

384014
PATENTE DE INVENCION

Le A 12 442-Sp

SECCION TECNICA
CLASIFICACION I. P. C.
CLASE 607 A01
SUBCLASE c M



Memoria Descriptiva

sobre:

384014

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE BISTRIAZOLIL
-BISFENIL-METANOS.

Solicitante: FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT., entidad
alemana, residente en Leverkusen-Bayerwerk,
Alemania.

1

La presente invención se refiere a nuevos bistriazolil-bisfenil-metanos y sus sales, que tienen propiedades reguladoras del crecimiento de plantas, así como a un procedimiento para su preparación.

5

Ya se ha dado a conocer que, para la regulación del crecimiento de plantas altas, pueden utilizarse 2,2-dimetilhidracida de ácido succínico, cloruro de 2-cloroetil-trimetil-amonio e hidracida de ácido maléico (compárese al respecto: Cathy.



H.M. "Physiology of growth retarding chemicals", Ann. Rev. Plant Phys. 15, páginas 271-302 (1964), Patente alemana publicada No.

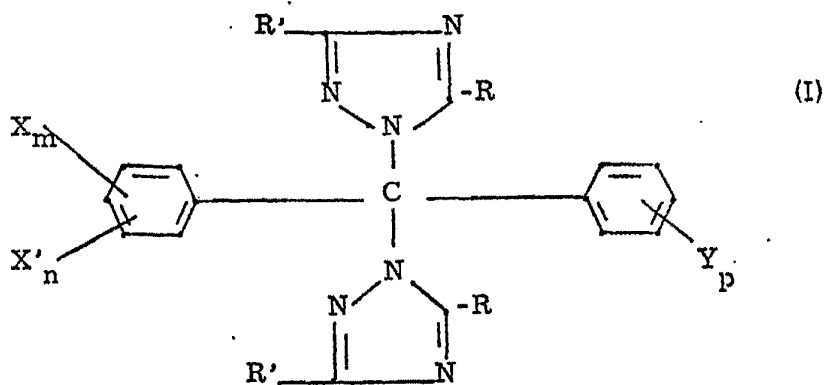
10

1.238.052 y las Patentes norteamericanas Nos. 2.575.954, 2.614.912, 2.614.916, 2.614.917 y 2.805.926). El efecto de las sustancias conocidas antes de ahora sobre las plantas, sin embargo, muchas veces no es satisfactorio.

15

Se ha encontrado que los nuevos bistriazolil-bisfenil-metanos de la fórmula

20



25

en la cual representan

384014

1

R y R' hidrógeno, fluor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y arilo eventualmente sustituido,

X, X' e Y halógeno, nitro, ciano trifluormetilo, así como alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo y alquilsulfonilo con

5

1 a 4 átomos de carbono cada uno, así como fenilo,

fenoxi, feniltio, fenilsulfonilo y/o bencilo, y

m, n y p uno de los números 0, 1 y 2,

así como las sales de estos compuestos tienen fuertes propiedades de influencia sobre el crecimiento de plantas.



10

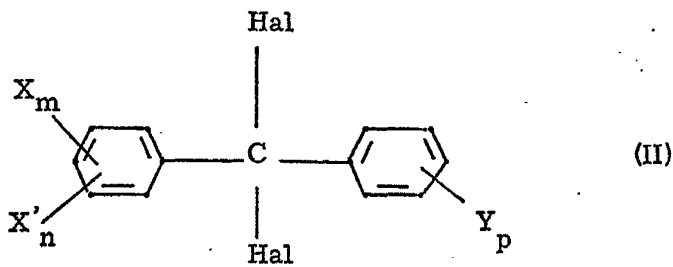
Como sales de los bistriazolil-bisfenil-metanos entran en consideración tales con ácidos tolerables por las plantas. Ejemplos de tales ácidos son los ácidos halogenhídricos, los ácidos fosfóricos, los ácido sulfónicos, los ácidos mono- y dicarboxílicos alifáticos, así como los ácidos hidroxicarboxílicos, tales como por ejemplo los ácidos acético, propiónico, maléico, succínico, fumárico, tartárico, cítrico, salicílico sórbico, láctico y 1,5-naftalindisulfónico.

15

Además, se ha encontrado que se obtienen los

bistriazolil-bisfenil-metano de la fórmula (I), si difenil-dihalogenometanos de la fórmula

20



25

384014



1

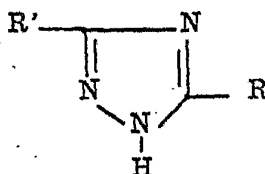
en la cual

Hal representa cloro o bromo y

X, X', Y, m, n y p tienen los significados más arriba indicados,

5

se hacen reaccionar con derivados de triazol de la fórmula



(III),

10

en la cual

R y R' tienen los significados más arriba definidos, en presencia de un agente ligador de ácidos.

Sorprendentemente, los bistriazolil-bisfenilmetanos aplicables según el invento, muestran un efecto de influencia sobre el crecimiento de plantas considerablemente más fuerte que los agentes reguladores de crecimiento conocidos del estado de la técnica. Por consiguiente, las sustancias representan un valioso enriquecimiento de la técnica.

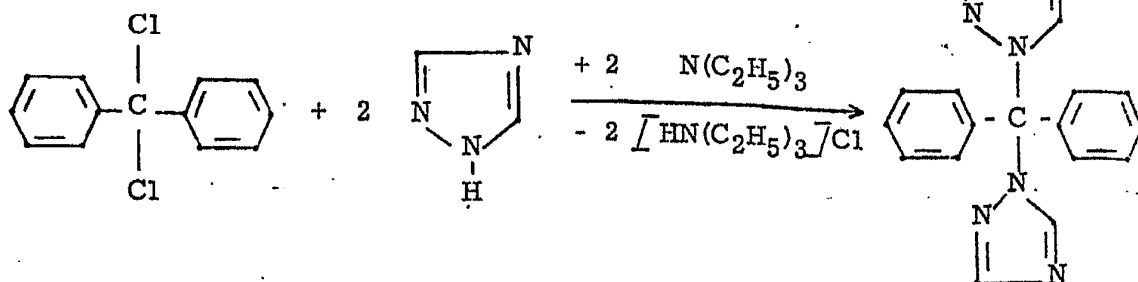
15

20

Si para la preparación de las sustancias según el invento, como materiales de partida, se aplican difenildicloro-metano y 1,2,4-triazol, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:

