

358807



1400

SECCION TECNICA
REGISTRACION I. P. C.
Clase A 01
Vol. N°

MEMORIA DESCRIPTIVA

PATENTE DE INVENCION

DURACION : 20 AÑOS

OBJETO : "UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COM-  
PUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FE-  
NIL SULFONAMIDAS".

A favor de : SCHAUMBER CHEMICAL COMPANY

Domicilio : 299, Park Avenue - NEW YORK (U.S.A.)

Nacionalidad: NORTEAMERICANA

Inventores : D. PETER FRANCIS EPSTEIN Y D. WILLIS CLARK  
MC GUIRE

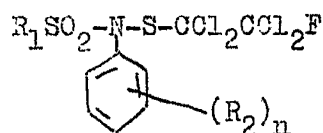
==...==

**POOR  
QUALITY**



La presente invención, tal como su enunciado indica, se refiere a un método para control de plagas mediante compuestos de (tetracloro-fluoro-etil-tio)N-fenil sulfonamidas, de acuerdo con la descripción que del mismo se realice, que ha de entenderse en su más amplio sentido y no restrictivamente.

Compuestos de la fórmula

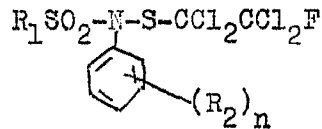


en que  $R_1$  es un grupo de alquilo inferior, haloalquilo inferior o alqueno inferior,  $R_2$  es un grupo de hidrógeno, halógeno, alcóxido inferior, alquilo inferior, ciano o nitrato, y  $n$  es un (número) entero entre 1 y 5, siendo  $R_2$  el mismo o diferente cuando  $n$  es mayor que 1; y su uso en controlar plagas, por ejemplo, ácaros, hongos, helmintos y protozoos que causan la coccidiosis.

Esta invención se relaciona con ciertas nuevas y originales sulfonamidas N-fenil (tetracloro-fluoro-etil-tio) de alquilo inferior y su uso para controlar plagas. Los compuestos son particularmente valiosos por sus propiedades pesticidas en el control de tales plagas como ácaros, hongos, y especialmente helmintos tales como lombrices y aquellos protozoos que causan la coccidiosis.



Más específicamente, esta invención se relaciona con compuestos de la fórmula



en la que  $R_1$  se selecciona del grupo que consiste en alquilo inferior, haloalquilo inferior y alqueno inferior, y  $R_2$  se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alcoxilo inferior, alquilo inferior, ciano y nitro, y  $n$  es un entero entre 1 y 5 preferentemente entre 1 y 3, los grupos  $R_2$  siendo los mismos o diferentes cuando  $n$  está entre 2 y 5. Por los términos alquilo inferior, haloalquilo inferior, alcóxido inferior, entendemos aquellos miembros de dichos grupos que contienen de 1 a 5 átomos de carbono, inclusive. Similarmente, por el término alqueno inferior entendemos miembros de dicho grupo que contienen de 2 a 5 átomos de carbono, inclusive.

Un compuesto preferido de los compuestos de la fórmula anterior es uno en que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es hidrógeno y  $n$  es 1.

Los compuestos que se contemplan en el presente pueden prepararse por varios métodos. Un método general que puede aplicarse al preparar los compuestos es la reacción de condensación entre la N-fenil sulfonamida apropiada



da sustituida y cloruro de sulfenil 2-fluoro-1,1,2,2-tetracloroetilo. Un aceptor ácido, tal como piridina, trietilamina y similares se usa para facilitar la reacción. Puede emplearse cualquier aceptor de cloruro de hidrógeno que preferentemente no reaccione con los reactivos en las condiciones de la reacción. Esta reacción se desarrolla fácilmente en la fase líquida. Es también útil el empleo de un disolvente orgánico inerte que facilite el proceso así como también la agitación de los reactivos. Se emplean temperaturas que permitan la operación en la fase líquida y que estén entre alrededor de 0° C y la temperatura de reflujo del disolvente, si se emplease alguno. La reacción progresará convenientemente a bajas temperaturas, usualmente alrededor de 10° C o menos.

Se ha considerado que los compuestos de la presente invención son eficaces como agentes pesticidas. Son particularmente eficaces en el control de acáridos, hongos, protozoos que causan la coccidiosis y especialmente infecciones de helmintos. Por lo tanto, la presente invención contempla la aplicación de los compuestos descritos en el presente en el control de pestes.

