



Case 6293/6092/1+2/E

359,234

P A T E N T E

D E

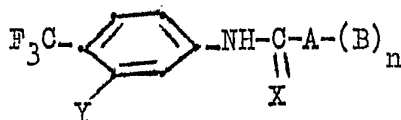
I N V E N C I O N

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE LAS MATERIAS ACTIVAS PARA AGENTES BIOCIDAS", a favor de la firma suiza CIBA SOCIETE ANONYME, residente en BASILEA (Suiza).

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

Este invento se refiere a agentes biocidas que contienen, como materia activa, a lo menos un compuesto de la fórmula general



(I)

en la que

Y significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o yodo,

X significa oxígeno o azufre,

A significa oxígeno o azufre,



- B significa un radical de hidrocarburo orgánico, en cuyo caso  $n = 1$ ;  
o bien
- A significa oxígeno,
5. B significa la agrupación  $-N=C<$ , en cuyo caso  $n = 1$ ;  
o bien
- A significa un grupo amínico, substituído o in-substituído, en cuyo caso  $n = 0$ ,
10. así como, eventualmente, uno o más todavía de los aditivos siguientes: disolventes, dispersantes, emulgentes, humectantes, fijadores, espesantes y asimismo, además, otros agentes biocidas conocidos.

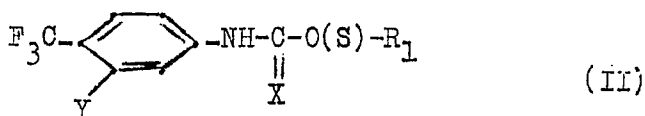
- Las materias definidas por la fórmula (I) constituyen por lo tanto;
15. a) carbamatos  
b) ureas  
o c) oximocarbamatos.

- En el caso a), el radical B puede ser un radical alifático, aralifático, aromático o heterocíclico, saturado o insaturado y, eventualmente, substituído. Así, B puede representar, por ejemplo, un radical alquílico simple, como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo o alilo, o bien un radical alifático insaturado, como
20. alilo, butinilo, etcétera. B puede contener también diver-
- 25.



5. sos substituyentes, como átomos de halógeno, grupos nitro, grupos amínicos substituídos, grupos ciánicos, rodánicos, carboalcoxílicos o carbonamídicos.

Los carbamatos del subgrupo a) pueden caracterizarse por medio de la fórmula general



en la que

X e Y tienen el significado ya definido, mientras que

10.  $\text{R}_1$  significa un radical alifático, aralifático, aromático o heterocíclico, eventualmente substituído.

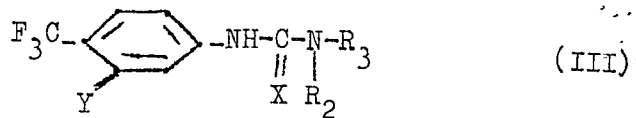
15. En las ureas del subgrupo b), el grupo amínico puede estar insubstituído o bien substituído por radicales alifáticos, aralifáticos, aromáticos o heterocíclicos. Pero el grupo amínico puede también ser componente de un heterociclo, es decir, significar, por ejemplo, aciridina, pirrolidina, piperidina, morfolina, N'-alquil- o N'-fenil-piperacina, acepina, piperidona, dioxopiperacina, etcétera.

20. Asimismo puede estar reemplazado por el grupo hidroxilamínico (que también puede estar eterificado).

El subgrupo b) puede por lo tanto caracterizarse



por medio de la fórmula general



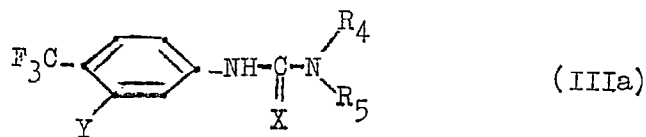
en la que

5. X e Y tienen el significado ya descrito,  
R<sub>2</sub> denota hidrógeno, el grupo hidroxílico o alcoxílico, un grupo acílico o un grupo alifático y  
R<sub>3</sub> significa un grupo alifático aromático o heterocíclico, eventualmente substituído;
- 10.

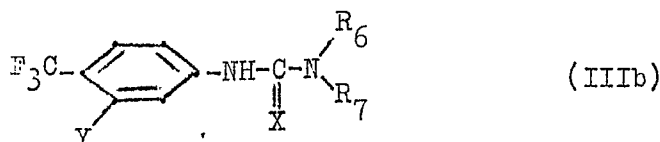
o en la que

- R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub>, junto con el átomo de nitrógeno unido a ellos, significan un heterociclo de 5 a 7 miembros, con la condición de que ambos radicales R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> (cuando Y = H) no deben representar al mismo tiempo radicales metálicos.
- 15.

A los compuestos de la fórmula



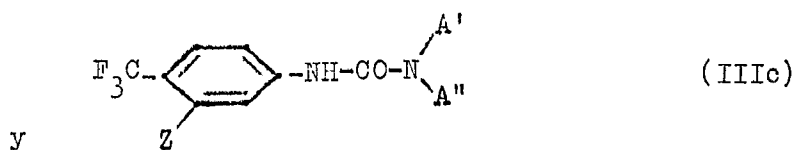
20. corresponde especial importancia como herbicidas y bactericidas, mientras que los compuestos de la fórmula



presentan propiedades insecticidas, bactericidas y quimio-terapéuticas, en particular coccidiostáticas y vermícidas.

5. En las fórmulas III a y III b, X e Y tienen el significado que ya se ha descrito, mientras que R<sub>4</sub> representa hidrógeno, el radical hidroxílico o alcoxílico o un radical alifático, R<sub>5</sub> representa un radical alifático, R<sub>6</sub> representa hidrógeno y R<sub>7</sub> representa un radical fenílico o fenilalquílico, eventualmente substituído. Cuando R<sub>7</sub> representa un radical fenílico o fenilalquílico substituído, pueden formarse aductos, por ejemplo con dimetilformamida o 2-hidroxi-4,6-dimetilpirimidina.
- 10.

15. En las fórmulas (III a) y (III b) se engloban en particular los compuestos de las fórmulas



- $$\begin{array}{c}
 \text{F}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Z})-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CH}_2)_n-\text{C}_6\text{H}_3(\text{B}')(\text{B}'')
 \end{array}
 \quad (\text{IIIId})$$
- 20.

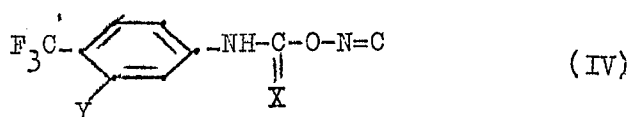




donde

$R_3$  significa un radical alifático de 2 a 14 átomos de carbono..

5. Los oximocarbamatos del subgrupo c) pueden caracterizarse por medio de la fórmula general



en la que

10. X e Y tienen el significado que ya se ha definido, mientras que en la agrupación

15.  $\text{---N=C} \begin{cases} / \\ \backslash \end{cases}$  una a lo menos de las dos valencias libres está saturada con un radical alifático, aralifático o aromático y la otra valencia está saturada también con hidrógeno, o bien ambas valencias pueden estar cerradas junto con el carbono formando un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 a 7 miembros.

20. Las materias activas de las fórmulas I a IV no se habían descrito hasta ahora en la literatura. El invento atañe pues también a los nuevos compuestos de las fórmulas I a IV, y eventualmente a sus aductos, en particular a los aductos con dimetilformamida o con 4,6-dimetil-2-hidroxi-pirimidina.



