

309221



PATENTE DE INVENCION

1969

Le A 11 590-Sp.

*Memoria Descriptiva*

sobre:

SECCION TECNICA
REGISTRACION I. P. C.
CLASE <u>C-07</u> <u>A-01</u>
SUBCLASE <u>C</u> <u>N</u>

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE FLUOR-  
ACETILAMINOTRICLOROMETILMETANOETERES.

*Solicitante*

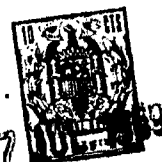
FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT,  
entidad alemana, residente en :  
LEVERKUSEN-BAYERWERK, Alemania.

La presente invención se refiere a un proce-  
dimiento para la obtención de nuevos fluoracetilamino-  
triclorometilmetanoéteres que tienen propiedades insec-  
ticias, acaricidas y rodenticidas selectivas.

5.

Ya es sabido que los fluoracetilaminotricloro

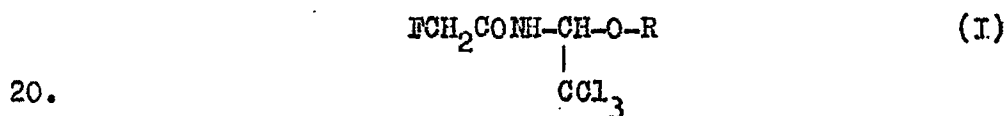
**POOR  
QUALITY**



metanoariltioéteres, por ejemplo, p-clorofenil- y p-me-  
tilmercaptofenil-ticéteres, se pueden emplear como agen-  
tes insecticidas y acaricidas (véase la patente inglesa  
nº 993.052).

- 5. Ya se ha dado a conocer que para combatir los ratones de rabo corto se pueden emplear los rodentici-  
das, tales como monofluoracetato de sodio, monofluorace-  
tamida, 1,2,3,4,10,10-hexacloro-oxo,6,7-epoxi-1,4,4a,5,  
6,7,8,8a-octahidro-1,4,5,8-endo,endo-dimetancnaftalina,  
10. canfeno clorado y 2-cloro-4-metil-6-dimetilaminopirimi-  
dina. Estas sustancias son, por lo general, igual de tó-  
xicas para todos los animales de sangre caliente, es de-  
cir, por ejemplo, también para los pájaros útiles y re-  
presentan, al ser empleados contra los ratones de rabo  
15. corto, un serio peligro para la comunidad de los anima-  
les silvestres.

Se ha descubierto que los nuevos fluoracetil-  
aminotriclorometilmetanoéteres de fórmula:

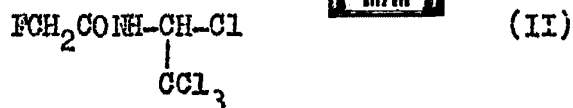


- 25. en la que R significa un alquilo inferior, en caso dado halogenado, con 2 - 6 átomos de carbono, arilo, en caso dado simple o varias veces sustituido por halógeno, ni-  
tro, nitrilo, rodano, alquilo inferior-mercapto, alqui-  
lo inferior-sulfonilo o alquilo inferior, tiene fuertes  
propiedades insecticidas, acaricidas y rodenticidas se-  
lectivas.

- 30. También se ha descubierto que se obtienen los fluoracetilaminotriclorometilmetanoéteres de fórmula (I), si un fluoracetilaminotriclorometilclorometano de



fórmula:



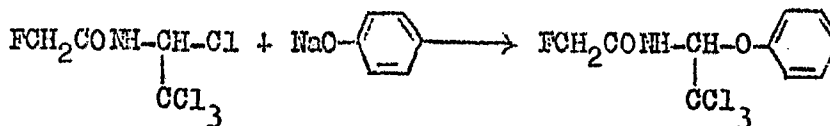
se hace reaccionar con compuestos de fórmula:



en la que R tiene el significado anteriormente indicado y Me significa hidrógeno o un metal alcalino, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido.

10. Es de considerar como extraordinariamente sorprendente que los fluoracetilaminotriclorometilmetano-éteres que se obtienen según la presente invención sean superiores a los fluoracetilaminotriclorometilmetano-ariltioéteres previamente conocidos con respecto a su eficacia insecticida y acericida y a los rodenticidas conocidos con respecto a sus propiedades rodenticidas selectivas.