25

384014



En la fórmula (II), X, X' e Y representan preferiblemente fluor, cloro, bromo, yodo, así como los grupos nitro, ciano, trifluormetilo, metoxi y metiltio; m, n y p representan, de preferencia, los números 0 y 1. Como ejemplos de los difenil-dihalogeno-metanos (II) a aplicar según la invención, sean mencionados en detalle:

difenildiclorometano,

2-fluor-difenildiclorometano,

3-fluor-difenildiclorometano,

4-fluor-difenildiclorometano,

2-cloro-difenildiclorometano,

3-cloro-difenildiclorometano,

4-cloro-difenildiclorometano,

2-bromo-difenildiclorometano,

3-bromo-difenildiclorometano,

4-bromo-difenildiclorometano,

2-nitro-difenildiclorometano,

384014

- 1 3-nitro-difenildiclorometano,
4-nitro-difenildiclorometano,
2-ciano-difenildiclorometano,
3-ciano-difenildiclorometano,
5 4-ciano-difenildiclorometano,
2-metil-difenildiclorometano,
3-metil-difenildiclorometano,
4-metil-difenildiclorometano,
2-etil-difenildiclorometano,
10 3-etil-difenildiclorometano,
4-etil-difenildiclorometano,
2-metoxi-difenildiclorometano,
3-metoxi-difenildiclorometano,
4-metoxi-difenildiclorometano,
15 2-metiltio-difenildiclorometano,
3-metiltio-difenildiclorometano,
4-metiltio-difenildiclorometano,
2-metilsulfinil-difenildiclorometano,
3-metilsulfinil-difenildiclorometano,
20 4-metilsulfinil-difenildiclorometano,
2-metilsulfonil-difenildiclorometano,
3-metilsulfonil-difenildiclorometano,
4-metilsulfonil-difenildiclorometano,
4-ter-butil-difenildiclorometano,
25 4-fenil-difenildiclorometano,



384014

1 2,4-dicloro-difenildiclorometano,
2,5-dicloro-difenildiclorometano,
3,4-dicloro-difenildiclorometano,
4-cloro-2-nitro-difenildiclorometano,
5 4-cloro-3-nitro-difenildiclorometano,
6-cloro-3-nitro-difenildiclorometano,
2-cloro-4-nitro-difenildiclorometano,
2,4-dinitro-difenildiclorometano,
3,4-dinitro-difenildiclorometano,
10 3,5-dinitro-difenildiclorometano,
4-nitro-3-metil-difenildiclorometano,
3-nitro-4-metil-difenildiclorometano,
2,2'-difluor-difenildiclorometano,
2,3'-difluor-difenildiclorometano,
15 2,4'-difluor-difenildiclorometano,
3,3'-difluor-difenildiclorometano,
3,4'-difluor-difenildiclorometano,
4,4'-difluor-difenildiclorometano,
2-fluor-2'-cloro-difenildiclorometano,
20 2-fluor-3'-cloro-difenildiclorometano,
2-fluor-4'-cloro-difenildiclorometano,
3-fluor-3'-cloro-difenildiclorometano,
3-fluor-4'-cloro-difenildiclorometano,
4-fluor-4'-cloro-difenildiclorometano,
25 4-fluor-4'-bromo-difenildiclorometano,



384014

1 2,2'-dicloro-difenildiclorometano,
2,3'-dicloro-difenildiclorometano,
2,4'-dicloro-difenildiclorometano,
3,3'-dicloro-difenildiclorometano,
5 3,4'-dicloro-difenildiclorometano,
4,4'-dicloro-difenildiclorometano,
2-cloro-4'-bromo-difenildiclorometano,
3-cloro-4'-bromo-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-bromo-difenildiclorometano,
10 4-fluor-2'-nitro-difenildiclorometano,
4-fluor-3'-nitro-difenildiclorometano,
4-fluor-4'-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-2'-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-3'-nitro-difenildiclorometano,
15 4-cloro-4'-nitro-difenildiclorometano,
4-bromo-2'-nitro-difenildiclorometano,
4-bromo-3'-nitro-difenildiclorometano,
4-bromo-4'-nitro-difenildiclorometano,
4-fluor-4'-ciano-difenildiclorometano,
20 4-cloro-4'-ciano-difenildiclorometano,
4-bromo-4'-ciano-difenildiclorometano,
2-metil-2'-fluor-difenildiclorometano,
2-metil-3'-fluor-difenildiclorometano,
2-metil-4'-fluor-difenildiclorometano,
25 2-metil-2'-cloro-difenildiclorometano,



384014

- 1 2-metil-3'-cloro-difenildiclorometano,
2-metil-4'-cloro-difenildiclorometano,
3-metil-2'-fluor-difenildiclorometano,
3-metil-3'-fluor-difenildiclorometano,
5 3-metil-4'-fluor-difenildiclorometano,
3-metil-2'-cloro-difenildiclorometano,
3-metil-3'-cloro-difenildiclorometano,
3-metil-4'-cloro-difenildiclorometano,
4-metil-2'-cloro-difenildiclorometano,
10 4-metil-3'-cloro-difenildiclorometano,
4-metil-4'-cloro-difenildiclorometano,
4-ter-butil-2'-fluor-difenildiclorometano,
4-ter-butil-3'-fluor-difenildiclorometano,
4-ter-butil-4'-fluor-difenildiclorometano,
15 4-ter-butil-2'-cloro-difenildiclorometano,
4-ter-butil-3'-cloro-difenildiclorometano,
4-ter-butil-4'-cloro-difenildiclorometano,
2,4-dicloro-2'-fluor-difenildiclorometano,
2,4-dicloro-3'-fluor-difenildiclorometano,
20 2,4-dicloro-4'-fluor-difenildiclorometano,
2,4-dicloro-2'-cloro-difenildiclorometano,
2,4-dicloro-3'-cloro-difenildiclorometano,
2,4-dicloro-4'-cloro-difenildiclorometano,
2,5-dicloro-2'-fluor-difenildiclorometano,
25 2,5-dicloro-3'-fluor-difenildiclorometano,