Los nuevos agentes que contienen las materias activas de la fórmula (I) tienen en general acción microbici-  
vas de la fórmula (I) tienen en general acción microbici-  
das. Pueden emplearse, por ejemplo, para la protección de la  
madera, la lana, el papel, los géneros textiles, las pie-  
5. les, las materias sintéticas, las fibras artificiales, la  
goma, los colorantes o las pastas de estampar, los materia-  
les de construcción, las masas de adhesivos, los aceites,  
las ceras, el corcho, los cosméticos y los detergentes, y  
contra la descomposición por las bacterias y los hongos.

10. Los nuevos agentes actúan además contra la apoli-  
lladura, como agentes de cebo en la protección de las plan-  
tas, como agentes contra los helmintos, los dístomos, los  
nemátodos, los anofeles (larvas) y los diversos causantes  
de la coccidiosis, como agentes protectores de la madera,  
15. en la protección de las provisiones, como desinfectantes  
de las simientes, como agentes contra la caries, como qui-  
micoesterilizantes, contra los moluscos, las lampreas, las  
sérpulas, los conchíferos, las algas, los hidroides, los  
gasterópodos acuáticos y terrestres, las termitas, las  
20. garrapatas, las amebas, los esquistosomas, las salmonellas,  
los tricomónadas, las filarias, los protozoos, los plasmó-  
dios, los tremátodos, los tripanosomas, los virus, etcétera,

25. Como ya se ha dicho antes, los nuevos derivados de  
ácido carbanílico acordes con este invento tienen marcada  
acción contra los organismos nocivos del reino vegetal y



del reino animal. En particular, los nuevos compuestos son eficaces contra las bacterias, los hongos, las esporas micóticas, los gusanos, los insectos, los gasterópodos, etcétera. Los derivados de ácido carbanílico acordes con este invento tienen por tanto una acción muy extensa como agentes antiparasitarios.

10. Resulta de paso sumamente ventajoso que los nuevos derivados de ácido carbanílico no presenten ninguna manifestación secundaria tóxica contra las plantas útiles o contra los animales de sangre caliente, a las concentraciones con que se los necesita para uso antiparasitario. En virtud de ello, el empleo de los nuevos carbanilatos es posible en amplia base para combatir los organismos nocivos; por ejemplo, en la protección de las plantas, la protección de la madera, la conservación de los más diversos productos industriales, la protección de los materiales de fibra contra los organismos nocivos, la conservación de los productos agrícolas, como agentes de desinfección en la medicina veterinaria, en la higiene general y en el aseo corporal.

25. Especial importancia tiene además que los derivados de ácido carbanílico de este invento no pierdan su actividad bactericida y fungicida aún en presencia de cuerpos albuminosos y jabones. Los nuevos compuestos no presentan ningún olor propio molesto y son de buena



tolerancia para la piel, a lo menos para la piel sana.

- Como ejemplos del empleo de los nuevos compuestos en la protección de las plantas cabe señalar el tratamiento de las semillas vegetales y de las plantas total o parcialmente desarrolladas, así como del terreno en que crecen las plantas, contra los organismos nocivos, en particular contra los hongos, las esporas micóticas, las bacterias, los nemátodos y los insectos perjudiciales, donde hay que destacar otra vez la carencia de acciones secundarias fitotóxicas de las nuevas materias protectoras a las concentraciones en que son eficaces.
- 5.
  - 10.

- Entre los productos industriales que se conservan o desinfectan con ayuda de los nuevos derivados de ácido carbonílico cabe destacar, como ejemplos, los siguientes:
15. agentes auxiliares y agentes de refinamiento textil, colas, adhesivos, pinturas, espesantes, pastas para teñir y estampar y preparaciones semejantes a base de colorantes o pigmentos orgánicos e inorgánicos, incluso los que contienen como complementos caseína u otros compuestos orgánicos.
  20. También las pinturas para paredes y techos, por ejemplo las que contienen un aglutinante para pinturas provisto de albúmina, quedan protegidas del ataque de los parásitos por una adición de los nuevos compuestos.

Los nuevos derivados de ácido carbonílico pueden



- utilizarse además para la protección de las fibras y los géneros textiles, porque prenden a las fibras naturales y artificiales y despliegan en ellas una acción duradera contra los microorganismos nocivos (por ejemplo, hongos, bacterias e insectos). La adición de las ureas puede además realizarse antes del tratamiento, al mismo tiempo que el tratamiento, o después del tratamiento de estos géneros textiles con otras materias, (por ejemplo, pastas de teñir o de estampar, aprestos, etcétera). Los derivados de ácido carbanílico de este invento pueden proteger en alto grado las fibras de lana contra la polilla y otros parásitos devoradores. Aplicados a las fibras, por ejemplo, en una solución acetónica o después de fijados a las fibras en un baño acuoso, en presencia de un emulgente y/o un detergente, muestran acción sobresaliente contra las larvas de la polilla.
- 5.
- 10.
- 15.

- Los nuevos derivados de ácido carbanílico pueden utilizarse asimismo en la industria de la celulosa y la industria del papel como agentes de conservación, entre otros aspectos para prevenir la conocida formación de mucílago ocasionada por los microorganismos en las instalaciones empleadas para la fabricación de papel.
- 20.

- Objeto de este invento son además agentes para combatir a los parásitos (por ejemplo, hongos perjudiciales, esporas micóticas, gusanos, representantes del orden
- 25.



Acarina e insectos) que contienen como componente activo a lo menos un derivado de ácido carbanílico de la fórmula general (I), así como, eventualmente, uno a lo menos de los aditivos siguientes: disolventes, diluentes sólidos, líquidos o gaseosos, fijadores, emulgentes, dispersantes, 5. detergentes, humectantes u otros agentes antiparasitarios más, como fungicidas, bactericidas, herbicidas, acaricidas, insecticidas y asimismo abonos.

Según el carácter de los aditivos con que se combinan los nuevos carbanilatos en los agentes de este invento, se obtienen composiciones aptas para la limpieza, la desinfección o el cuidado del cuerpo. 10.

Así, por ejemplo, mediante combinación de los derivados de ácido carbanílico de este invento con materias 15. detergentes o tensioactivas se llega a agentes de lavado y de limpieza con excelente acción antibacteriana o antimicótica. Los compuestos de la fórmula general (I) pueden incorporarse, por ejemplo, a los jabones o combinarse con materias no jabonosas de acción detergente o tensioactiva.

Como ejemplos de compuestos no jabonosos de actividad detergente que pueden emplearse en mezcla con los nuevos derivados de ácido carbanílico cabe mencionar: 20.

los sulfonatos de alquilarilo,

los sulfonatos de tetrapropilbenceno,





- Los agentes de limpieza con acción desinfectante que así se obtienen pueden utilizarse, por ejemplo, en el lavado de la ropa. Para ello es una ventaja que las nuevas ureas, aplicadas en concentración adecuada, prendan al material de fibra en el baño de lavado ( y aún incluso en simple solución de jabón) y le confieran un apresto antibacteriano y antimicótico duradero. Los géneros textiles así tratados quedan también protegidos contra la aparición del olor sudoral, como el que ocasionan los microorganismos. Se los puede utilizar además en el lavado de la ropa (por ejemplo, como depuradores industriales o como agentes de limpieza para uso doméstico), así como en las industrias de la alimentación (por ejemplo, granjas lecheras, fábricas de cerveza y mataderos), en la agricultura y en la higiene veterinaria.
- 5.
- 10.
- 15.

- También pueden emplearse estos compuestos como componentes de preparaciones destinadas a la limpieza o la desinfección en los hospitales y en la práctica médica; así, por ejemplo, para limpiar la ropa de los enfermos, las salas y los aparatos; para ello, si es preciso, los nuevos compuestos pueden combinarse con otros agentes de desinfección y con productos de acción antiséptica, con lo cual puede atenderse a los requisitos planteados en cada caso para la limpieza o la desinfección. El hecho de que los nuevos derivados de ácido carbanílico no pierdan su actividad contra los microorganismos ni aún en presencia de
- 20.
- 25.



sangre o suero, tiene en este aspecto particular importancia.