15. La reacción según la presente invención se puede representar al emplear fenolato sódico como componente de reacción, mediante el siguiente esquema de fórmulas:



(IV)

20. Los productos de partida a emplear, ya son conocidos. Los alcoholes y tiofenoles a emplear como participantes en la reacción están claramente caracterizados por la fórmula III. En esta fórmula, R significa preferentemente alquilo con 1 - 4 átomos de carbono,

25.



cloroalquilo con 2 - 4 átomos de carbono y fenilo, en caso dado sustituido por cloro, nitro, alquilo con 1 - 2 átomos de carbono, alquilmercapto con 1 - 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 - 2 átomos de carbono, nitrilo y rodano. Me significa preferentemente, hidrógeno, sodio o potasio.

La reacción según la presente invención, se efectúa convenientemente en presencia de diluyentes que se pueden variar según los participantes en la reacción.

10. Como diluyentes entran esencialmente en consideración: los hidrocarburos, tales como bencina y benceno, los hidrocarburos clorados, tales como tetracloruro de carbono y clorobenceno, los éteres, tales como dioxano, las cetonas, tales como acetona, los alcoholes, tales como metanol y los disolventes altamente polares, tales como acetonitrilo.

15. Si se emplean los fenoles y los alcoholes en forma de sus sales entonces no es necesario emplear aceptores de ácido.

20. Las temperaturas de reacción se pueden variar dentro de un cierto margen. Por lo general se trabaja entre -20 y +60°C, preferentemente entre 15 y 50°C.

Para la realización del procedimiento de la presente invención se emplean cantidades equimolares de los productos de partida. El empleo en exceso de uno y otro participante en la reacción no aporta ninguna ventaja especial.

25.

La reacción se efectúa en la forma usual, reuniendo los componentes de reacción, convenientemente empleando un diluyente. La elaboración se efectúa en la

30.



forma usual, por ejemplo, por filtración y ulterior concentración por evaporación del filtrado.

- Las sustancias activas según el invento muestran, en combinación con una baja toxicidad para animales de sangre caliente y con una baja fitotoxicidad, fuertes efectos insecticidas y acaricidas. Los efectos comienzan rápidamente y son de larga duración. Por ello, pueden ser aplicados con buen éxito para combatir insectos nocivos chupadores y mordedores, dípteros, así como ácaros tanto en el campo de la protección de las plantas, como también<sup>en</sup> el sector de la higiene y en la medicina veterinaria.
- 5.
- 10.

- A los insectos chupadores pertenecen esencialmente piojuelos o pulgones, tales como el pulgón de durazneros (*Myzus persicae*), el pulgón negro de habas (*Doralis fabae*), cochinillas, tales como *Aspidiotus hederae*, *Lecanium hesperidum*, *Pseudococcus maritimus*; tisanópteros, tales como *Hercinothrips femoralis*; y chinches, tales como la chinche de remolacha (*Piesma quadrata*) y la chinche de cama (*Cimex lectularius*).
- 15.
- 20.

- A los insectos mordedores cuentan esencialmente las orugas de mariposas, tales como *Plutella maculipennis*, *Lymantria dispar*; coleópteros, tales como el gorgojo (*Sitophilus granarius*), la dorifora (*Leptinotarsa decemlineata*), pero también las especies que habitan en el suelo, tales como larvas de eláteros (*Agriotes spec.*) y larvas de abejorros (*Melolontha melolontha*); cucarachas, tales como la cucaracha alemana (*Blattella germanica*), ortópteros, tales como el grillo (*Acheta domesticus*), comejenes, tales como *Reticulitermes*,
- 25.
- 30.



himenópteros, tales como hormigas?

5. Los dípteros comprenden particularmente las moscas, tales como la mosca de bagazo de manzanas (*Drosophila melanogaster*), la mosca de frutas del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*), la mosca doméstica (*Musca domestica*) y mosquitos, tales como el mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*).

10. En cuanto a los ácaros, son particularmente importantes los ácaros hiladores (*Tetranychidae*), tales como el ácaro hilador común (*Tetranychus urticae*) el ácaro hilador de frutales (*Panonychus ulmi*), ácaros de agallas, tales como el ácaro de agalla de groselleros (*Eriophyes ribis*) y tarsonemidos, tales como *Tarsonemus pallidus*, así como aradores (*Ixodidae*), tales como la garrapata australiana y sudamericana de las reses (*Boophilus microplus*).

20. Las sustancias de la presente invención muestran también propiedades rodenticidas selectivas y son por lo tanto, especialmente adecuadas para combatir los perjudiciales ratones de cola corta (*Microtinae*).

Entre éstos se encuentran, por ejemplo, el ratón silvestre (*Microtus arvalis*), el ratón de tierra (*Microtus agrestis*), el ratón cavador grande (*Arvicola terrestris*) y la rata almizclera (*Ondatra zibethica*).