Los compuestos de la presente invención pueden prepararse de acuerdo con el ejemplo siguiente.



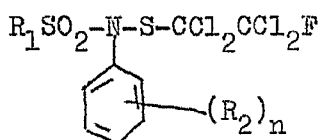
E J E M P L O

Preparación de N-(2-fluoro-1,1,2,2-tetracloroetil)-N-fenil-metano-sulfonamida. A una mezcla de N-fenil metano sulfonamida (18,5 partes), trietilamina (10,1, partes) y cloroformo (200 partes) se añadió con 75  
agitación por bajo de 10° C cloruro de 2-fluoro-1,1,2, 2-tetracloroetil-1-sulfenil (23,5 partes), disuelto en cloroformo (50 partes). Después de lavar la solución re-  
sultante con tres porciones de agua y de eliminar el di-  
80 solvente, se obtuvo como producto 28,9 partes (76%) de -  
un sólido amarillo. Después de la recristalización a par-  
tir de etanol o heptano se obtuvo un compuesto de título  
como un sólido blanco, m.p,98-99,5° C. Análisis; por -  
ciento calculado para  $C_{10}H_{10}Cl_4FNO_2S_2$ : C,29,94; H, 2,51;  
85 Cl,35,35; N,3,49; S, 15,99. Hallado: C,30,24; H,2,73; Cl,  
35,27; N,3,35; S, 15,91.

La siguiente es una tabla de los compuestos pre-  
parados según los procedimientos anteriormente descritos.  
Se han asignado números de compuesto a cada compuesto y -  
90 se usan después para la identificación de todo el balance  
de la solicitud.



T A B L A I



Compuesto número	<u>R<sub>1</sub></u>	<u>R<sub>2</sub></u>	<u>n</u>	<u>m.p. °C.</u>
1*	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	1	98-99.5
2	CH <sub>3</sub>	4-Cl	1	92-93.5
3	CH <sub>3</sub>	H	1	65-67
4	ClCH <sub>2</sub>	H	1	66-68
5	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	1	84-84.5
6	ClCH <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub>	1	67-68.5
7	CH <sub>2</sub> =CH	H	1	79-80
8	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CN	1	81.5-82.5
9	ClCH <sub>2</sub>	4-Cl	1	76-78
10	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	1	71-73
11	ClCH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub>	1	(n <sub>D</sub> <sup>30</sup> =1.5630)
12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl	1	93.5-94.5
13	CH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub>	1	107-108.5
14	CH <sub>3</sub>	2-Cl	1	94.5-96.5
15	CH <sub>3</sub>	3-Cl	1	79-80
16	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> O	1	105-106
17	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> O	1	124-124.5
18	CH <sub>3</sub>	4-F	1	63-65
19	CH <sub>3</sub>	4-Br	1	103-104
20	1-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	1	72.5-73.5
21	1-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl	1	63-64



<u>Compuesto número</u>	<u>R<sub>1</sub></u>	<u>R<sub>2</sub></u>	<u>n</u>	<u>m. p. °C.</u>
22	CH <sub>2</sub> =CH <sub>2</sub>	4-Cl	1	71-76
23	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	2	66-70
24	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2CH <sub>3</sub> ,5-Cl	2	(n <sub>D</sub> <sup>30</sup> =1.5535)
25	CH <sub>2</sub> =CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub> ,5-Cl	2	80.5-82
26	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-CH <sub>3</sub> 5-Cl	2	79.81
27	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	2	77-78
28	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> , 5-Cl	2	87-88
29	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl	2	88-90
30	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> , 3-Cl	2	83.5-84
31	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> , 2-Cl	2	73-74
32	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> 4-Cl	2	54-56
33	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub> , 2-Cl	2	86-87.5
34	CH <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub>	2	97-98.5
35	CH <sub>3</sub>	2,5-Cl <sub>2</sub>	2	116-117.5
36	CH <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	2	99.5-100.5
37	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	2	66.5-68
38	CH <sub>3</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	2	102.5-103.5
39	CH <sub>3</sub>	4,Cl, 2-NO <sub>2</sub>	2	93.5-94.5
40	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> , 4-NO <sub>2</sub>	2	80-83
41	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> ,5-NO <sub>2</sub>	2	101-102.5
42	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> , 4-NO <sub>2</sub>	2	159-160
43	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> ,5-NO <sub>2</sub>	2	131.5-133
44	CH <sub>3</sub>	4OCH <sub>3</sub> ,2-NO <sub>2</sub>	2	98-99
45	CH <sub>3</sub>	2,5(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	69-70.5
46	CH <sub>3</sub>	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	77.5-79