384014

1 2,5-dicloro-4'-fluor-difenildiclorometano,
2,5-dicloro-2'-cloro-difenildiclorometano,
2,5-dicloro-3'-cloro-difenildiclorometano,
2,5-dicloro-4'-cloro-difenildiclorometano,
5 3,4-dicloro-2'-fluor-difenildiclorometano,
3,4-dicloro-3'-fluor-difenildiclorometano,
3,4-dicloro-4'-fluor-difenildiclorometano,
3,4-dicloro-2'-cloro-difenildiclorometano,
3,4-dicloro-3'-cloro-difenildiclorometano,
10 3,4-dicloro-4'-cloro-difenildiclorometano,
4-cloro-2'-fluor-2-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-3'-fluor-2-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-fluor-2-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-2'-cloro-2-nitro-difenildiclorometano,
15 4-cloro-3'-cloro-2-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-cloro-2-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-2'-fluor-3-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-3'-fluor-3-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-fluor-3-nitro-difenildiclorometano,
20 4-cloro-2'-cloro-3-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-3'-cloro-3-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-cloro-3-nitro-difenildiclorometano,
6-cloro-4'-fluor-3-nitro-difenildiclorometano,
6-cloro-4'-cloro-3-nitro-difenildiclorometano,
25 2-cloro-4'-cloro-4-nitro-difenildiclorometano,



384014

1 2-cloro-4'-fluor-4-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-2',4'-dinitro-difenildiclorometano,
4-cloro-3',4'-dinitro-difenildiclorometano,
4-cloro-3',5'-dinitro-difenildiclorometano,
5 4-cloro-3'-metil-4'-nitro-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-metil-3'-nitro-difenildiclorometano,
2,2',5,5'-tetracloro-difenildiclorometano,
2-fluor-4'-metoxi-difenildiclorometano,
3-fluor-4'-metoxi-difenildiclorometano,
10 4-fluor-4'-metoxi-difenildiclorometano,
2-cloro-4'-metoxi-difenildiclorometano,
3-cloro-4'-metoxi-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-metoxi-difenildiclorometano,
2-metil-4'-metoxi-difenildiclorometano,
15 3-metil-4'-metoxi-difenildiclorometano,
4-metil-4'-metoxi-difenildiclorometano,
2-fluor-4'-metiltio-difenildiclorometano,
3-fluor-4'-metiltio-difenildiclorometano,
4-fluor-4'-metiltio-difenildiclorometano,
20 2-cloro-4'-metiltio-difenildiclorometano,
3-cloro-4'-metiltio-difenildiclorometano,
4-cloro-4'-metiltio-difenildiclorometano,
2,4-dicloro-4'-metiltio-difenildiclorometano,
2,5-dicloro-4'-metiltio-difenildiclorometano,
25 3,4-dicloro-4'-metiltio-difenildiclorometano,



- 1 2,4-dicloro-4'-metoxi-difenildiclorometano,
 2,5-dicloro-4'-metoxi-difenildiclorometano,
 3,4-dicloro-4'-metoxi-difenildiclorometano,
 4-etiltio-2-cloro-difenildiclorometano,
5 4-etilsulfonil-2-cloro-difenildiclorometano,



Los difenil-dihalogeno-metanos (II) aplicados como sustancias de partida son en su mayoría conocidos. Algunos compuestos aún no conocidos pueden ser preparados en forma de principio conocida.

10 En la fórmula (III), R y R' representan preferiblemente hidrógeno. Un ejemplo típico de (III) es el 1,2,4-triazol que es generalmente conocido.

15 Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A ellos pertenecen preferiblemente las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, dietilcetona, además de la clase de otros disolventes la dimetilformamida, el acetonitrilo y el nitrometano.

20 Como agente aceptor de ácidos, pueden encontrar aplicación dos equivalentes ulteriores del derivado de triazol; de preferencia, se emplea la cantidad correspondiente de una de las aminas terciarias usuales, tales como por ejemplo, trietilamina, dimetilnilina, N,N-dimetil-bencilamina. Además, pueden utilizarse todos los usuales agentes ligadores inorgánicos
25 de ácidos. A éstos pertenecen preferiblemente los hidróxidos

384014

1 alcalinos y los carbonatos alcalinos.

Las temperaturas pueden variar dentro de un margen amplio. Por lo general, se trabaja entre 0° y 120°C, de preferencia, entre 20° y 90°C.

5 En la realización de la reacción según el invento, para cada mol de difenil-dihalogeno-metano, se aplican 2 moles de triazol y 2 moles de agente ligador de ácidos. Un exceso o un déficit de hasta un 20% es posible, sin que por ello disminuya notablemente el rendimiento.

10 La transformación de los compuestos libres (I) en sus sales procede en forma de principio conocida. Por ejemplo, para ello, por mol de un bistriazolil-bisfenil-metano disuelto en un disolvente apropiado, se agregan 2,2 moles del ácido deseado.

15 Las sustancias activas aplicables según el invento, intervienen en los sucesos fisiológicos del crecimiento de las plantas y, por ello, pueden ser aplicados como agentes reguladores del crecimiento de las plantas.

20 Los efectos diferentes de las sustancias activas dependen esencialmente del tiempo de la aplicación, con relación al estado de desarrollo de la semilla o de la planta, así como de las concentraciones aplicadas.

25 Los agentes reguladores del crecimiento de plantas son aplicados para diversos fines que están relacionados con el estado de desarrollo de la planta.

1

Así, con los agentes reguladores del crecimiento de plantas puede interrumpirse el reposo de las semillas, al objeto de inducir las semillas a germinar a tiempo determinado que, por un lado, es deseado, pero al cual, por otro lado, las mismas semillas aún no están dispuestas a germinar. La germinación propiamente dicha de las semillas puede ser ya sea inhibida o sea fomentada por tales sustancias activas en dependencia de la concentración aplicada. Esta inhibición o esta fomentación se refiere al desarrollo del brote.