25. En comparación con otros animales de sangre caliente, tales como pájaros útiles y animales caseros, las sustancias activas son de menor toxicidad. Esto vale también para los roedores no pertenecientes al grupo de los ratones de cola corta.

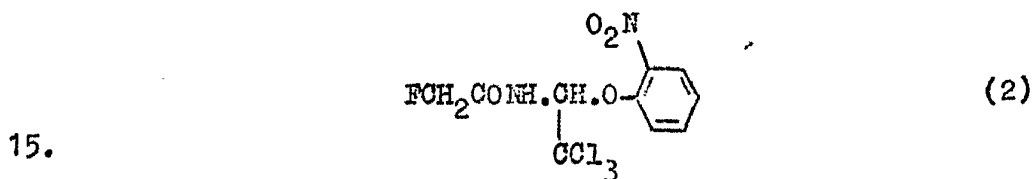
30. Las sustancias activas según el invento, pueden





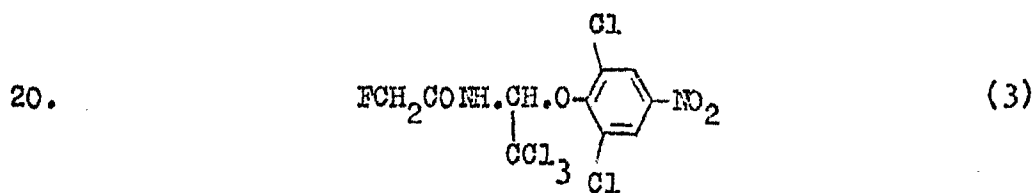


- 72 g (3/10m) de fluoracetilaminotriclorometil  
clorometano se disuelven en 150 cc de acetonitrilo y, a  
20-25°C, se mezcla, en porciones con 35 g (3/10m) de fe  
nolato sódico. La reacción es exotérmica. La mezcla de  
5. reacción se agita durante la noche a temperatura ambien  
te. Después de aspirar del cloruro de sodio que se ha  
formado se recoge en cloroformo y se lava con agua. La  
fase orgánica se seca sobre cloruro de calcio y se con  
centra por evaporación.
10. Queda como residuo unos cristales de p.f. 70°.   
Rendimiento 37 g = 41 % de la teoría.   
En forma análoga se obtienen:



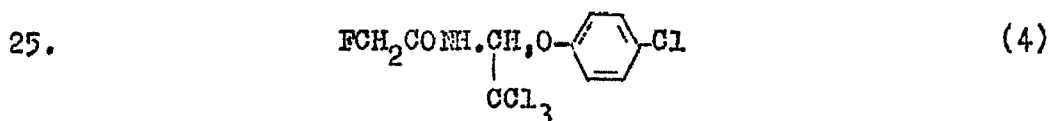
Rendimiento: 11,5 % de la teoría (M = 345,5)

Análisis : calculado para  $\text{C}_{10}\text{H}_8\text{N}_2\text{O}_4\text{FCl}_3$  N 8,19 %  
hallado 7,39



p.f. 112 °

Rendimiento : 35% de la teoría.



Rendimiento : 30 % de la teoría.



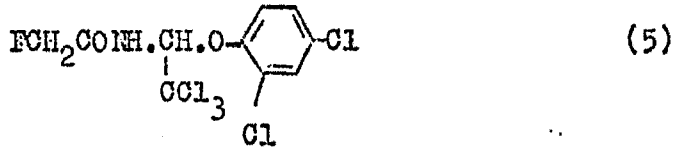
7 JUL 1933

Análisis:

Calculado para:  $C_{10}H_8NO_2FCl_4$  (M=335) N 4,18% Cl 42,40%

Hallado : 3,99% 39,88%

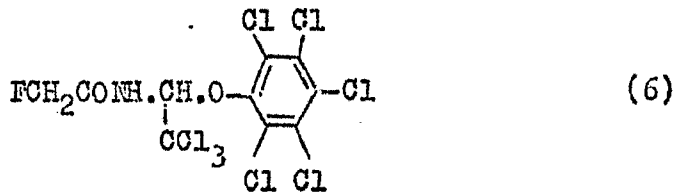
5.



p.f. 88°

Rendimiento: 81 % de la teoría.

10.

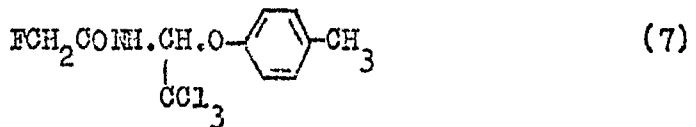


Rendimiento: 14,5 % de la teoría.