<u>Compuesto número</u>	<u>R<sub>1</sub></u>	<u>R<sub>2</sub></u>	<u>n</u>	<u>m.p. °C.</u>
47	CH <sub>3</sub>	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	108-109
48	CH <sub>3</sub>	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	99.5-100.5
49	CH <sub>3</sub>	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	116.5-117.5
50	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> , 5Cl	2	144-145
51	CH <sub>3</sub>	4OCH <sub>3</sub> , 3Cl	2	91-92
52	CH <sub>3</sub>	2OCH <sub>3</sub> , 5-CH <sub>3</sub>	2	137-138.5
53	CH <sub>3</sub>	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4Cl	3	119-120
54	CH <sub>3</sub>	2,4(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 5Cl	3	128-129
55	CH <sub>3</sub>	2,4,6-Cl <sub>3</sub>	3	123-124

\* Compuesto número 1 preparado en el ejemplo

95 Como se ha mencionado anteriormente las composiciones originales descritas en el presente son útiles y valiosas en el control de varias pestes. Los compuestos de esta invención fueron comprobados contra varias pestes de la siguiente forma.

100 Control animal sistemático de la Hymenelopsis nana. La infección conocida como helmintiasis implica la infestación del cuerpo animal y particularmente el tracto gastro-intestinal con varias especies de gusanos parásitos. Es una enfermedad muy extendida y grave y los métodos disponibles para su tratamiento y prevención no son siempre satisfactorios. La presente invención contempla un método quimioterápico perfeccionado para combatir las infecciones helmínticas.



105 La evaluación de la eficacia oral y seguridad de  
compuestos de ensayo administrados continuamente se rea-  
lizó en ratones empleando la Hymenelopsis nana (H. nana, Hn)  
(lombriz enana) como infección de helmintos. Se utilizaron  
110 ratones jóvenes de laboratorio Swis albino como los hués-  
pedes. Antes de la iniciación del ensayo se pesaron en -  
cantidades adecuadas los compuestos candidatos, se mezcla-  
ron en maguacel o alimento pulverulento manualmente con un  
mortero y una mano de almirez. Antes de ser añadidos a -  
115 las cantidades previamente pesadas de alimento necesario-  
para proporcionar una concentración alimentaria deseada, el  
compuesto pre-mezclado fue mezclado nuevamente en una pe-  
queña cantidad de alimento. Cada muestra de alimento y el  
compuesto del experimento se mezclaron durante 15-20 minu-  
120 tos en un mezclador de casco u otro equipo mezclador simi-  
lar.

En el día de la iniciación del experimento los  
ratones anteriormente descritos se pesaron individualmen-  
te y se distribuyeron en grupos de dos o más ratones por  
grupo. La distribución se hizo por selección aleatoria de  
125 animales precedentes de cada clasificación de peso de for-  
ma que el peso total y las variaciones de peso fueron apro-  
ximadamente iguales para cada grupo. Los grupos fueron alo-  
jados en jaulas de tela metálica de 4" x 9" o mayores. Re-



130 cibieron alimento ad libitum y lo mismo agua para beber,  
durante el curso del período de evaluación de 21-28 días.  
Todos los grupos (medicados y no medicados) recibieron -  
previamente cantidades pesadas de alimento en el primer-  
día del experimento. Como la observación de parásitos -  
135 helmintos en los animales sometidos a necropsia se faci-  
lita por la ausencia de alimento en el intestino delgado,  
se impuso un período de privación de 2-6 horas justamente  
antes de sacrificar a los supervivientes.

Al segundo o al tercer día de la medicación se  
indujo la infección de helmintos. Se usaron huevos de H.  
140 nana recogidos de los excrementos de ratones huéspedes pre-  
viamente infectados y no medicados. Cada ratón del expe-  
rimento que había de recibir la infección fué dosificado-  
con 0,1 a 0,5 ml. de una solución celulosa de carboximetil  
al 0,05% que contenía 100-300 huevos por dosis de ratón.