5



10

Por las sustancias activas puede tenerse influencia sobre el reposo de los pimpollos de las plantas, vale decir, sobre la rítmica anual indógena, de modo que las plantas brotan y florecen por ejemplo, en un tiempo en que normalmente no están dispuestas a brotar o florecer.

15

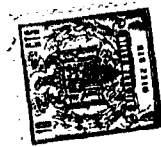
El crecimiento del retoño o de la raigambre puede ser fomentado o inhibido por las sustancias activas en dependencia de la concentración de éstas. Así, por ejemplo, es posible inhibir muy fuertemente de la planta enteramente desarrollada o bien llevar la planta en total a un aspecto exterior más vigoroso o bien provocar un nanismo.

20

De un interés económico es, por ejemplo la represión del crecimiento de gramíneas en las franjas laterales de carreteras y caminos. Además, puede ser inhibido el crecimiento de céspedes por agentes reguladores de crecimiento, de modo que puede reducirse la frecuencia de las operaciones de

25

384014



1 tundir.

 Durante el crecimiento de la planta, puede ser
aumentada también la ramificación lateral por una interrupción quí-
mica de la dominación apical. En ésto existe interés, por ejemplo
5 en la reproducción por estacas. En dependencia de la concentra-
ción de la substancia activa, sin embargo, también es posible inhi-
bir el crecimiento de los retoños laterales, por ejemplo al objeto
de impedir en plantas de tabaco, después de la decapitación la
formación de retoños laterales y de así fomentar el crecimiento
10 de las hojas.

 En el caso de una influencia sobre la forma-
ción de flores, puede lograrse en dependencia de la concentra-
ción y del tiempo de aplicación ya sea un atraso de la formación
de flores o sea una aceleración de la misma. Bajo determinadas
15 circunstancias puede lograrse un aumento de la floridez, ocurrien-
do estos efectos, si los correspondientes tratamientos se hacen en
el tiempo de la formación normal de flores.

 La influencia de las substancias activas sobre
la existencia de hojas, puede ser contraloreada de tal modo que
20 se consigue una deshojadura, por ejemplo, al objeto de facilitar
la cosecha o de reducir la transpiración en un tiempo en que ha
de hacerse el trasplante de las plantas.

 La fructificación puede ser fomentada, con el
resultado de formarse mayor cantidad de frutas o frutas sin se-
25 millas (partenocarpia). Bajo determinadas condiciones, puede im-

384014

1 pedirse también la caída prematura de frutas o bien fomentarse la
caída de frutas en el sentido de un enflaquecimiento químico hasta
un grado determinado. La fomentación de la caída de frutas,
sin embargo, puede ser aprovechada de tal manera que se hace
5 el tratamiento en el tiempo de la cosecha, facilitándose así la
última.



Según la finalidad de su aplicación, las nuevas
substancias activas pueden ser elaboradas en las formulaciones
usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos,
10 pastas y granulados. Estas formulaciones son preparadas en for-
ma conocida, por ejemplo, mezclándose las substancias activas con
diluyentes, vale decir, disolventes líquidos y/o substancias sólidas
de vehículo, eventualmente con el empleo de agentes tensio-
activos, vale decir, emulsivos y/o agentes dispersantes, pudien-
15 do, por ejemplo en el caso de la utilización del agua como dilu-
yente, emplearse eventualmente disolventes orgánicos como disol-
ventes auxiliares. Entran en consideración esencialmente, como
disolventes líquidos: hidrocarburos aromáticos (por ejemplo xileno,
benceno), hidrocarburos aromáticos clorados (por ejemplo cloro-
20 bencenos), parafinas (por ejemplo fracciones de petróleo), alcoh-
les (por ejemplo metanol, butanol), disolventes fuertemente po-
lares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así
como agua; como substancias sólidas de vehículo, polvos minera-
les naturales (por ejemplo caolines, arcillas, talco, creta) y
25 polvos minerales sintéticos (por ejemplo, ácido silícico altamente

1 disperso, silicatos); como emulsivos: emulsivos no ionógenos y
aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácidos grasos,
éteres de polioxietileno y alcoholes grasos, por ejemplo éteres
alquilaril-poliglicólicos, sulfonatos alquílicos y arílicos; como agen-
5 tes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfi-
to y metilcelulosa. -



Las formulaciones contienen generalmente en-
tre 0,1% y 95% en peso de sustancia activa, preferiblemente en-
tre 0,5% y 90% en peso.

10 Las sustancias activas pueden ser aplicadas
como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de
aplicación de ellas preparadas, tales como concentrados emulsio-
nables, polvos solubles y soluciones, emulsiones, suspensiones,
polvos de rociada, pastas, polvos para espolvorear y granulados
15 listos para el uso. La aplicación es efectuada en forma usual,
por ejemplo por riego, rociada, pulverización, esparcimiento,
espolvoreo, etc.

Las concentraciones de las sustancias acti-
vas pueden variar dentro de un margen amplio. Por lo general,
20 se emplean concentraciones de 0,0005% a 2%, preferiblemente
de 0,01% a 0,5%.

Además, por lo general, por hectárea de su-
perficie de suelo, se aplican 0,1 a 100 kg, preferiblemente 1 a
10 kg de sustancia activa.

25 En cuanto al tiempo de aplicación, vale que

384014

1 la aplicación es la más ventajosa, cuando se observa un crecimien-
to de fuerte extensión, vale decir, en el llamado tiempo del tirón
máximo. En el caso de plantas leñosas, se prefiere la aplicación
5 con la aplicación de insecticidas y fungicidas, la aplicación de
los agentes reguladores de crecimiento es efectuada dentro de un
lapso de tiempo preferido, cuyos límites exactos dependen de las
condiciones climáticas y vegetativas dadas.



10 Los compuestos a aplicar según la invención,
son en parte también eficaces contra hongos y bacterias nocivos
para las plantas.

El efecto de las sustancias a aplicar según
el invento, surge de los resultados de los siguientes ensayos:

Ejemplo A

15 Inhibición de crecimiento / ensayo con semillas de lino

Disolvente: 40 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,25 partes en peso de éter alquilaril-poliglicólico.