Análisis%

15. Calculado para:  $C_{10}H_4O_2Cl_8NF$  (M = 473) N 2,96%

Hallado : 3,69%



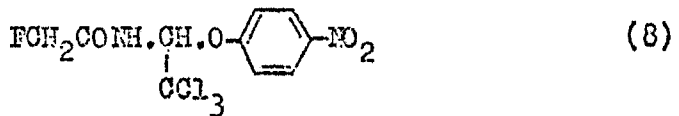
Rendimiento: 64 % de la teoría.

20.

Análisis:

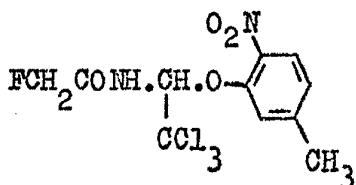
Calculado para:  $C_{11}H_{11}O_2NCl_3F$  (M=314,5) N 4,46% Cl 33,9%

Hallado : 4,70% 34,86



25. Rendimiento: 29 % de la teoría.

p.f. 122°.



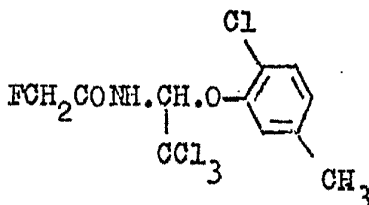
(9)

Rendimiento: 70 % de la teoría.

5. Análisis:

Calculado para:  $\text{C}_{11}\text{H}_{10}\text{O}_4\text{NCl}_2\text{F}$  (M=359,5) N 7,80% Cl 29,7%

Hallado : 7,53 29,45

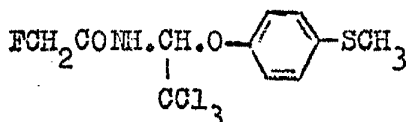


(10)

10.

Rendimiento: 42 % de la teoría.

P.f. 76°.

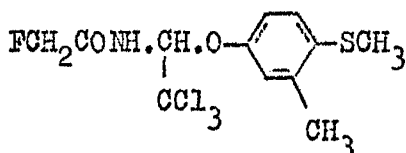


(11)

15.

Rendimiento: 52 % de la teoría.

P.f. 102°.

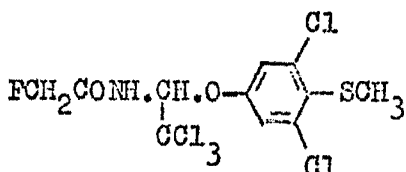


(12)

20.

Rendimiento: 14 % de la teoría.

P.f. 82°.

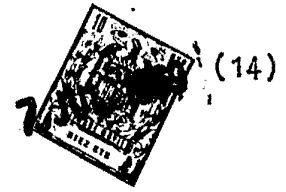
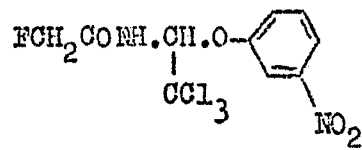


(13)

25.

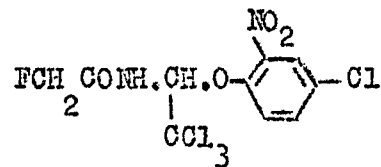
Rendimiento: 19,5 % de la teoría.

P.f. 78°.



Rendimiento: 67 % de la teoría.

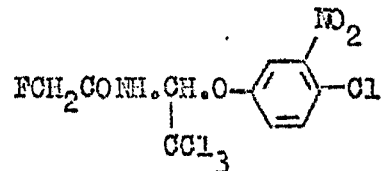
5.



(15)

Rendimiento: 58 % de la teoría.

10.

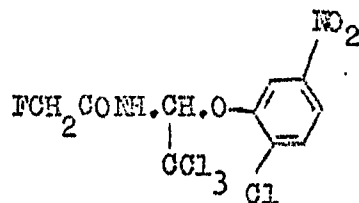


(16)

Rendimiento: 71 % de la teoría.

P.f. 63°.

15.

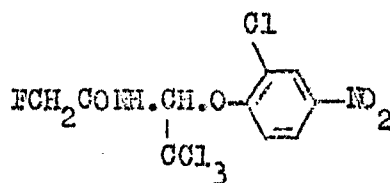


(17)

Rendimiento: 57 % de la teoría.

P.f. 92°.

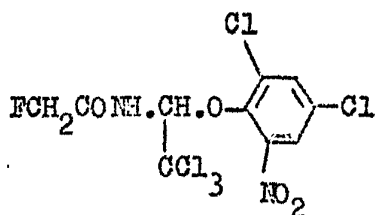
20.