145 Todos los ratones encontrados muertos suficien-  
tamente intactos durante el período del experimento fueron  
sometidos a necropsia tan pronto como fué posible y se con-  
taron las larvas o parásitos maduros. Entre el 21 día y el  
28 fueron sacrificados todos los ratones supervivientes y  
150 se examinaron microscópicamente sus intestinos y ciegos con  
respecto a los parásitos. El número de parásitos encontra-  
dos se registró por comparación con los grupos no medicados



4 OCT

comparablemente expuestos para conseguir la evaluación de la eficacia.

155

La tabla siguiente presenta un resumen de la actividad de los compuestos de la invención del caso - contra H. nana en ratones. Los valores se dan como - tanto por ciento de control del helminto del experimento a niveles dictarios en partes por millón (p.p.m.)

160

T A B L A    I I

<u>Compuesto número</u>	<u>Porcentaje de control de <u>H. nana</u> a niveles dictarios en p.p.m.</u>		
	<u>2000</u>	<u>1000</u>	<u>500</u>
1	-	100	100
2	-	100	70
3	-	82	100
4	-	99	70
5	-	100	100
6	-	100	75
7	-	100	98
8	-	100	100
9	-	96	-
10	-	82	55
12	-	100	61
13	-	100	69
14	-	100	98
15	-	100	100
16	-	100	100



<u>Compuesto número</u>	<u>Porcentaje de control de H. nana a niveles dictarios en p.p.m.</u>		
	<u>2000</u>	<u>1000</u>	<u>500</u>
17	-	100	100
18	-	100	32
19	-	100	25
21	80	-	75
22	-	86	75
23	-	93	90
24	99	85	-
26	90	99	95
27	-	75	-
28	-	99	99
29	99	-	-
30	95	-	-
31	99	-	-
32	-	99	-
33	99	-	-
34	99	70	-
35	99	-	-
36	99	-	-
37	99	-	-
39	99	-	-
41	99	-	-
42	99	-	-
43	99	-	-
44	99	-	-



<u>Compuesto número</u>	<u>Porcentaje de control de H. nana a niveles dictarios en p.p.m.</u>		
	<u>2000</u>	<u>1000</u>	<u>500</u>
46	99	-	-
47	99	-	-
48	99	-	-
49	-	75	-
50	-	40	-
51	99	-	-
53	99	-	-
54	95	-	-

- = No comprobado a este nivel

En la evaluación posterior se encontró que el compuesto número 18 era 90 por ciento eficaz en el control de H. nana a 200 ppm. De forma similar el compuesto número 4 presentó el 60 por ciento de control, el número 7, el 50 por ciento de control y el número 3, 40 por ciento de control del helmineto del experimento a 200 ppm.

Experimento de evaluación acaricida. El acárido Tetranychus telarius (Linn) fué empleado en los experimentos de acaricidas. Se usaron como plantas huéspedes plantas jóvenes de judías pintas en la fase de hojas primarias. Estas plantas fueron infestadas con varios cientos de acáridos. Se prepararon dispersiones de materiales candidatos disolviendo 0,1 gramo en 10 ml. de un disolvente conveniente, usualmente acetona. Partes alícuotas de las soluciones



4

tóxicas fueron suspendidas en agua que contenía 0,0175%  
v/v de Sponto 221<sup>R</sup>, un agente emulsificador, siendo la  
cantidad de agua suficiente para dar concentraciones de  
ingredientes activo que variaban de 0, 25% a 0,001%. Las  
180 suspensiones del experimento se pulverizaron después so-  
bre las plantas de alubias pintas infestadas. Después de  
siete días, se determinaron las mortalidades de las for-  
mas post embrionarias y ovicidas. El porcentaje de mortan-  
dad se determinó por comparación con plantas de control -  
185 que no habían sido pulverizadas con los compuestos candi-  
datos. El valor LD-50 se calculó usando procedimientos -  
bien conocidos. Estos valores se informan bajo la columna  
"PE" y "Huevos", en la tabla III.