- También pueden emplearse los nuevos derivados de ácido carbanílico, si es necesario junto con otras materias bactericidas y fungicidas, agentes protectores de la piel, etcétera, para las preparaciones destinadas a la limpieza de la piel (por ejemplo, de las manos) con efecto antibacteriano y antimicótico, y en particular también en la práctica médica. Además, constituyen agentes eficaces contra la aparición del ingrato olor corporal ocasionado por la acción de microorganismos. Resulta aquí otra vez una ventaja que no se produzcan irritaciones cutáneas, a lo menos en la piel sana, y que los nuevos compuestos carezcan de olor propio molesto, a diferencia de lo que ocurre, por ejemplo, con los fenoles clorados.
- 5.
- 10.
- 15.

- En calidad de aditivos de acción biocida que pueden hallarse en los agentes de este invento además de los carbanilatos de la fórmula general (I) cabe señalar, por ejemplo: el alcohol 3,4-diclorobencílico, los compuestos amónicos (como el cloruro de tiisobutilfenoxietoxietil-di-metilbencilamonio, el cloruro de cetilpiridinio y el bromuro de cetil-trimetilamonio), los dioxidifenilmetanos halogenados, el disulfuro de tetrametiltiuramo, el 2,2-tio-bis-(4,6-diclorofenol), los compuestos orgánicos que contienen el grupo tiotriclorometílico, las salicilani-
- 20.
- 25.



- lidas, las diclorosalicilanilidas, las dibromosalicilanilidas, la tribromosalicilanilida, el ácido diclorocianúrico, las tetraclorosalicilanilidas, los sulfuros de tiurano alifáticos, el hexaclorofeno y el éter 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifenílico.
- 5.

Los agentes de este invento con acción desinfectante pueden contener además, como aditivos, antioxidantes, agentes antiactínicos, aclaradores ópticos, agentes endurecedores, materias odorantes, etcétera.

10. Por elaboración de los nuevos derivados de ácido carbanílico con las materias empleadas de ordinario en el cuidado del cuerpo, se obtienen composiciones que son aptas en alto grado para los fines cosméticos.

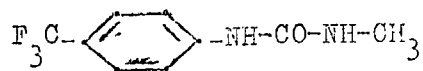
15. A tenor de sus múltiples posibilidades de empleo, los agentes de este invento que contienen los compuestos de la fórmula general (I) pueden hallarse en las más diversas formas de aplicación; por ejemplo, como jabones en piezas, semisólidos y líquidos, como pastas, polvos, emulsiones, suspensiones, soluciones en disolventes orgánicos, sprays, polvos de tocador, granulados, pastillas, lápices, cápsulas de gelatina y de otro material, pomadas, cremas cutáneas y de afeitar, colutorios, pastas dentífricas líquidas, semisólidas o sólidas y otros agentes de cuidado dental, lociones para el cabello y otros agen-
- 20.



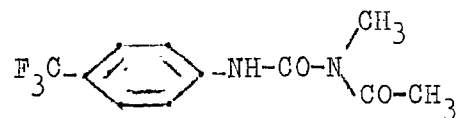
tes de cuidado capilar.

- La acción de los agentes de este invento contra los organismos nocivos del reino vegetal y del reino animal se conserva también cuando se incluyen los agentes en cuerpos moldeados a base de materias plásticas. Cuando se emplean ablandadores, es ventajoso añadir al plástico el complemento biocida disuelto o disperso en el ablandador. Conviene cuidar de que la distribución en el plástico sea lo más uniforme posible. Los plásticos con propiedades antimicrobianas pueden emplearse para objetos de uso de toda clase en los que se desee actividad profiláctica contra los más diversos gérmenes, como por ejemplo contra las bacterias de la putrefacción o los hongos cutáneos; así, por ejemplo, para esterillas, pomos, armaduras de las puertas, guarniciones de asientos, rejillas de piso en las piscinas, colgaduras de paredes, particularmente en los hospitales, etcétera. Incorporando estos compuestos a masas para encáusticos y encerados, se obtienen agentes para el cuidado del suelo y del mobiliario dotados de acción desinfectante e insecticida.
- 5.
- 10.
- 15.
- 20.

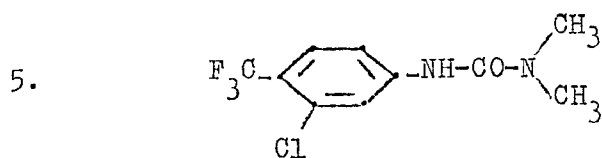
Como materias con propiedades particularmente interesantes cabe señalar, a título de ejemplos, las ureas siguientes:



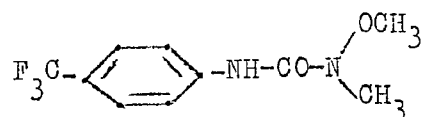
actividad herbicida intensa



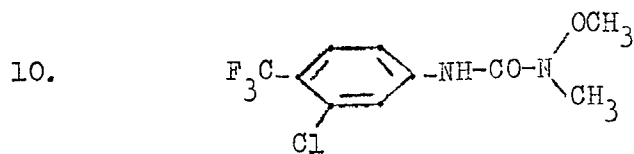
acción intensa contra las larvas de anofeles



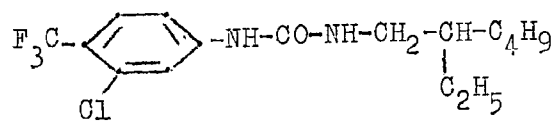
acción herbicida intensa



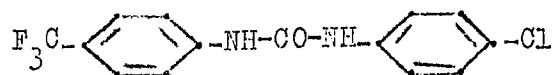
acción herbicida intensa



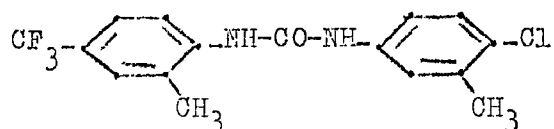
acción herbicida intensa



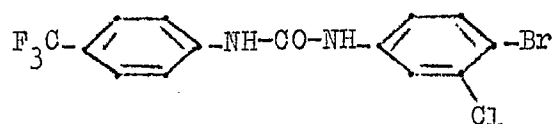
15. acción bactericida intensa



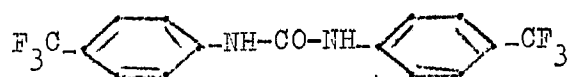
acción bactericida intensa



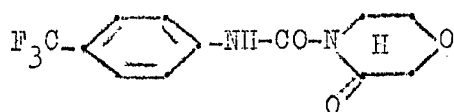
5. acción intensa contra los vermes endoparasitarios



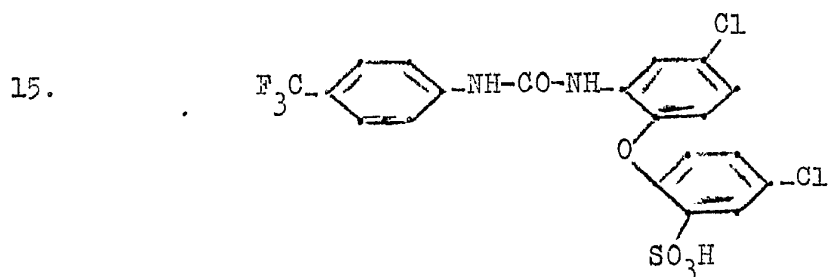
acción intensa contra los vermes endoparasitarios



10. insecticida, y respectivamente tóxico por ingestión, contra las orugas devoradoras de las plantas



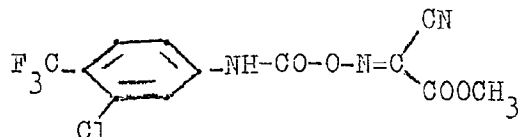
acción insecticida intensa, por ejemplo contra el *Aedes aegyptis*



15.