(18)

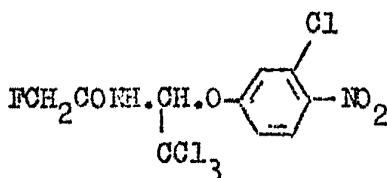
Rendimiento: 70 % de la teoría.

P.f. 106° .



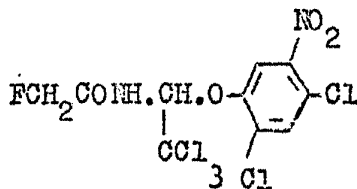
(19)

5. Rendimiento: 56,4 % de la teoría.  
P.f. 76°.



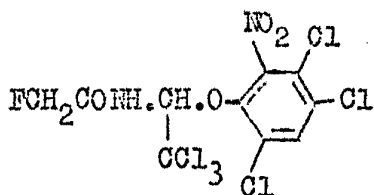
(20)

10. Rendimiento: 60 % de la teoría.  
P.f. 86°.



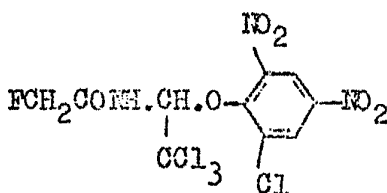
(21)

15. Rendimiento: 70,5 % de la teoría.  
P.f. 98°.



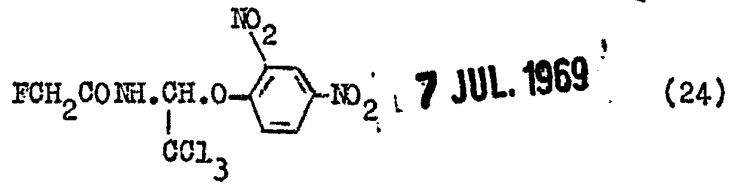
(22)

20. Rendimiento: 80 % de la teoría.  
P.f. 80°.



(23)

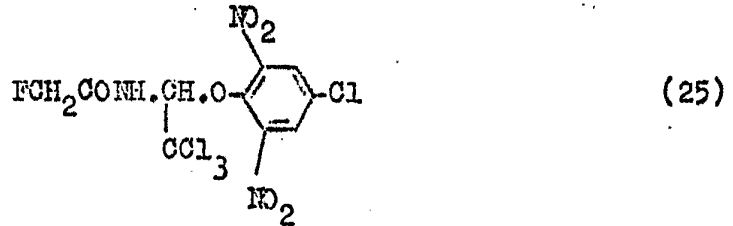
25. Rendimiento: 69 % de la teoría.  
P.f. 78°.



7 JUL. 1969

Rendimiento: 52 % de la teoría.

5. P.f. 100°.



10. P.f. 131°.

Análisis:

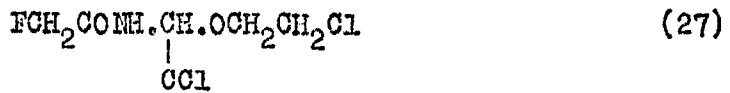
Calculado para: C<sub>10</sub>H<sub>6</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>Cl<sub>4</sub>F (M=425) N 9,88% Cl 33,45%

Hallado : 9,90 34,13

15.



Rendimiento: 37,3 % de la teoría.



Rendimiento: 35 % de la teoría.

20. P.f. 64°.

EJEMPLO A -

Ensayo con Plutella.

Disolvente : 3 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsivo : 1 parte en peso de alquilarilpoliglicol-éter.

25.

Para obtener una preparación apropiada de sustancia activa, se mezcla una parte en peso de sus-



tancia activa con la cantidad indicada de disolvente que contiene la cantidad indicada de emulsivo, y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

5. La preparación de sustancia activa es pulverizada sobre hojas de repollo (*Brassica oleracea*) hasta su humectación al grado de rocío y sobre las mismas se colocan orugas del arañuelo de las coles.

10. Al cabo del tiempo indicado, se determina el grado de destrucción en %, significando los 100 % que fueron matadas todas las orugas, mientras que 0 % indica que no fue matada ninguna oruga.

15. Las sustancias activas, las concentraciones de las sustancias activas, el tiempo de evaluación y los resultados surgen de la tabla siguiente:



T A B L A .

(Insectos perjudiciales para las plantas)

Ensayo con Plutella.