Experimento in Vitro en ampollas. Como se ha men-  
190 cionado anteriormente las composiciones descritas en el -  
presente son compuestos activos microbiológicamente que -  
son útiles y valiosos en el control de varias bacterias y  
hongos. Los compuestos se experimentaron para determinar-  
la eficacia microbiostática estando en contacto con hongos  
195 o bacterias cultivados en un medio artificial. Los viales  
de 1 onza, fueron llenados parcialmente con caldo de malta.  
El compuesto que había de ser ensayado se colocó en los -  
viales a cualquier concentración deseada (expresada en -  
partes per millon) y se mezcló con el caldo. Los viales -  
200 fueron inoculados con suspensiones de agua de esporas de-

POOR  
QUALITY



205 Aspergillus niger y Penicillium sp. Después se cerraron los frascos y se retuvieron durante una semana, después de lo cual se observó y se anotó el crecimiento de los organismos. El ensayo se repitió usando concentraciones inferiores de compuestos que se estaban experimentando para determinar las concentraciones mínimas que podía usarse y ofrecer todavía algún control del crecimiento de los organismos. La Tabla III muestra los resultados de los experimentos in Vitro

210

T A B L A III

<u>Compuesto número</u>	<u>Actividad Acaricida</u> (% concentración)		<u>Experimento In Vitro</u> (p.p.m.)	
	<u>PE</u>	<u>Huevos</u>	<u>Asperigillus niger</u>	<u>Penicillum Sp</u>
1	.008	.008	5 *	5 *
2	.003	.005	5 *	5 *
3	.003	.01	5 *	5 *
4	.003	.01	5 *	5 *
5	.007		.5	
6	.007	.03	.05	.25
7	.008			
8	.03	.05	.5	1
9	.01	.05	.5	5
10	.01	.03	.5	1
11	.008	.03	.25	1
12	.008	.05	.5	1
13			.25	5
14	.01	.03	.5	1



40

<u>Compuesto número</u>	<u>Actividad Acaricida</u> (% Concentración)		<u>Experimento In Vitro</u> (p.p.m.)	
	<u>PE</u>	<u>Huevos</u>	<u>Asperigillus niger</u>	<u>Penicillium Sp.</u>
15	.03	.03	.25	5
18	.005	.03	.25	1
19	.001	.03	.25	1
20	.003	>.05	0.5	0.5
21	.01	.03	50	50
22	.03	.03	0.5	0.5
23	.01	.03	1.0	5
24	.01	.03	10	25
25	.008	>.05	1.0	5
26	.005	.03	1.0	1.0
27	.03	.03	0.5	0.25
28	.005	.03	0.5	0.25
29	.005	.03	0.5	0.25
30	.005	.03	0.5	0.25
31	.005	.03	50	50
32	.005	.03	0.25	0.25
33	.005	.03	0.5	0.25
34	.001	.03	0.25	0.25
35	.005	>.05	0.25	0.25
36	.003	.008	0.5	0.5
37	.03	.03	0.5	0.25
38	.008	.03	0.5	0.25
39	.01	>.05	1.0	0.5
40	.03	>.05	1.0	0.5



4.00

Compuesto número	Actividad Acaricida (% concentración)		Experimento In Vitro (p.p.m.)	
	PE	Huevos	Asperigillus niger	Penicillum Sp.
41	>.05	>.05	0.5	0.25
42	>.05	>.05	5	0.5
43	>.05	>.05	5	1.0
44	.03	>.05	1.0	0.25
45	.005	>.05	0.5	0.25
46	.005	>.05	1.0	0.25
47	>.05	>.05	5	5
48	.01	>.05	5	1.0
49	>.05	>.05	1.0	1.0
50	.05	>.05	> 50	> 50
51	.03	>.05	1.0	0.5
52	.05	>.05	> 50	> 50
53	.05	>.05	5	10
54	>.05	>.05	5	5
55	.01	.05	0.25	0.5

\* Concentración más baja comprobada

Los compuestos que se describen en el presente desplegaron igualmente actividad fungicida contra ciertos hongos patógenos transmitidos por el suelo cuando se ensayan en un experimento de incorporación fungicida del suelo. El compuesto número 1 se consideró que daba un control parcial tan bajo como 10 p.p.m. contra el Rhizoctonia solani y control completo a 10 p.p.m. del Fusarium



220 solani . A 13 p.p.m. el compuesto número 3 proporcionó el control total del Fusarium solani.