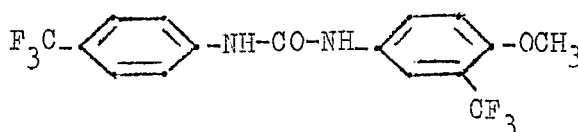


acción protectora intensa contra la apolilladura



acción protectora intensa contra los hongos fitopatógenos

5.



tóxico por ingestión.

Los nuevos compuestos de la fórmula (I) pueden prepararse de la manera siguiente:

10. a) Carbamatos: Reacción de un isocianato de p-trifluorometilo con un alcohol o tialcohol alifático, aralifático, aromático o heterocíclico. En lugar del isocianato pueden emplearse también los llamados isocianatos camuflados, como por ejemplo los aductos de isocianatos con NaHSO<sub>3</sub>, etcétera, o los respectivos haluros de ácido carbámico.
- 15.

b) Ureas y c) Oxinocarbamatos: En principio pueden prepararse de la misma manera que se ha descrito en a), haciendo reaccionar, por ejemplo, las anilinas siguientes:

- 4-cloro-3-bromo-anilina,
20. 3,5-dibromo-4-metoxianilina,



- 3,4,5-tricloroanilina,  
4-yodo-3-cloroanilina,  
4-yodo-3-bromo-anilina,  
4-metoxi-3-cloroanilina,  
5. 4-metoxi-3-bromo-anilina,  
4-metoxi-3-trifluorometilanilina,  
3,4-metilendioxi-anilina,  
4-metilsulfinil-anilina,  
4-metilsulfonil-anilina,  
10. 4-metiltio-3-cloro-anilina,  
4-metilsulfinil-3-cloro-anilina,  
3,4-dicloro-anilina,  
etcétera,
- o también las aminas alifáticas siguientes:
15. etilamina,  
propilamina,  
butilamina,  
dietilamina,  
dipropilamina,
20. N-metil-N-propargilamina,  
N-metil-N-cianoetilamina,  
N-metil-N-butililamina,  
morfolina,  
pirrolidina,
25. dimetilmorfolina,  
tiomorfolina,



- N-metil-piperacina,  
N'-fenilpiperacina,  
acepina,  
O,N-dimetilhidroxilamina o  
5. hidroxilamina,  
en cuyo caso el producto de la reacción puede todavía hacerse reaccionar, eventualmente, con agentes de alquilación. Las ureas simétricas pueden prepararse asimismo por reacción de 2 moles de isocianato con 1  
10. mol de agua.

- En lugar de las anilinas mencionadas al principio pueden emplearse también anilinas fenoxi substituidas o anilinas feniltio-substituidas; por ejemplo p-clorofenoxi-anilina, p-(3,4-dicloro-fenoxi)-anilina, p-(4-nitrofenoxi)-anilina, etcétera.  
15.

- En lugar de las anilinas, pueden hacerse reaccionar aminas heterocíclicas, como, por ejemplo 2-aminopiridina, 3-aminopiridina, 5-aminopirimidina, 3-aminopiridazina, 2-aminotiazol, 2-ciclopropil-bencimidazol, 2-n-propil-bencimidazol, 2-trifluorometil-bencimidazol, etcétera. Las N,N'-diaril-ureas y los oximocarbamilatos pueden emplearse en la protección de las plantas. Se los puede utilizar como tóxicos por ingestión contra las larvas de los insectos devoradores de las plantas, contra los insectos chupadores, contra los nemá-  
20.  
25.



todos fitoparasitarios y (principalmente los oximocarbamylatos) contra los hongos y las bacterias fitoparasitarias. Las sustancias activas pueden aplicarse en forma de sprays, granulados, polvos de espolvoreo, etcétera.

5. Para la aplicación contra los nemátodos, como fungicidas del terreno o insecticidas del terreno, es posible la incorporación directa de las sustancias al terreno sin empleo de materias de vehículo.

10. Las N-aril-N'-alquil- o N',N'-dialquil- o N'-alcoxi-N'-alquilureas pueden emplearse como herbicidas. Según las cantidades de aplicación, entra en cuenta el empleo como herbicida totalitario o herbicida selectivo; por ejemplo, en las plantas de cultivo, como el maíz, el arroz, el algodón, la soja, los cereales, la remolacha azucarera, etcétera.
15. Las formas de aplicación son conocidas: por ejemplo, entra en cuenta la aplicación como spray, como granulado, como polvo, etcétera.

20. Las ureas de la fórmula (III) pueden combinarse también con otros herbicidas conocidos que refuercen o completen la acción de las primeras. Así, por ejemplo, las ureas de la fórmula (III) pueden combinarse con hormonas del crecimiento (auxinas) y con otros herbicidas, como, por ejemplo, los que se describen en la patente norteamericana 3 385 692.



Los carbamatos de la fórmula (II) pueden emplearse predominantemente como herbicidas, en particular aquellos en los que E significa un radical alifático inferior, por ejemplo el radical metílico, etílico, propílico, isopropílico, butinílico, o gamma-clorobutinílico.

5.

Los carbamatos de la fórmula (II) pueden combinarse también con ureas de la fórmula (III) de actividad herbicida, para lograr un refuerzo o complemento de la acción de uno u otro componente.

10. Por lo demás, las ureas de la fórmula (III) en las que A significa un grupo amínico o hidroxiamínico sustituido alifáticamente pueden emplearse también, en cantidades de aplicación más pequeñas, que no produzcan ningún efecto secundario fitotóxico, contra las bacterias, los hongos y los nemátodos fitopatógenos.

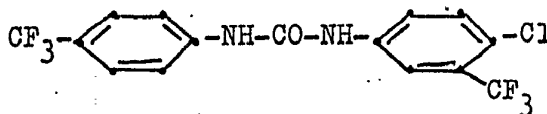
15.



Ejemplo 1

5. Se disuelven en 100 cc de acetonitrilo 29,4 g de 4-cloro-3-trifluorometil-anilina y se deposita la solución en un matraz de agitación. Agitando bien y refrigerando, se instilan entonces 28 g de isocianato de p-trifluorometilfenilo, disueltos en 50 cc de acetonitrilo. Se prosigue la agitación por 5 horas, se separa por succión el precipitado originado y se seca éste a 40° C. Se obtienen 43,8 g, o sea 76,5 % de la teoría, de urea de la fórmula

10.



que funde a 245-246°C

(Materia nº 1)

15.

De la misma manera que se ha descrito en este ejemplo pueden prepararse las ureas siguientes:

15.

20.

25.