Sustancias activas	Concentra- ción de la sustancia activa en %.	Grado de destruc- ción en % al cabo de 3 días
$\text{F-CH}_2\text{-CO-NH-CH-S-} \begin{array}{c} \text{---} \\   \\ \text{CCL}_3 \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4\text{-Cl}$ <p>(conocido)</p>	0,2 0,02	100 0
$\text{F-CH}_2\text{-CO-NH-CH-S-} \begin{array}{c} \text{---} \\   \\ \text{CCL}_3 \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4\text{-SCH}_3$ <p>(conocido)</p>	0,2 0,02	20 0
(26)	0,2 0,02	100 100
(27)	0,2 0,02	100 60
(1)	0,2 0,02	100 75
(4)	0,2 0,02	100 100
(5)	0,2 0,02	100 100
(6)	0,2 0,02	100 95
(8)	0,2 0,02 0,002	100 100 80
(14)	0,2 0,02	100 90
(7)	0,2 0,02	100 100

7 JUL. 1969

Sustancias activas	Concentra ción de la sustancia activa en %.	Grado de destruc- ción en % al cabo de 3 días
--------------------	---	---

---

(11)	0,2 0,02	100 85
(10)	0,2 0,02	100 95
(13)	0,2 0,02	100 100
(9)	0,2 0,02	100 95
(18)	0,2 0,02	100 90
(20)	0,2 0,02	100 100
(3)	0,2 0,02	100 100
(15)	0,2 0,02	100 100
(16)	0,2 0,02	100 95
(17)	0,2 0,02	100 90
(21)	0,2 0,02	100 100
(19)	0,2 0,02	100 100
(22)	0,2 0,02	100 100

---

EJEMPLO B -



Ensayo con Tetranychus -

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsivo : 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

5. Para obtener una preparación apropiada de sustancia activa, se mezcla una parte en peso de sustancia activa con la cantidad indicada de disolvente que contiene la cantidad indicada de emulsivo, y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración indicada.
10. La preparación de sustancia activa es pulverizada sobre plantas de chauchas (*Phaseolus vulgaris*) de una altura de aproximadamente 10 a 30 cm, hasta su mojadura a tal grado que el líquido gotea de las mismas. Estas plantas están fuertemente atacadas por el ácaro hilador común (*Tetranychus urticae*) en todos sus estados de desarrollo.
15. Al cabo del tiempo indicado, se determina la eficacia de la preparación de sustancia activa, contando los ácaros muertos. El grado de destrucción así obtenido es expresado en %, significando 100 % que fueron matados todos los ácaros hiladores, y 0 % que no fue matado ningún ácaro hilador.
20. Las sustancias activas, las concentraciones de las sustancias activas, el tiempo de evaluación y los resultados surgen de la siguiente tabla.
- 25.



T A B L A 7 JUL. 1969

(ácaros nocivos para plantas).

Ensayo con Tetranychus.

Sustancias activas	Concentraciones de las sustancias activas en %.	Grado de destrucción en % al cabo de 48 horas
$\text{F-CH}_2\text{-CO-NH-CH-S-} \begin{array}{c}   \\ \text{CCl}_3 \end{array} \text{-} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{---} \\ \text{SCH}_3 \end{array}$ (conocido)	0,2 0,02	50 0
(26)	0,2	80
(1)	0,2	90
(4)	0,2 0,02	100 45
(5)	0,2	95
(6)	0,2	100
(7)	0,2	80
(13)	0,2	95
(3)	0,2	100
(15)	0,2	90
(22)	0,2	100
(14)	0,2	85

1969

Sustancias activas	Concentraciones de las sustancias activas en %	Grado de destrucción en % al cabo de 48 horas.
$\text{F-CH}_2\text{CO-NH-CH-S-} \begin{array}{c} \text{---} \\   \\ \text{CCl}_3 \end{array} \text{---} \text{SCH}_3$ <p>(conocido)</p>	<p>0,2 0,02</p>	<p>50 0</p>
(26)	0,2	80
(1)	0,2	90
(4)	<p>0,2 0,02</p>	<p>100 45</p>
(5)	0,2	95
(6)	0,2	100
(7)	0,02	80
(13)	0,2	95
(3)	0,2	100
(15)	0,2	90
(22)	0,2	100
(14)	0,2	85



EJEMPLO C -

Ensayo de toxicidad/peroral.