225 Tratamiento y control de la coccidiosis. La coccidiosis es una enfermedad común y extendida de las aves causada por microorganismos, a saber, varias especies de parásitos protozoos del género Eimeria, tales como E. Tenella, E. necatrix, E. acervulina, E. máxima, E. hagani, y E. Brunetti. E. tenella es el agente causante de una infección grave y con frecuencia fatal del ciego de pollos que se manifiesta por una hemorragia grave y extensa, acumulación de la sangre en los ciegos y paso de la sangre en los excrementos. E. necatrix ataca al intestino delgado del -  
230 pollo causando lo que se conoce con el nombre de coccidiosis intestinal. Especies afines de las coccidios tales como E. Meleagridis y E. adenoides son organismos causantes de la coccidiosis en los pavos. Cuando se dejan sin tratamien-  
235 to, las formas graves de coccidiosis llevan a un deficiente aumento de peso, reducida la eficacia de los piensos y una mortalidad elevada en las aves. La eliminación o control de esta enfermedad es, por consiguiente, de suprema importancia en la industria avícola. La coccidiosis afecta tam-  
240 bien a animales mayores lo mismo que a las aves, por ejemplo, E. zurnii, E. bovis y E. ellipsoidalis son especies de coccidios que han sido descritos en el ganado. También aparecen por lo menos siete especies válidas de coccidio-

4 OCT



245 sis en ovejas y cabras y por lo menos seis especies de co-  
ccidiosis en los cerdos. De forma que puede comprenderse -  
que existe también una necesidad de coccidiostatos en la -  
industria de cría de ganado.

Experimento de coccidiosis. Pollos Leghorn SCW  
de origen, raza y edad únicos fueron alojados en áreas ais-  
250 ladas libres de coccidios, y se los alimentó ad libitum -  
con una sieta de papilla comercial al 20 por ciento hasta -  
que vivieron de 10 a 21 días de edad. Cuando estos pollue-  
los alcanzaron la edad de 10 a 21 días, edad de la máxima-  
susceptibilidad a la coccidiosis, se colocaron de 4 a 8 -  
255 polluelos en jaulas de tela metálica calentadas. La selección  
de los polluelos se hace aleatoriamente de varias classifica-  
ciones por peso de forma que las variaciones de los pesos -  
totales son aproximadamente iguales.

Durante el intervalo del ensayo de 10 a 14 días,  
260 ciertos grupos de polluelos son alimentados con papillas -  
medicadas preparadas mezclando un compuesto candidato en la  
papilla en varias concentraciones tales como 2000, 1000 o -  
500 p.p.m.. Otro grupo de polluelos recibió la misma canti-  
dad de papilla no medicada.

265 Para la evaluación inicial contra los coccidios, en  
el segundo al quinto día del intervalo del experimento, se  
introduce directamente en los buches de los polluelos (ambos



270        bos grupos medicados y no medicados), utilizando una jeringuilla dosificadora y una aguja roma, una única infección con 50.000 a 100.000 cocistos esporulados de E. tenella suspendidos en dos ml. de agua.

          Después de 10 días, se sacrifican los polluelos del experimento. Durante el ensayo, se mantienen como controles grupos no infectados y sin medicar.

275        Los resultados obtenidos usando ciertos compuestos de esta invención se informan en la tabla IV. Bajo el encabezamiento "No. de Supervivientes/ No. utilizado, los valores bajo la "T" muestran el número de polluelos (medicados o infectados) que sobrevivieron del número de los  
280        utilizados. Los valores bajo el encabezamiento " % Eficacia" se calcularon por medio de métodos entendars.



T A B L A IV

<u>Compuesto número</u>	<u>Dosis (ppm)</u>	<u>Nº Superv/Nº Usado</u>		<u>Eficacia (%)</u>	
		<u>T</u>	<u>IC</u>	<u>Basada en la mortalidad</u>	<u>Basado en nº Lesiones</u>
				<u>Et</u>	<u>Et</u>
8	2000	5/5	8/10	100	75
10	1500	5/5	4/10	100	60
	700	5/5	3/5	100	75
12	2000	10/10	16/20	100	90
	500	20/20	/25	100	60
13	2000	5/5	8/10	100	100
14	3000	5/5	9/10	100	80
18	2000	5/5	8/10	100	90
	1000	20/20	22/30	100	15
20	2000	5/5	4/10	100	50
	1000	5/5	4/10	100	50
21	2000	10/10	16/20	100	75
	1000	5/5	8/10	100	30
22	1000	5/5	8/10	100	30
23	1000	9/10	14/20	20	70
24	2000	10/10	16/20	100	45
	1000	5/5	8/10	100	45
25	1000	5/5	8/10	100	25
26	2000	5/5	8/10	100	75
	1000	10/10	16/20	100	65
27	2000	5/5	5/10	100	35
28	2000	5/5	9/10	100	100
	1000	15/15	17/25	100	70
29	2000	10/10	13/20	100	85
30	2000	10/10	14/20	100	60
	1000	5/5	4/10	100	75
31	2000	5/5	8/10	100	80