20 Para obtener una preparación adecuada de
sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia ac-
tiva con la cantidad indicada de disolvente que contiene la canti-
dad indicada de emulsivo, y se diluye el concentrado con una so-
lución tampón de fosfato de hidrógeno disódico-fosfato de hidróge-
no potásico (pH 6) hasta la concentración deseada.-

25 En placas de Petri sobre cada uno de dos pa-
peles para filtrar se colocan 25 semillas de lino. En cada placa

384014

1

de Petri, con una pipeta, se ponen 10 ml de la preparación de
sustancia activa. La germinación procede en la oscuridad a 25°C.

5

Al cabo de 3 días, se determina la longitud
de la raíz y se expresa en % la inhibición de crecimiento en com-
paración con la planta testigo. Significan 100% la paralización del
crecimiento y 0% un crecimiento concordante con aquél de la plan-
ta no tratada. -



10

Las sustancias activas, sus concentraciones
en ppm (= mg/kg) y los resultados surgen de la siguiente tabla.

15

20

25

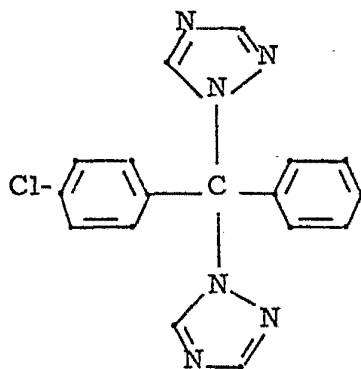
384014



TABLA

Inhibición del crecimiento / ensayo con semillas de lino

Substancia activa	inhibición en % a	
	50 ppm	250 ppm
Agua (testigo)	0	0
2,2-dimetilhidracida de ácido succínico (conocida)	12	15
cloruro de (2-cloroetil)-trimetil-amonio (conocida)	20	30
hidracida de ácido maléico (conocida)	36	50



76

89

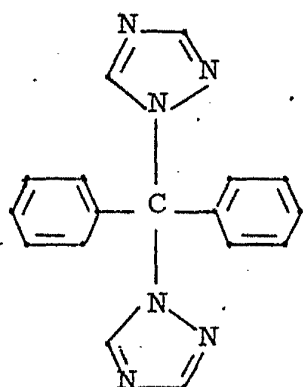
384014

Tabla (continuación)

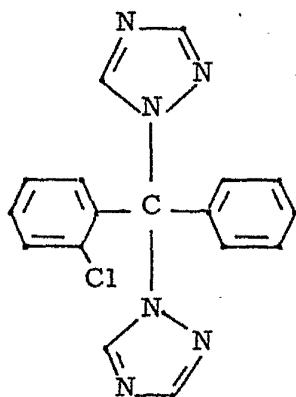


Inhibición del crecimiento / ensayo con semillas de lino

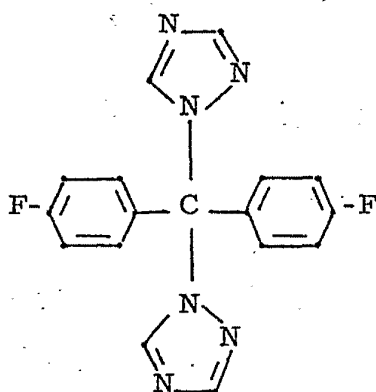
Substancia activa	inhibición en % a	
	50 ppm	250 ppm



	65	78
--	----	----



	80	97
--	----	----



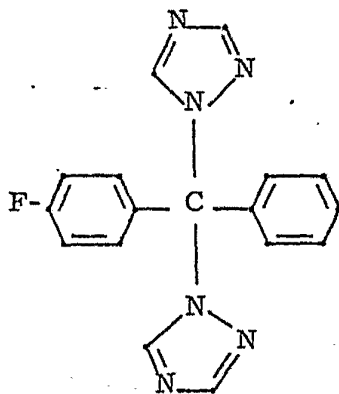
	60	68
--	----	----

384014

Tabla (continuación)

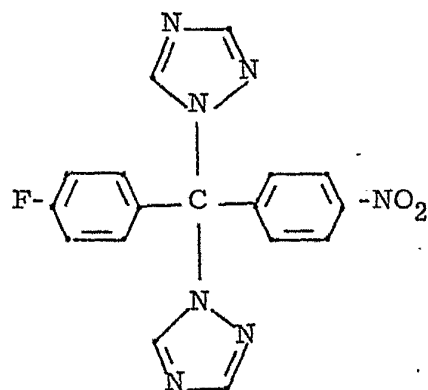
Inhibición del crecimiento / ensayo con semillas de lino

Substancia activa	inhibición en % a	
	50 ppm	250 ppm



65

80



50

58

384014



Ejemplo B

Inhibición de crecimiento / ensayo con granos de avena.

Disolvente: 40 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,25 partes en peso de éter alquilaril-poliglicólico.

5 Para obtener una preparación adecuada de substancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la substancia activa con la cantidad indicada de disolvente que contiene la cantidad indicada de emulsivo, y se diluye el concentrado con una solución tampón de fosfato de hidrógeno disódico-fosfato de hidrógeno potásico (pH 6) hasta la concentración deseada.

10 En placas de Petri, sobre cada uno de dos papeles para filtrar se colocan 25 granos de avena. En cada placa de Petri, con una pipeta, se ponen 10 ml de la preparación de substancia activa. La germinación procede en la oscuridad a 15 25°C.

Al cabo de 3 días, se determina la longitud del brote y se expresa en % la inhibición de crecimiento en comparación con la planta testigo. Significan 100% la paralización del crecimiento y 0% un crecimiento concordante con aquél de la 20 planta no tratada.

Las substancias activas, sus concentraciones en ppm (= mg/kg) y los resultados surgen de la siguiente tabla.