Com- pues- to nº	R=	Punto de fu- sión °C	Com- pues- to nº	R=	Punto de fusión, °C
2	$\text{F}_3\text{C-C}_6\text{H}_4\text{-NH-CO-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{CF}_3)$	238-239	3	$\text{F}_3\text{C-C}_6\text{H}_4\text{-NH-CO-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{CF}_3)$	213-215
4	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{CF}_3)$	238-239	5	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{Cl})$	245-247
6	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-CF}_3$	239	7	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-CF}_3$	192-193



Com- pues to Nº		Punto de fusión °C	Com- pues to Nº		Punto de fusión Nº	
	8	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-NO}_2$	>300	9	Aducto de 2-hidroxi-4,6-dimetilpirimidina	224-226
5.	10	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{NO}_2)$	212-213	11	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_3$	268-269
	12	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)$	203-205	13	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{CH}_3)$	240-242
10.	14	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{CH}_3)$	233-235	15	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_2(\text{CH}_3)_2(\text{Cl})_2$	242-243
	16	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-Cl}$	240-242	17	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-Br}$	274-276
15.	18	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_4\text{-J}$	282-284	19	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)(\text{Br})$	234-236
	20	$\text{R-NH-C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2$	248-249	21	$\text{R-N}(\text{OCH}_3)(\text{CH}_3)$	94-95
20.	22	$\text{R-N} \begin{array}{c} \diagup \text{H} \diagdown \\ \text{O} \end{array}$	156	23	$\text{R-N} \begin{array}{c} \diagup \text{H} \diagdown \\ \text{O} \\ \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array}$	165-167
	24	$\text{R-NH-CH}_2\text{-CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-C}_4\text{H}_9$	Aceite	25	$\text{R-NH-CH}_3$	190-191
25.	26	$\text{R-NH-C}_2\text{H}_5$	161-162	27	$\text{R-N} \begin{array}{c} \diagup \text{O} \diagdown \\ \text{H} \end{array}$	161-162



5.

10.

15.

20.

25.

30.

Com- pues to Nº		Punto de sión, ºC	Com- pues to Nº		Punto de sión, ºC
28	R-NH-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (i)	172-173	29		110-112
30		124-125	31		167-169
32		110-113	33	R-NH-	196-197
34	R-NH-	196-198	35	R-NH-	190-192
36	R-NH-	182-184	37	R-NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH-R	262-263
38	R-NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -NH-R	255-256	39	R-NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -NH-R	251-254
40	R-NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -NH-R	274-275	41		140
42		117-118	43		120-121
44	R-NH-CH <sub>2</sub> -CH	108	45		220-224



	Com- pues to Nº		Punto de fusión, ºC	Com- pues to Nº		Punto de fusión, ºC
5.	46		196-198	47		202-205
	48		190-195	49		237-239 Descom- posición
10.	50		251	51		225
	52		187-188	53		238-239
15.	54		155-158	55		340-342
	56		216	57		235-237
	58		222-223	59		230-232
25.	60		251-253	61		219-220
	62		240-241	63		126-127
30.						



5.

10.

15.

20.

25.

30.

Com- pues- to Nº		Punto de fusión, °C	Com- pues- to nº		Punto de fusión, °C
64		226	65		94-96
66		92-95	67		99-100
68		93-95	69		228-230
70		112-113	71		213-214
72		162-163	73		91-92
74		135-136	75		230-232
76		234-235	77		241-242
78		225-226	79		214-215
80		218-220	81		Aceite



Com- pues- to Nº		Punto de fusión, °C	Com- pues- to Nº		Punto de fusión, °C
5. 82		Aceite	83		199-200
84		215-216	85		188
10. 86		221-227	87		240
88		199-200	89		203-205
15. 90		169-170	91		252-254
92		208-210	93		250-252
20. 94		240-241	95		211-212
96		186-190	97		181-183
25. 98		222-223	99		194-195



Com- pues- to Nº		Punto de fusión, °C	Com- pues- to Nº		Punto de fusión, °C	
5.	100		198-199	101		219-221
	102		185-186	103		194
10.	104		191-192	105		193-197
	106		220-221	107		182-184
15.	108		80-82	109		65-66
	110		192-196	111		142-143
20.	112		157-159	113		231-232
	114		214-215	115		258
25.	116		124-125,5	117		212-213
	118		222-223	119		211-212





Com- pues to Nº		Punto de fusión °C	Com- pues to Nº		Punto de fusión °C	
5.	140	<chem>R-NH-C6H3(Cl)CF3</chem>	244-247	141	<chem>R-N(CH3)C4H9(i)</chem>	121-122
	142	<chem>R-NH-C4H9(n)</chem>	116-117	143	<chem>R-NH-C6H4(Cl)</chem>	243-244
10.	144	<chem>R-NH-C6H3(Cl)2</chem>	267-268	145	<chem>R-NH-C6H3(Cl)CF3</chem>	268-269
	146	<chem>R-NH-C6H3(CF3)2</chem>	157-158	147	<chem>R-NH-C6H4(NO2)</chem>	268-269
15.	148	<chem>F3C-C6H4-NH-CS-N(CH3)2</chem>	192-194	149	<chem>F3C-C6H3(Cl)-NH-CS-N(CH3)2</chem>	161-165

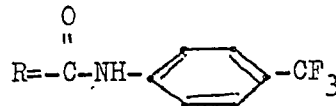


Ejemplo 2

Se disuelven en 150 cc de benceno 14,1 g de fenol y se añaden 10 gotas de trietilamina. Se instilan en esta solución 28 g de isocianato de p-trifluorometilfenilo, mientras se mantiene la temperatura entre 30 y 35°C por medio de refrigeración externa. Se agita durante la noche y, después de añadir 250 cc de bencina, se separa por filtración el carbamato de N-p-trifluorometilfenil-O-fenilo precipitado, de punto de fusión 161-163°C, y se le seca en vacío.

(Compuesto nº 150)

De la misma manera se preparan los carbamatos siguientes:



Com- pues- to Nº	O - R	Punto de fusión, °C	Com- pues- to Nº	O - R	Punto de fusión °C
151		170-171	152		161-163
153		147-151	154		149-151
155		151-153	156		135-138

5.

10.



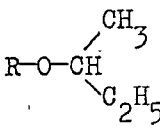
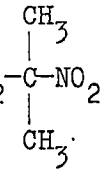
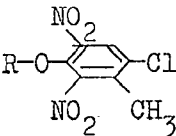
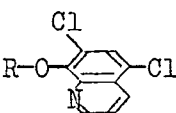
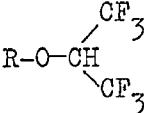
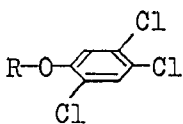
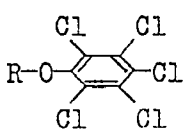
15.

20.

25.

Com- puesto Nº		Punto de fusión, °C	Com- pues- to Nº		Punto de fusión °C
157		129-130	158		99-101
159		155-158	160		145-147
161		131-133	162		170-172
163		138-140	164		89-100
165		102-105	166		175-177
167	$R-O-CH_2-C\equiv C-CH_2-Cl$ Aceite				



Com- pues- to N <sup>o</sup>	R = F <sub>3</sub> C-  -NH-CO-	Punto de fusión °C	Com- pues- to N <sup>o</sup>	R = F <sub>3</sub> C-  -NH-CO-	Punto de fu- sión, °C
168	R-O-CH 	89-93	169	R-O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	97-99
5. 170	R-O-CH <sub>2</sub> -C 	123-125	171	R-O- 	102-103
10. 172	R-O-CH <sub>2</sub> -C≡CH	98-99	173	R-O- 	132-134
174	R-O-CH <sub>3</sub>	121-124	175	R-O-CH 	96-97
15. 176	R-O-CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -CHF <sub>2</sub>	100-102	177	R-O-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	99-101
178	R-O- 	130-132	179	R-O-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	82-84
20. 180	R-O- 	168-170			



Compues- to N <sup>o</sup>	R=	Punto de fusión, °C
5. 181	$\text{R} = \text{F}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{NH}-\text{CO}-$	Acetate
182	$\text{R}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{Cl}$	104-106
183	$\text{R}-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	92-93
10. 184	$\text{R}-\text{O}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{H}$	56-60
15. 185	$\text{R}-\text{S}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$	204-206


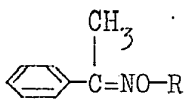
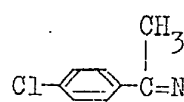
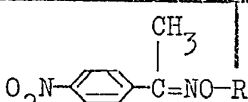
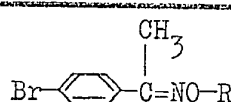
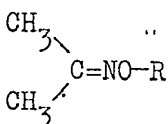
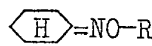
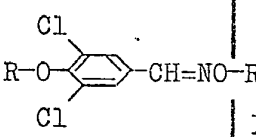
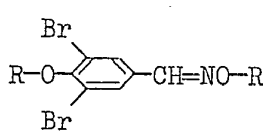
EJEMPLO 3

Se disuelven en 100 volúmenes de éster etílico de ácido acético 16 partes de éster metílico de ácido oximinociano-acético y se trata la solución con 30 partes de isocianato de 3-cloro-4-trifluorometilfenilo en 100 volúmenes de acetato de etilo.