4 OC



Compuesto número	Dosis (ppm)	Eficacia (%)			
		Nº Superv/Nº Usado		Basada en la mortalidad	Basado en nº de lesiones
		T	IC	Et	ET
32	2000	5/5	8/10	100	75
	1000	5/5	4/10	100	60
33	2000	10/10	11/15	100	90
	1000	10/10	15/20	100	55
34	1000	10/10	10/20	100	60
35	2000	10/10	13/20	100	65
	1000	10/10	15/20	100	65
36	2000	5/5	5/10	100	40
37	1000	10/10	15/20	100	70
38	2000	5/5	5/10	100	60
	1000	10/10	15/20	100	45
39	2000	5/5	4/10	100	85
40	2000	5/5	5/10	100	25
41	2000	10/10	13/20	100	95
	1000	10/10	15/20	100	70
42	2000	5/5	8/10	100	20
	1000	5/5	4/10	100	75
43	2000	5/5	8/10	100	65
	1000	5/5	4/10	100	75
44	1000	5/5	4/10	100	40
45	2000	5/5	8/10	100	100
	1000	5/5	4/10	100	50
46	2000	5/5	8/10	100	100
	1000	5/5	4/10	100	60
47	2000	5/5	8/10	100	70
	1000	5/5	4/10	100	40
48	1000	5/5	4/10	100	40
49	2000	5/5	8/10	100	35
	1000	5/5	4/10	100	70
50	2000	5/5	5/10	100	40
51	2000	5/5	8/10	100	90
	1000	5/5	4/10	100	85



4 00

<u>Compuesto número</u>	<u>Dosis (ppm)</u>	Eficacia (%)			
		<u>Nº Superv/Nº Usado</u>		<u>Basada en la mortalidad</u>	<u>Basado en nº de lesiones.</u>
		<u>T</u>	<u>IC</u>	<u>Et</u>	<u>Et</u>
52	2000	5/5	5/10	100	60
53	1000	5/5	4/10	100	15
54	1000	5/5	4/10	100	20

Los compuestos de la presente invención pueden usarse como agentes pesticidas eficaces y se pueden aplicar en una -  
 variedad de formas a varias concentraciones. En la práctica los  
 285 compuestos se formulan usualmente con un coadyuvante pesticida-  
 inerte utilizando métodos bien conocidos para los que están es-  
 pecializados en la profesión. La cantidad de la aplicación de--  
 penderá de la naturaleza de la utilidad particular deseada. El-  
 régimen de aplicación puede variar también con el uso microbioló-  
 290 gico insecticida o antihelmíntico que se pretende. Para tratar -  
 animales domésticos los compuestos pueden mezclarse con un por-  
 tador comestible no tóxico para formar un suplemento alimenticio  
 que se incorpora después en el pienso de los animales en la con-  
 centración deseada o pueden administrarse en dosis unitarias -  
 295 que pueden tomar la forma de una cápsula, bolo, tableta, una po-  
 ción líquida o inyección.

En realidad cualquiera de los métodos que se usan ac-  
 tualmente o que están disponibles para tratamiento de los anima-  
 les infectados con infecciones parásitas o susceptibles a ellas



300 son satisfactorios. La formulación de dosis unitarias  
puede prepararse distribuyendo la cantidad deseada de  
antihelmíntico en un vehículo farmacéuticamente acepta-  
ble. Para tratar insectos, hongos o bacterias pueden -  
usarse en las formas de emulsiones, soluciones no acuo-  
305 sas, polvos humectables, vapores, pulverizaciones y simi-  
lares, según se puedan adaptar mejor a la utilidad parti-  
cular. Los métodos específicos de aplicación al habitat -  
de pestes son bien conocidos de aquellos especializados -  
en la rama de control de pestes.