25

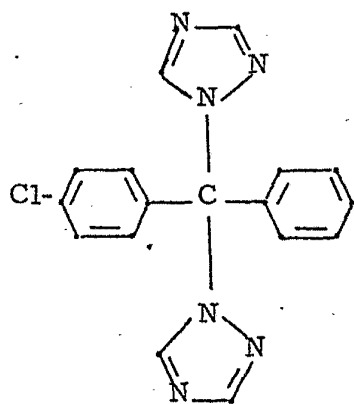
384014

TABLA



Inhibición de crecimiento / ensayo con granos de avena

Substancia activa	inhibición en % a	
	50 ppm	250 ppm
agua (testigo)	0	0
2,2-dimetilhidracida de ácido succínico (conocida)	22	37
cloruro de (2-cloroetil)-trimetil-amonio (conocida)	22	31
hidracida de ácido maléico (conocida)	20	40



48 100

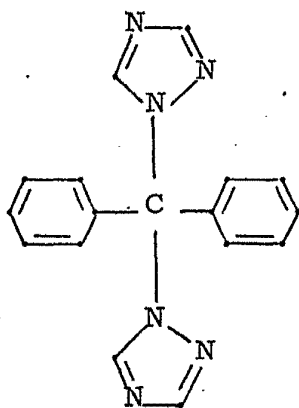
384014

Tabla (continuación)

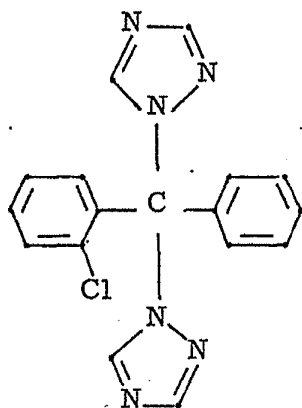


Inhibición de crecimiento / ensayo con granos de avena

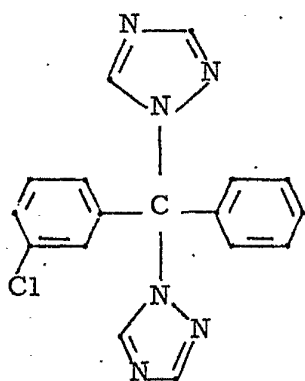
Substancia activa	inhibición en % a	
	50 ppm	250 ppm



	44	48
--	----	----



	53	96
--	----	----



	42	70
--	----	----

384014



Ejemplo C

Inhibición de crecimiento / manzanitos nacidos de semillas.

Disolvente: 40 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,25 partes en peso de éter alquilaril-poliglicólico.

Para obtener una preparación adecuada de sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada de disolvente que contiene la cantidad indicada de emulsivo y se diluye el concentrado con una solución tampón de fosfato de hidrógeno disódico-fosfato de hidrógeno potásico (pH 6) hasta la concentración deseada.

Sobre manzanitos nacidos de semillas de una altura de aproximadamente 2 cm se rocía una preparación que contiene 500 ppm de sustancia activa.

Al cabo de 7 días, se determinó la inhibición en % de las plantas tratadas en comparación con la planta testigo no tratada. A una inhibición al 100% no hay crecimiento, a una inhibición al 0% el crecimiento corresponde a aquél de la planta testigo.

Las sustancias activas, sus concentraciones en ppm (= mg/kg) y los resultados surgen de la siguiente tabla.

384014

TABLA



Inhibición de crecimiento / manzanitos nacidos de semillas

Substancia activa inhibición en % a
500 ppm

agua (testigo)

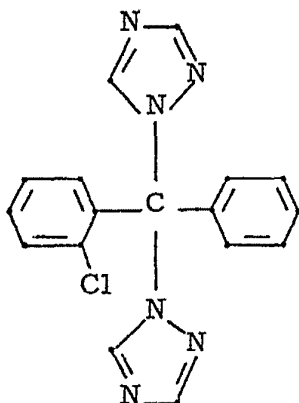
0

2,2-dimetilhidracida de ácido succínico
(conocida)

23

cloruro de (2-cloroetil)-trimetil-amonio
(conocido)

25



57

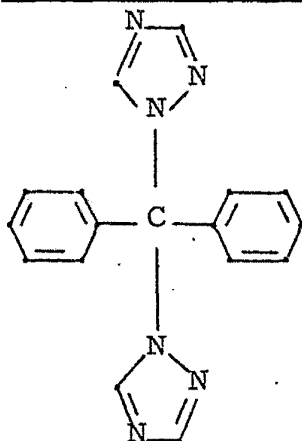
384014

Tabla (continuación)

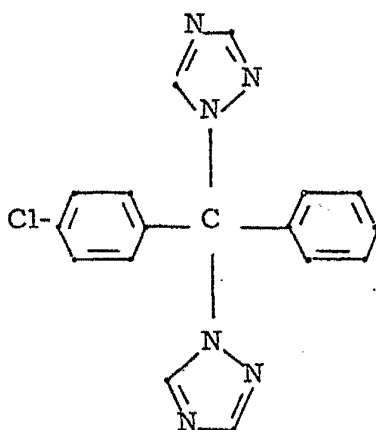
Inhibición de crecimiento / manzanitos nacidos de semillas
inhibición en % a

Substancia activa

500 ppm



33



35

384014

1

Ejemplo D



Inhibición de crecimiento / plantas de tomate

Disolvente: 40 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,25 partes en peso de éter alquilaril-poliglicólico.

5

Para obtener una preparación adecuada de sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada de disolvente que contiene la cantidad indicada de emulsivo, y se diluye el concentrado con una solución tampón de fosfato de hidrógeno disódico-fosfato de hidrógeno potásico (pH 6) hasta la concentración deseada.-

10

Plantas de tomate de una altura de 10 cm son tratadas con preparaciones que contienen 500 ppm de sustancia activa.

15

Al cabo de 8 días, se determina la inhibición en % de las plantas tratadas en comparación con la planta testigo no tratada. A una inhibición al 100 % no hay crecimiento, a una inhibición al 0 %, el crecimiento corresponde a aquél de la planta testigo.

20

Las sustancias activas, sus concentraciones en ppm (= mg/kg) y los resultados surgen de la siguiente tabla.