	<u>Animal de ensayo :</u>	<u>Evaluación después de</u>
	Ratón silvestre (Microtus arvalis)	3 días
5.	Rata albina (Ratus norvegicus)	7 días
	Ratón albino (Mus masculus)	3 días
	Paloma casera (Columba livia)	7 días

Para la obtención del preparado de sustancia activa adecuado, se mezclan 3 partes en peso de sustancia activa con 2,8 partes de ácido silícico altamente disperso y 4,2 partes en peso de talco. Bajo adición de algo de goma vegetal pulverizada se prepara a partir de este concentrado de sustancia activa, frotando con agua, unas suspensiones que en 1 cc de líquido contienen la cantidad de sustancia activa a aplicar por 100 g de peso del animal. La dosificación se efectúa después de pesar a los animales de ensayo volumétricamente. Se aplica mediante una sonda de acero o un cateto de material sintético per os. La evaluación se efectúa cada vez después de transcurrido el período de tiempo arriba indicado, calculado a partir de la aplicación de la sustancia activa.

La determinación de los valores LD<sub>50</sub> (dosis de sustancia activa con la que se mata un 50 % de los animales tratados) se efectúa en la forma usual de los valores de mortalidad de dosis variadas en progresión geométrica.

Las sustancias activas, los valores LD<sub>50</sub> y los animales de ensayo se desprenden de la tabla a continuación. Los valores indicados con índices se han

tomado de la literatura. Significan:



- 1) HÜTER, F  
Anz. Schädlingskde. XXV, S. 137-140 (1952)
- 2) HÜTER, F.  
Anz. Schädlingskde. XXIV, S. 23-26 (1951)
5. 3) SPECTOR, W.S.  
Handbook of Toxicology Vol. I, W.B. Saunders Comp.
- 4) BROOKS, J.E.  
International Pest Control 5, H.6, S. 21-22 (1963)
10. 5) BUCKLE, F.J., HEAP, R. u. SAUNDERS, B.C.  
J. Chem. Soc., S. 912 (1949)
- 6) STEINER, P. u. GRUCH, W.  
Mitt. Biol. Bundesanst. f. Land- u. Forstwirtsch.,  
H. 95 (1959)
15. 7) GRUCH, W. u. STEINER, P.  
Mitt. Biol. Bundesanst. für Land- und Forstwirtsch.,  
H. 102 (1960)
- 8) DuBOIS, K.P.; COCHRAN, K.W. u. THOMSON, J.F.  
Proc. Soc. exper. Biol. a. Med. 67, S.169-171 (1948)
20. 9) GYLSTORFF, J.  
Bayer. Landwirtsch. Jahrbuch 39, H. 1, S. 19-32  
(1962)



T A B L A .

Ensayo de toxicidad peroral.

Sustancia activa	Valores LD <sub>50</sub> (en mg/kg peso del cuerpo)			
	Ratón sil- vestre	Rata albina	Ratón albino	Paloma casera
Monofluoracetato de sodio..	5	5-7 <sup>1)</sup>	8-10 <sup>2)</sup>	2,5-9 <sup>3)</sup>
Monofluoracetamida .....	15	15 <sup>4)</sup>	6-10 <sup>5)</sup>	-
1,2,3,4,10,10-hexacloro-exo- 6,7-epoxi-1,4,4a,5,6,7,8,8a- octahidro-1,4,5,8-endo-endo- dimetannaftalina .....	8	7,3 <sup>6)</sup>	8	-
Canfeno clorado .....	90 <sup>7)</sup>	90-125 <sup>7)</sup>	112 <sup>7)</sup>	200-250 <sup>7)</sup>
2-cloro-4-metil-6-dimetil- aminopirimidina .....	2	1-2 <sup>8)</sup>	1-2 <sup>8)</sup>	ca. 4 <sup>9)</sup>
(1)	< 10	75	> 1000	700
(7)	4	105	-	80
(12)	5	> 300	-	> 2000
(10)	8	375	> 1000	350
(9)	5	150	-	80
(5)	5	> 300	> 1000	350
(2)	7	> 150	> 1000	80
(8)	3,5	150	> 1000	> 500
(11)	7	210	> 1000	180
(13)	5	265	-	80

EJEMPLO D -

Ensayo con garrapatas.



- Disolvente: 35 partes en peso de etilglicolmonometiléter  
Emulsivo : 35 partes en peso de nonilfenolpoliglicoléter
5. Para preparar una formulación adecuada, se mezclan 3 partes en peso de sustancia activa con 7 partes de la mezcla de disolvente-emulsivo arriba mencionado y el concentrado de emulsivo así obtenido se diluye con agua a la concentración deseada en cada caso.
10. En este preparado de sustancia activa se sumergen hembras de garrapatas adultas, de la clase *Boophilus microplus* (sensibles o bien resistentes) durante 1 minuto. Después de sumergir cada vez 10 hembras de las garrapatas sensibles o bien resistentes se llevan éstas a bandejas de material sintético cuyo fondo está cubierto de un disco de papel filtrante de tamaño correspondiente. Después de 35 días se determina la eficacia del preparado de sustancia activa mediante recuento de la inhibición de la puesta de huevos en comparación con garrapatas de testigo sin tratar. El efecto inhibitor se expresa en % significando 100 % que ya no se pusieron huevos y 0 % indica que las garrapatas pusieron huevos en cantidad normal.
15. Las sustancias activas comprobadas, las concentraciones ensayadas y los resultados obtenidos se desprenden de la tabla a continuación.
- 20.
- 25.