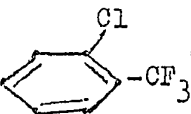


Se añade 0,1 parte de trietilendiamina y al cabo de 12 horas se diluye con éter de petróleo (de 50-70°C) y se filtra. Punto de fusión, 167-169°C (descomposición).

25. (Compuesto n<sup>o</sup> 196)



R= -CO-NH-  -CF <sub>3</sub>					
Compuesto N <sup>o</sup>		punto de fusión	Compuesto N <sup>o</sup>		punto de fusión °C
5. 186	 -C=NO-R	117-119	187	Cl-  -C=NO-R	120-121
188	O <sub>2</sub> N-  -C=NO-R	176-177	189	Br-  -C=NO-R	134-136
10. 190	 -C=NO-R	83-84	191	 =NO-R	124-125
192	 -CH=NO-R	164-166 Descomposición	193	 -CH=NO-R	166-167 Descomposición

15.

Compuesto n <sup>o</sup>	R= -CO-NH-  -CF <sub>3</sub>	Punto de fusión
20. 194	 H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> OOC-C=NO-R	150-152 descomposición
195	 -OOC-C=NO-R	165-166 descomposición



Ejemplo 4

Para formar un agente al 50 % se elaboró la materia activa nº 6 de la manera siguiente:

5. En el molino de pitones, se formó un polvo fino moliendo 50 g de materia activa con 40 g de Bolus alba, 5 g de ácido silícico finamente precipitado (ZEOSIL), 3,5 g de un producto de condensación constituido por 1 mol de p-octilfenol terciario y alrededor de 8 moles de óxido de etileno y 1,5 g de sodio 1-bencil-2-heptadecilimidazol-di-sulfónico. Dicho polvo puede dispersarse en agua en cualquier proporción.
- 10.

Ejemplo 5

15. Para demostrar la acción por ingestión de la materia activa nº 6, se someten al compuesto, en diversas disposiciones de ensayo, larvas de 3 especies de parásitos, que ingieren partes vegetales tratadas por inmersión con la materia activa.

20. En una caja de Petri que, para el mantenimiento de la humedad apropiada del aire, contenía también un tampón de guata humedecido, se sometieron a prueba cada vez en grupos de cinco, con una hoja tratada de Malva silvestris, larvas L<sub>2</sub> de Prodenia litura.

En la prueba con *Orgyia gonostigma* se emplearon



plantitas de malva puestas en maceta, sobre las que los cinco animales de ensayo  $L_3$  estaban localizados por una bolsa de celofana sujeta por una cinta de goma a la maceta.

5 La misma disposición de ensayo se utilizó para la prueba con las larvas  $L_4$  del gorgojo mejicano de la habichuela, *Epilachna varivestita*. En este caso, sin embargo, se empleó como planta huésped el *Phaseolus vulgaris*.

10. Los resultados de los ensayos están expuestos en forma de tablas en las que se indican los índices de exterminio en %, la concentración de materia en ppm y la duración del ensayo en días.



1.) *Prodenia litura*

	Concentra- ción (ppm)	% de extermi- nio al cabo de 1 día	y al cabo de 2 días
	800	100	100
	400	100	100
5.	200	60	80
	100	0	0

2.) *Orgyia gonostigma*

	Concentra- ción (ppm)	% de extermi- nio al cabo de 2 días	y al cabo de 5 días
	800	100	100
	400	100	100
10.	200	80	80
	100	80	80

3.) *Epiladna varivestis*

	Concentra- ción (ppm)	% de extermi- nio al cabo de 2 días	y al cabo de 5 días
	800	100	100
15.	400	100	100
	200	60	80
	100	0	0

Otras diarilureas de estructura semejante actúan de la misma manera que se ha descrito antes.

20. Ejemplo 6

Las materias activas n<sup>o</sup> 1, 2, 4, 5 y 13 mostraron contra el helminto *Hymenolepis nana*, en el ratón,



las siguientes DE 50 y DL 50 y los siguientes índices terapéuticos:

Compuesto Nº	DE 50 en mg/kg	DL 50, en el ratón, en mg/kg	Índice terapéu- tico
1	20	< 1000	< 50
2	20	~ 2000	~ 100
3	20	~ 1000	~ 50
4	30	< 1000	~ 25
5	20	~ 1000	~ 50
13	30	> 2000	> 60

5.

10.

Ejemplo 7

El compuesto nº 2 manifestó contra los gasterópodos, en pequeñas concentraciones (1 ppm y menos), buena acción extorminadora. (Organismo de ensayo: Australorbis glabratus).

15.

Ejemplo 8

Las ureas siguientes manifestaron contra el Staphylococcus aureus los siguientes índices de inhibición bacteriostática y bactericida, en ppm:



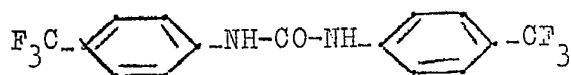
Compuesto N°	Concentración inhibidora en ppm contra el Staphylococcus aureus	Estasis / Cidia
	1	0,001/ $\sim$ 0,01
	2	0,01/ $\sim$ 0,01
	3	0,03/ $\sim$ 0,03
5.	4	0,003/ 0,003
	20	0,003/ 0,003
	6	0,003/ 0,003
	7	0,03/ 0,1
	8	0,1/ 0,1
10.	5	0,003/ 0,003
	13	0,01/ $\sim$ 0,01
	14	0,03/ 0,03

Ejemplo 9

15. El hecho de que la posición orto respecto al grupo NH-CO no debe hallarse ocupada en las p-trifluorofenilmetilureas, lo demuestra la comparación que sigue con una urea ya previamente conocida, respecto a la acción bacteriostática:

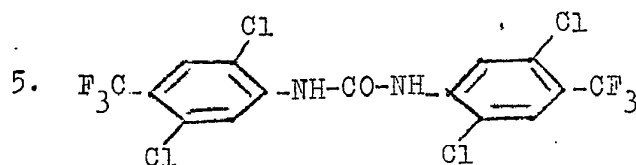


Concentración inhibidora en ppm contra el *Staphylococcus aureus*  
Estasis / Cidia



0,01/0,01

según el invento



3/3

(patente norteamericana  
nº 2 745 874)

La urea ya conocida es por lo tanto unas 300 veces menos eficaz que la urea de este invento.

Ejemplo 10

10. Las materias activas nº 2, 7 y 8 mostraron contra el *Aedes aegyptis* (larvas de mosquito) acción fuertemente exterminadora en las concentraciones siguientes:

Compuesto Nº	Concentración de exterminio, en ppm
2	0,06
15. 7	0,04
8	0,03

El compuesto nº 8 manifiesta una intensidad de acción que se halla en el mismo orden de magnitud que



la del DDT.