25

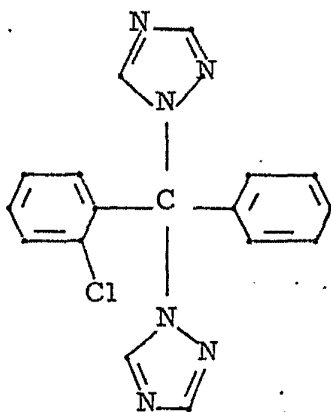
384014



TAFLA

Inhibición de crecimiento / ensayo con plantas de tomate

Substancia activa	inhibición en % a 500 ppm
Agua (testigo)	0
2,2-dimetilhidracida de ácido succínico (conocida)	20
cloruro de (2-cloroetil)-trimetil-amonio (conocida)	25
hidracida de ácido maleíco (conocida)	33



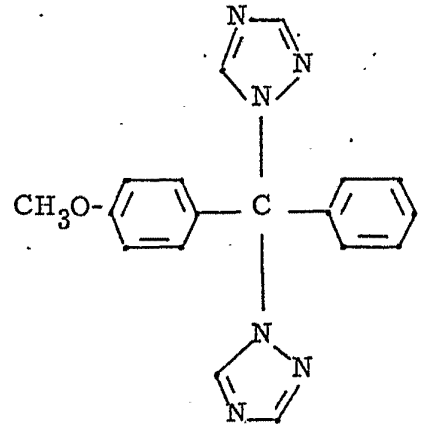
50

384014

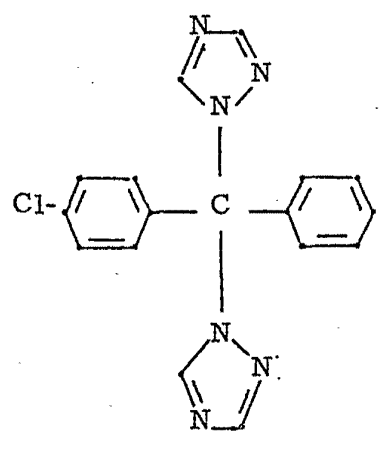


Inhibición de crecimiento / ensayo con plantas de tomate

Substancia activa	inhibición en % a 500 ppm
-------------------	------------------------------



37



36

384014

TABLA

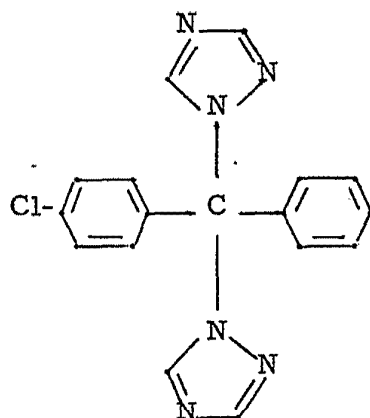


Atraso de la formación de flores / ensayo con plantas de tomates

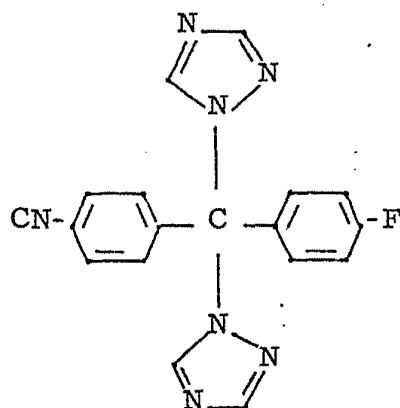
Substancia activa atraso en días

Agua (testigo)

0



11



7

384014

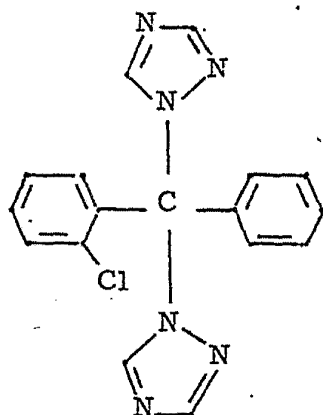


Tabla (continuación)

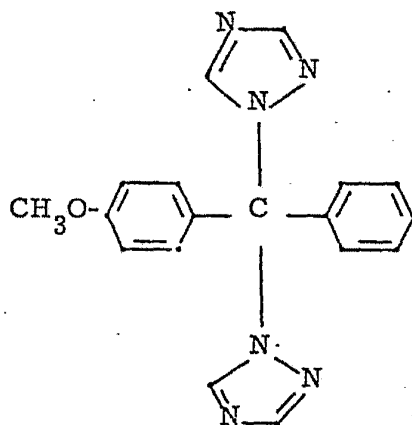
Atraso de la formación de flores / ensayo con plantas de tomate

Substancia activa

atraso en días



7



9

384014



1

Ejemplo F

5

Un crecimiento excesivo de brotes de petunias, zinnias (*Zinnia elegans*), amelos y claveles, llega a impedirse mediante el tratamiento con los compuestos según la invención. Para ello, sobre las plantas, inmediatamente en el comienzo de su crecimiento de extensión, se rocía una preparación que contiene 1000 ppm de sustancia activa. En el caso necesario, puede efectuarse una segunda aplicación con una preparación que contiene 1000 ppm o bien tan solo 500 ppm de sustancia activa.

10

Ejemplo G

15

La dominación apical de crisántemos y claveles es quebrada por las sustancias según el invento. Debido a ello, se produce una formación aumentada de ramos laterales. Estos pueden servir para la reproducción por estacas. Sobre las plantas de una altura de aproximadamente 25 cm se rocían una a dos veces preparaciones que contienen 500 a 1000 ppm de sustancia activa. Así, las plantas llegan a tener un aspecto exterior más compacto y se producen muchas ramificaciones laterales.

20

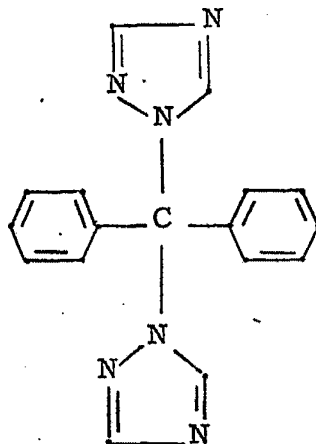
384014

25

1

Ejemplos de preparación:Ejemplo 1

5



10

15

20

En una solución de 27,2 g (0,4 moles) de 1,2,4-triazol y de 40,4 g (0,4 moles) de trietilamina en 400 ml de acetonitrilo, se instilan 47,4 g (0,2 moles) de difenildiclorometano, produciéndose ya a la temperatura ambiente una precipitación de hidrocioruro de trietilamina. Para completar la reacción, se calienta durante una hora. Después del enfriamiento, se agita la mezcla de reacción con 500 ml de benceno y se la lava con agua hasta la condición libre de sal. Se seca la solución bencénica sobre sulfato de sodio anhidro, se la filtra y se la concentra por evaporación; después de la recrystalización del producto en bruto en acetonitrilo, se obtienen 43 g de bistriazolil-bisfenil-metano del P.f. = 210°C.