310 Descrita suficientemente la naturaleza de la -  
presente invención, se hace constar expresamente que cual-  
quier modificación de detalle que pudiera introducirse -  
se considerará incluida dentro de la misma, en tanto no -  
altere o modifique sustancialmente sus características -  
315 fundamentales.

Por último, se declaran de novedad y propia in-  
vención las siguientes

REIVINDICACIONES

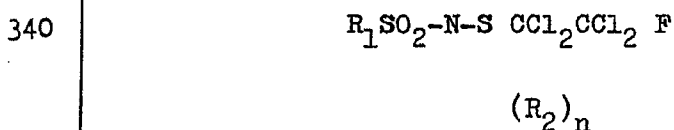
320 1ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIAN  
TE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL -  
SULFONAMIDAS, caracterizado esencialmente por comprender  
la aplicación de un compuesto obtenido por reacción de -  
condensación entre una N - fenil sulfonamida apropiada -  
325 sustituida y cloruro de sulfenil 2-fluoro - 1,1,2,1 -te-  
tracloroetilo, facilitándose esta reacción con un aceptor



10 OCT.

330 ácido (tal como piridina, trietilamina y similares), desarrollándose esta reacción fácilmente en su fase líquida, siendo útil el empleo de un disolvente orgánico inerte que facilite el proceso y la agitación de los reactores, utilizándose temperaturas que permitan la operación en la fase líquida y que estén entre alrededor de 0°C y la temperatura de reflujo del disolvente (si se emplease alguno), progresando la reacción corrientemente a bajas temperaturas, usualmente alrededor de 10°C o menos.

335 2ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-PENIL SULFONAMIDAS, según la reivindicación 1ª, caracterizado esencialmente por comprender la aplicación de un compuesto de la fórmula



345 en la que R<sub>1</sub> es un miembro seleccionado del grupo que consiste en alquilo inferior, alqueno inferior y haloalquilo inferior; R<sub>2</sub> es un miembro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alcóxilo inferior, alquilo inferior, ciano y nitro y n es un número entero entre 1 y 5, siendo R<sub>2</sub> el mismo o diferente cuando n está entre 2 y 5.

350 3ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL -



1000

SULFONAMIDAS, según la reivindicación 1ª, caracterizada por el hecho de que  $n$  es un entero entre 1 y 3, siendo  $R_2$  el mismo o diferente cuando  $n$  está entre 2 y 3.

355 4ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según la reivindicación 1ª, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es etilo,  $R_2$  es hidrógeno y  $n$  es 1.

360 5ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según la reivindicación 1ª, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es 4-cloro ó hidrógeno y  $n$  es 1.

365 6ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según la reivindicación 1ª, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es clorometilo,  $R_2$  es hidrógeno y  $n$  es 1.

370 7ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N - FENIL - SULFONAMIDAS, según la reivindicación 1ª, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es cloro y  $n$  es 2.

375 8ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, ca-



10 OCT.

racterizado por el hecho de que  $R_1$  es clorometilo,  $R_2$  es 2-metilo y  $n$  es 1.

380

9<sup>a</sup>).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es etilo,  $R_2$  es cloro y  $n$  es 2.

385

10<sup>a</sup>).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETILO-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es propilo,  $R_2$  es hidrógeno y  $n$  es 1.

390

11<sup>a</sup>).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es cloro y  $n$  es 1.

395

12<sup>a</sup>).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es 2-metilo, 5-cloro y  $n$  es 2.

400

13<sup>a</sup>).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL -- SULFONAMIDAS según las reivindicaciones anteriores, ca--



10 OCT. 1970

racterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es metil, cloro y n es 2.

405 14ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es metoxi, nitro y n es 2.

410 15ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS, según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por el hecho de que  $R_1$  es metilo,  $R_2$  es metoxi, cloro y n es 2.

415 16ª).- UN METODO PARA CONTROL DE PESTES MEDIANTE COMPUESTOS DE (TETRACLORO-FLUORO-ETIL-TIO) N-FENIL - SULFONAMIDAS.

419 Todo ello, tal y como queda expuesto en la presente memoria descriptiva, que consta de veintiocho hojas foliadas y mecanografiadas por una sola de sus caras y a dos espacios.

Madrid, 10 de Octubre 1.970

**LUIS M.ª DE ZUNZUNEGUI**  
POR PODER