T A B L A

Ensayo con garrapatas

Sustancia activa	Concentra- ción de sus- tancia ac- tiva en la emulsión %	Inhibición de la puesta de huevos en %	
		Sensibles	Resistentes
$\text{F-CH}_2\text{CONH-CH-S-} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_5 \\   \\ \text{CCl}_3 \end{array}$ <p>(conocido)</p>	0,5	0	0
$\text{F-CH}_2\text{CONH-CH-O-} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4\text{-Cl} \\   \\ \text{CCl}_3 \end{array}$	1,0 0,3 0,1 0,03	100 100 > 50 0	100 > 50 > 50 > 50
$\text{F-CH}_2\text{CONH-CH-O-} \begin{array}{c} \text{O}_2\text{N} \\   \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{-CH}_3 \\   \\ \text{CCl}_3 \end{array}$	1,0 0,3 0,1 0,03	100 100 > 50 < 50	100 100 > 50 < 50
$\text{F-CH}_2\text{CONH-CH-O-} \begin{array}{c} \text{O}_2\text{N} \\   \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{-Cl} \\   \\ \text{CCl}_3 \end{array}$	1,0 0,3 0,1	100 100 > 50	100 > 50 < 50
$\text{F-CH}_2\text{CONH-CH-O-} \begin{array}{c} \text{NO}_2 \\   \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{-Cl} \\   \\ \text{CCl}_3 \end{array}$	1,0 0,3 0,1	100 100 > 50	100 > 50 < 50
$\text{F-CH}_2\text{CONH-CH-O-} \begin{array}{c} \text{Cl} \\   \\ \text{C}_6\text{H}_2\text{-SCH}_3 \\   \\ \text{CCl}_3 \\   \\ \text{Cl} \end{array}$	1,0 0,3 0,1	100 > 50 < 50	100 > 50 < 50

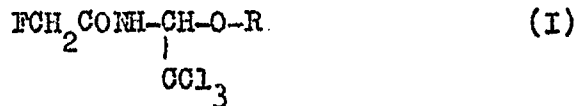


- N O T A -

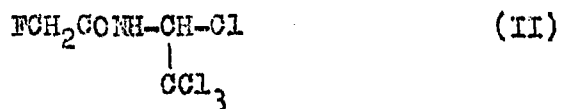
Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas, son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de patente presentada en Alemania con fecha 9 de julio de 1968, bajo el nº P 17 68 864.1,

- 5. acogiéndose por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención, por 20 años en España:
- 10. PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE FLUORACETILAMINOTRICLOROMETILMETANOETERES; caracterizándose por lo siguiente:
- 15.

1ª.- Procedimiento para la obtención de fluoracetilaminotriclorometilmetanoéteres, de fórmula:



- 20. en la que R significa alquilo inferior, en caso dado, halogenado, con 2 - 6 átomos de carbono, arilo, en caso dado, sustituido simple o varias veces por halógeno, nitró, nitrilo, rodano, alquilo inferior-mercapto, alquilo inferior-sulfonilo o alquilo inferior, caracterizado por
- 25. que el fluoracetilaminotriclorometilclorometano de fórmula:



se hace reaccionar con compuestos de fórmula:



Me-O-R

(III)

en la que R tiene el significado anteriormente indicado y Me significa hidrógeno o un metal alcalino, en presencia de disolventes orgánicos inertes, a temperaturas entre 0 y 100°C.

5.

2ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado porque como disolventes orgánicos se emplean benceno, tolueno o xileno.

10.

3ª.- Procedimiento según las reivindicaciones 1ª y 2ª, caracterizado porque la reacción se efectúa en presencia de un aceptor de ácido.

4ª.- Procedimiento según la reivindicación 3ª, caracterizado porque como aceptor de ácido se emplea hidróxido sódico o potásico, carbonato sódico o potásico.

15.

5ª.- Procedimiento para la obtención de fluoracetilaminotriclorometilmetanoéteres; tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de veintisiete hojas, escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

7 JUL. 1969

FABRIKATION BAYER AKTIENGESELLSCHAFT,

A. GOMEZ ACEBO Y MOLERO  
Firma Firmador F. Hernández Ruiz