Ejemplo 11

Prueba de lavado

5. Unos redondeles de algodón estériles (3,0 g) de 4 cm de diámetro se inoculan cada uno con 0,1 cc de una suspensión de *Staphylococcus aureus* que contiene 50 % de suero estéril de buey y  $10^4$  gérmenes y se secan durante una hora a 37° C. Luego se los lava en una lavadora de laboratorio, en una proporción de líquido de 1:20, con 4 g por litro
10. de un detergente hecho a base de sulfonato de codecilibenceno y que contiene 1 % del compuesto n° 130, durante 15 minutos y a 45° C. A continuación, se enjuaga con la misma proporción de líquido durante 15 minutos a 45° C y, por tres veces, a 20° C, durante 5 minutos cada vez. Los redondeles de tejido se secan luego entre papel de filtro
15. estéril.

La acción remanente se determina así:

20. Se depositan los redondeles sobre placas de agar que se han inoculado previamente con cultivos, viejos de 18 horas, de *Staphylococcus aureus*. A continuación se incuban estas placas durante 24 horas a 37° C.

Resultado: Los redondeles tratados con el compuesto n° 130 no presentan ninguna colonia de *Staphylococcus aureus* y



forman sobre el agar una aureola libre de bacterias.

- Si en el ejemplo que acaba de describirse se lava a 95° C en vez de lavar a 45° C, se obtienen resultados semejantes, y además el compuesto n° 130 se puede reemplazar por los compuestos 1, 4 ó 20.
- 5.

La acción curativa (45° C de temperatura de lavado) se determina del modo siguiente:

- Se depositan sobre respectivas placas de agar ("Brain Heart Infusión Agar" + 0,1 % de levadura por litro de agar) cuatro redondeles tratados con uno de los compuestos citados antes y se incuban a 37° C. Al cabo de una hora se retiran los redondeles de dos placas y se incuban todas las cuatro cajas a 37° C durante 24 horas más.
- 10.

- Las dos placas de agar con los redondeles que han permanecido una hora se designan como placas de calco, y las placas con redondeles que han permanecido 24 horas se designan como placas de contacto duradero.
- 15.

Resultado:

- En ninguna de las placas de calco ni de las placas de contacto duradero existen colonias de *Staphylococcus aureus*.
- 20.

Si en lugar de redondeles de algodón se emplean re-



dondeles de nilón, se obtienen acciones curativas semejantes.

Indice de gérmenes del agua de lavado:

- Se deposita 0,1 cc del agua de lavado (lavado a 45° C) sobre placas de agar estériles ("Brain Heart Infusión Agar" + 0,1 % de levadura por litro de agar). Al cabo de 24 horas de incubación a 37° C, no se advierte en las placas ninguna colonia de Staphylococcus aureus, siempre que al agua de lavado se hayan añadido por litro 4 g de detergente que contenga 1 % de uno de los compuestos mencionados antes.
- 5.
- 10.

Ejemplo 12

- Los compuestos nº 21, 43, 109, 126 y 148 mostraron en el invernadero, por el procedimiento de premergencia y de postemergencia, las acciones siguientes:
- 15.





= 48 = 49 =



	2				2.5			4		5		
9	21	126	43	109	21	148	109	43	21	148	109	
7	9	3*	4	7	5	5	4	8	5	5	5	
4	9	3**	2	5	4	3	4	5	4	4	4	
6	9	6	3	8	5	5	7	8	6	6	5	
2*	5	1*	1*	4	3	2	1	4	3	3	3	
4	4	5	4	5	4	3	6	9	5	5	3	
5	9	9*	2	5	7	4	4	4	6	5	5	
5	4	4	3	5	4	4	4	4	7	5	5	
7**	9	8**	5	8	8	9	9	9	9	9	9	
7**	5	7**	3	9	7	9	8	9	9	9	9	
3	4	1	4	4	3	2	1	4	4	4	6	
-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
9	9	9**	3	9	3	9	9	9	9	7	9	
8**	3	3	1	9	2	6	5	9	9	2	7	
8**	9	5	2	9	7	9	7	9	9	9	9	
9**	9	9	3	9	7	3	4	9	9	8	9	
4	9	5	3	9	3	6	9	9	9	4	9	
9**	9	9**	9**	9	9	9	9	9	9	9	9	
5	9	9**	3	9	3	2	8	9	9	5	6	
1*	-	-	-	2	-	1	-	4	4	-	1	
-	9	9**	9**	-	9	-	9	-	-	9	-	
4	8	1*	2*	8	1	3	3	9	2	2	4	
7	1	2*	3*	8	1	-	3	8	1	1	-	
3	9	9**	9**	-	9	-	9	-	8	-	-	
9	-	9	9**	9	9	-	9	-	-	-	-	
5	9	5	5	5	3	6	6	6	5	7	7	
1	9	6	6	2	2	5	7	3	4	6	6	
1	9	7	5	1	3	5	8	3	4	4	9	
1	9	1	4	3	3	4	2	4	4	4	9	
3	9	9	9	4	4	9	9	9	9	9	9	
2	9	9	9	6	1	5	9	9	9	9	9	
2	9	9	6	7	1	3	4	9	9	9	9	
1	9	9	7	7	8	6	9	9	9	8	9	
6	8	7	7	7	7	7	9	9	9	8	9	
6	3	7	7	7	7	7	9	9	9	8	9	
2	4	2	5	3	2	4	4	4	4	3	4	
1	4	3	8	8	1	6	6	6	2	2	9	
5	9	9	9	9	7	9	4	9	9	9	9	
2	9	5	9	4	7	9	9	8	8	8	9	
3	9	9	9	4	6	9	9	7	9	9	9	
7	9	9	9	8	9	9	9	9	9	9	9	
5	9	9	9	9	4	9	9	9	9	9	9	
8	9	9	9	9	8	9	9	9	9	9	9	
3	9	8	8	9	7	9	9	9	9	9	9	
3	9	8	8	9	7	9	9	9	9	9	9	
2	-	-	-	-	-	-	-	-	8	8	9	
-	9	9	9	9	9	1	7	9	9	6	9	
4	9	5	9	9	9	7	7	9	9	6	9	
4	9	8	9	9	9	-	-	9	9	6	9	
-	9	9	9	9	9	-	-	-	-	9	9	



El compuesto nº 126 manifestó en el ensayo en el campo, por el procedimiento de antefoliación, las acciones siguientes:

	<u>Cantidad de aplicación</u> (kg de SA por ha)	0.5	1.0	2.0
5.	Malas hierbas:			
	Galinsoga	6	8++	9
	Urtica	7++	8++	9
	Amaranthus	7++	9++	9
	Chenopodium	7++	9++	9
10.	Senecio	8++	-	9
	Plantas de cultivo:			
	Gramma de centeno	3	4	6
	Algodón	1+	1+	3
	Habichuela enana	1+	2+	2
15.	Trigo	1+	1+	1
	Soja	1+	1+	1
	Maiz	1+	1+	1

Leyendas:      1 = ninguna acción  
                   5 = daños medianos  
                   9 = planta totalmente dañada

20.                Para las plantas de cultivo designadas con<sup>+</sup> es posible una aplicación selectiva del preparado correspondiente en las preparaciones respectivas; mientras que las malas hierbas designadas con<sup>++</sup> son sensibles.



Ejemplo 13

Prueba quimioesterilizante

Se introducen 50 moscas, recién nacidas y todavía no alimentadas, en una jaula de plástico de 17 x 10 x 10 cm, que contiene un bebedero de agua y una bandeja de papel con 50 mg del preparado de ensayo, formulado con azúcar. La formulación de azúcar se hace depositando con la pipeta 1 cc de una solución acetónica al 1 % sobre 500 mg de azúcar cristalino, en un mortero, y triturando con la mano de almirez. Después de evaporar el disolvente, se vuelve a triturar una segunda vez el residuo de azúcar y materia activa y se le pulveriza.

Al cabo de tres días de exposición, las moscas reciben un alimento energético compuesto de huevo en polvo, leche en polvo y azúcar.

