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, aceite no destilable;
- el 2,6-dicloro-4-benciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 111°;
15. el 2,6-dicloro-4-o-clorobenciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, de punto de fusión 136°;
- el 2,6-dicloro-4-p-clorobenciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 106°;
20. el 2,6-dicloro-4-p-fluorbenciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 100°;
- el 2,6-dicloro-4-p-metilbenciltiopiridin-3,5-dicarbonitrilo, punto de fusión 122°.



Ejemplo C

- 23 gramos de 2,4,6-tricloropiridindicarbonitrilo-(3,5) en 100 cc de éter dietílico se trata a 0º en presencia de 10 gramos de trietilamina y en forma de gotas con 6 gramos de etilmercaptano en 10 cc de éter dietílico. Tras una hora de reposo se filtra del sedimento y la solución se concentra. El residuo se cromatografía en gel silíceo (disolvente cloruro metilénico). Se obtiene junto con material de partida no reaccionado y con 2,4,6-trietiltiopiridindicarbonitrilo-(2,3) originado como producto intermedio, unos 8 gramos de 2,6-dicloro-4-etiltiopiridina-(3,5), punto de fusión 113º.

10.

ejemplo D

- 24,5 gramos de 2,6-dicloro-4-metiltiopiridindicarbonitrilo-(3,5) y 100 cc de cloruro sulfúrico se hierven a reflujo durante 10 horas bajo irradiación con una lámpara ultravioleta. Luego el cloruro sulfúrico en exceso se decanta bajo presión reducida, el residuo se trata con agua, a continuación se fija en cloruro metilénico y se cromatografía en gel silíceo. Se obtiene junto con 2,4,6-tricloropiridindicarbonitrilo-(3,5) y otros subproductos, 5,5 gramos de 2,6-dicloro-4-clorometiltiopiridindicarbonitrilo-(3,5).

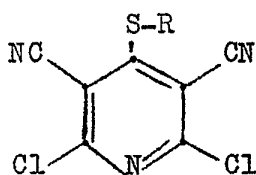
15.



N O T A

Descrito el objeto de la invención, se declara nuevas las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la solicitud de patente alemana M 73 474 IVd/12p del 5 de abril de 1967.

5. 1. Procedimiento para la preparación de antiparasitarios, que corresponden a compuestos de la fórmula I



I

10. en la que

R significa un radical alquílico rectilíneo o ramificado con hasta 18 átomos de carbono, que puede estar sustituido en cada caso una o varias veces por fluor, cloro y/o R_1 ,

15. o un radical bencílico o feniletílico, que puede estar sustituido eventualmente en el núcleo una o varias veces mediante CN , OR_2 , NO_2 , halógeno, $COOR_2$ y/o R_2 ,



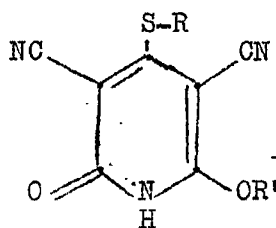
o un radical ciclopentílico o ciclohexílico,

R_1 significa CN, COOR₂ o radicales alcoxi o alquiltio inferiores con en cada caso hasta 4 átomos de carbono y

5. R_2 significa radicales alquílicos inferiores con hasta 4 átomos de carbono,

caracterizado porque un derivado de piridona de la fórmula II

10.



II

en la que

15. R tiene el significado indicado y

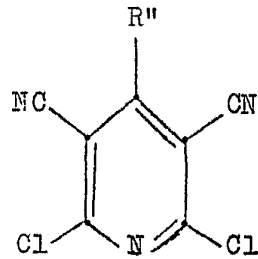
R' significa hidrógeno o un equivalente de un catión alcalino, alcalinotérreo o amónico,

se trata con un agente de cloración,



o porque un compuesto de la fórmula III

5.



III

10.

en la que

15.

R'' significa un grupo hidroxí esterificado apto para reacción, de preferencia un átomo de halógeno como cloro, se hace reaccionar en forma de por sí conocida y en presencia de una base con un mercaptano de la fórmula R-SH

20.

o porque en el 2,6-dicloro-4-mercaptopiridin-3,5-dicarbonitrilo se substituye el átomo de hidrógeno con ayuda de métodos de por sí conocidos por el radical R para formación de tioéteres.

y/o porque en caso descado, en un compuesto de la fórmula I se cambia el substituyente R, en forma de por sí conocida por otro substituyente R.



2. Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque materias activas de la fórmula I se reunen con vehículos y aditivos utilizados en antiparasitarios, en una proporción tal que el producto acabado contiene aproximadamente 5-95 por ciento en peso en compuestos de la fórmula I anterior.

3. Procedimiento para la preparación de antiparasitarios.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 23 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 4 de Abril de 1968

p,a,

JAIME ISERS

Firmado: JOSÉ RODRÍGUEZ