A los 10 días de iniciada la prueba, las moscas reciben el elemento para la postura de los huevos. Este consiste en un tampón de guata que está empapado de una suspensión de levadura en leche desnatada. Los huevos puestos en el curso de 15 horas se enjuagan y se captan sobre rondelles de papel de filtro. Se los mantiene durante 24 horas en una caja de Petri, cubiertos. Luego se recuentan bajo el microscopio binocular los huevos que han tenido eclosión y los que no han tenido eclosión y se calcula el índice de eclosión porcentual.



El compuesto nº 56 dió aquí los resultados siguientes:

	Concentración, ‰	% de huevos sin eclosión
	1	93
5.	0.1	86
	0.05	83

Se obtiene una acción semejante con los compuestos nº 6, 17, 18, 99 y 100.

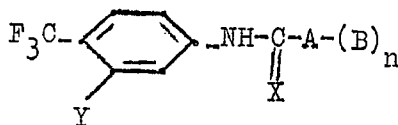


N O T A

Descrito el objeto del presente invento se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones con prioridad de las demandas de patentes suizas núms. 14462/67 del 17-10-67, el nº 15963/67 del 15-11-67 y el nº del 26-9-68.

5.

1. Procedimiento para la preparación de las materias activas para agentes biocidas, que corresponden a la fórmula general



10.

en la que

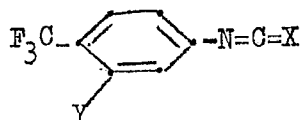
- Y significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o yodo;
- A y X significan oxígeno o azufre;
- B significa un radical hidrocarburo, eventualmente interrumpido por uno o más heteroátomos, en cuyo caso  $n = 1$ ;  
o bien
- A significa oxígeno,
- B significa la agrupación  $-N=C$  (with a double bond to a carbon atom that has two other bonds), en cuyo caso  $n = 1$ ;  
o bien

20.



A significa un grupo amínico, sustituido o insustituido, en cuyo caso  $n = 0$ , caracterizado por hacerse reaccionar un isocianato de la fórmula

5.



en la que

X e Y tienen el significado que se ha definido en la reivindicación 1,

10.

a) con un alcohol o tioalcohol alifático, aralifático, aromático o hetero cíclico;

o bien

b) con una amina alifática, aralifática, aromática, o heterocíclica;

15.

o bien

c) con una oxima, alquilhidroxilamina o hidroxilamina,

en cuyo caso el producto de reacción de la hidroxilamina se puede hacer reaccionar todavía, eventualmente, con agentes de alquilación.

20.

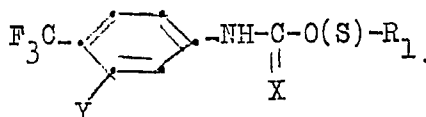
2. Procedimiento según la reivindicación 1, que en una alternativa de realización se caracteriza por hacerse reaccionar, en lugar de los isocianatos, los respectivos haluros de ácido carbámico, preferentemente en presencia de un aceptor de haluro de hidrógeno.

25.



3. Procedimiento según la reivindicación 1 y 2, caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula general

5.



en la que

X e Y tienen el significado que ya se ha definido,

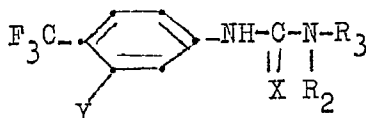
mientras que

10.

R<sub>1</sub> significa un radical alifático, aralifático, aromático o heterocíclico (eventualmente, substituido).

4. Procedimiento según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula

15.



en la que

X e Y tienen el significado que ya se ha definido;

20.

R<sub>2</sub> representa hidrógeno, el grupo hidroxílico o alcóxílico, un grupo acílico o un grupo alifático;

y

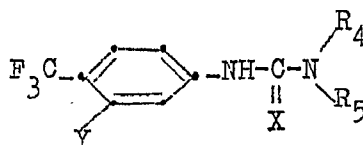
R<sub>3</sub> significa un grupo alifático, aralifático, aro-



mático o heterocíclico (eventualmente, substituido); o bien

5.  $R_2$  y  $R_3$ , junto con el átomo de nitrógeno unido a ellos, significa un heterociclo de 5 a 7 miembros, con la condición de que ambos radicales  $R_2$  y  $R_3$  (cuando  $Y = H$ ) no deben representar al mismo tiempo radicales metílicos.

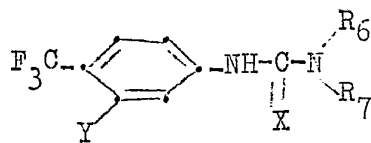
5. Procedimiento según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula



en la que

- X e Y tienen el significado ya definido;
15.  $R_4$  representa hidrógeno, el radical hidroxílico o alcoxílico o un radical alifático; y
- $R_5$  representa un radical alifático, con la condición de que ambos radicales  $R_4$  y  $R_5$  (cuando  $Y = H$ ) no deben representar al mismo tiempo radicales metílicos.
- 20.

6. Procedimiento según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula

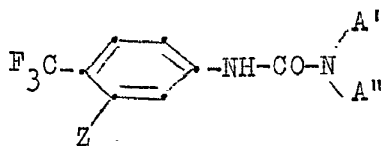


en la que

X e Y tienen el significado ya definido;

5.  $R_6$  representa hidrógeno; y  
 $R_7$  representa un radical fenílico o fenilalquílico, eventualmente substituido, así como sus aductos de dimetilformamida o de 2-hidroxi-4,6-dimetil-pirimidina.

10. 7. Procedimiento según las reivindicaciones 1 y 2 caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula



15. en la que  
Z representa hidrógeno o cloro;  
A' representa hidrógeno o metilo;  
A'' representa un radical alquílico, alquenílico o alquinílico con 1 a 8 átomos de carbono, el radical metoxílico o un radical acílico con 1 a 4 átomos de carbono;  
o bien el radical
- 20.

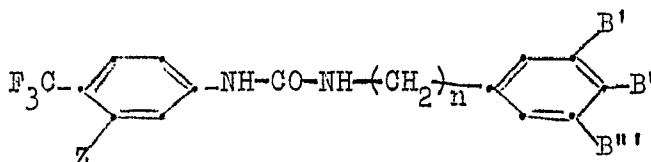


representa el radical morfolínico o isomorfolínico,

con la condición de que ambos radicales A' y A'' (cuando Y = H) no deben representar al mismo tiempo radicales metálicos.

5.

8. Procedimiento según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula



10.

en la que

Z representa hidrógeno o cloro;

B' significa hidrógeno, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>3</sub>, -Cl o -Br;

B'' significa hidrógeno, -CF<sub>3</sub>, -Cl, -Br, -NO<sub>2</sub> o el radical p-nitro-fenoxílico;

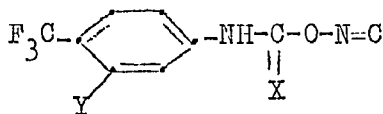
15.

B''' tiene el mismo significado que B'; y

n representa 0 o 1.

20.

9. Procedimiento según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque la materia activa corresponde a un compuesto de la fórmula



en la que

X e Y tienen el significado que ya se ha definido y en la agrupación

5.

$\text{N}=\text{C}$  una a lo menos de las dos valencias libres está saturada con un radical alifático, aralifático o aromático y la otra valencia está también saturada con hidrógeno;

10.

o bien ambas valencias pueden estar cerradas con el carbono formando conjuntamente un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 a 7 miembros.

15.

10. Procedimiento para la preparación de las materias activas para agentes biocidas.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de 59 páginas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 16 de Octubre de 1.968

p.a.

JAIMÉ ISERN

p. p.

Firmado: JOSÉ RODRIGUEZ