Rendimiento: 56% de la teoría.

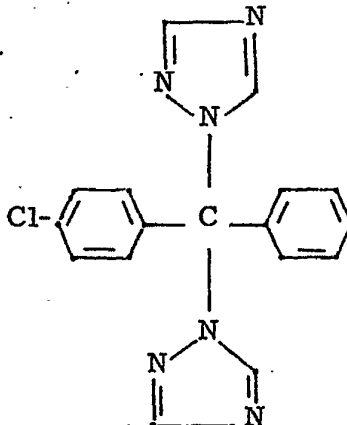
25

Se obtiene el mismo compuesto, si como com-

1 . puesto de partida, en lugar del compuesto diclorometano, se em-
plea el difenildibromo-metano.

Ejemplo 2

5



10

En una solución de 27,6 g (0,4 moles) de 1,2,4-
triazol y de 40,4 g (0,4 moles) de trietilamina en 300 ml de acetoni-
trilo, se instilan 54 g (0,2 moles) de 4-clorofenil-fenildiclorometano,
15 produciéndose ya a la temperatura ambiente una precipitación de clo-
ruro de trietilamonio. Para completar la reacción, se calienta
durante 12 horas a 80°C. Después del enfriamiento, se agita la
mezcla de reacción con 500 ml de benceno y se la lava con agua
20 hasta la condición libre de sal. Se seca la solución bencénica so-
bre sulfato de sodio anhidro, se la filtra y se la concentra por
evaporación; después de la recristalización del producto en bruto
en acetonitrilo, se obtienen 20 g de bistriazolil-4-clorofenil-fenil-
metano del P.f. = 170°C

25

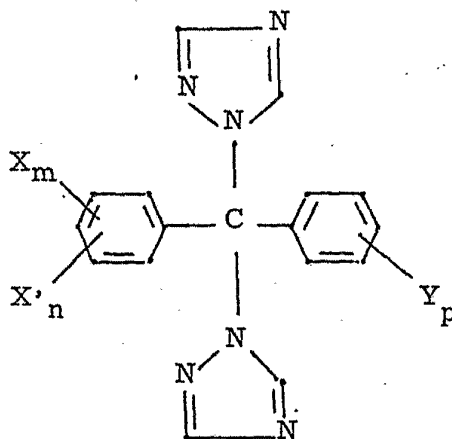


1

Ejemplos 3 a 14

En forma correspondiente pueden prepararse los siguientes compuestos de la fórmula general

5



10

(indicándose, en la siguiente tabla, la posición de los sustituyentes con los números antepuestos):

15

20

25

384014

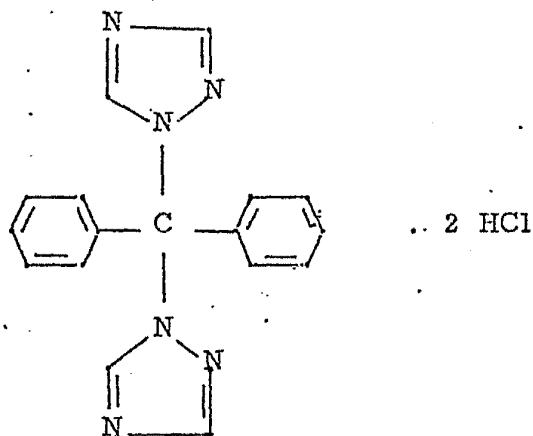
1	Ejem- plo No.	X	m	X'	n	Y	p	P.f. °C
	3	2-Cl	1	-	0	-	0	205
	4	4-OCH ₃	1	-	0	-	0	146
	5	4-F	1	-	0	-	0	198
5	6	3-Cl	1	-	0	-	0	118
	7	4-CN	1	-	0	-	0	105
	8	4-F	1	-	0	4-F	1	200
	9	4-F	1	-	0	4-NO ₂	1	185
	10	4-F	1	-	0	4-CN	1	75
10	11	4-Cl	1	-	0	4-Cl	1	170
	12	4-Cl	1	3-NO ₂	1	-	0	84
	13	4-CH ₃	1	3-NO ₂	1	-	0	90
	14	2-Cl	1	5-Cl	1	-	0	125



15

Ejemplo 15

20



25

El compuesto es obtenido por reacción de 0,2 moles de bistriazolil-

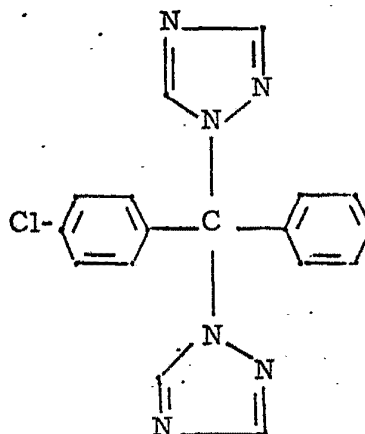
384014

1 .bisfenil-metano (compárese Ejemplo 1) con 0,44 moles de ácido
clorhídrico en tetracloruro de carbono como diluyente, tiene el
punto de fusión de 204°C.

Ejemplo 16



5



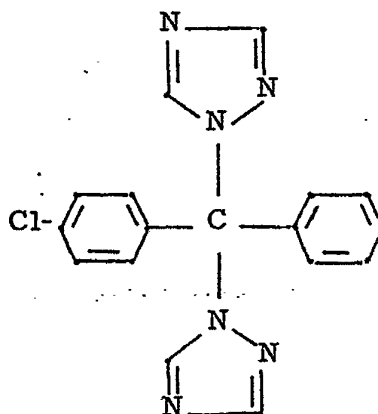
. 2 HCl

10

El compuesto es obtenido en forma correspon-
diente al ejemplo precedente. P.f. = 180°C

15

Ejemplo 17



. 2 CH₃-CH-COOH
OH

20

25

Se prepara el compuesto por reacción de 0,2

384014

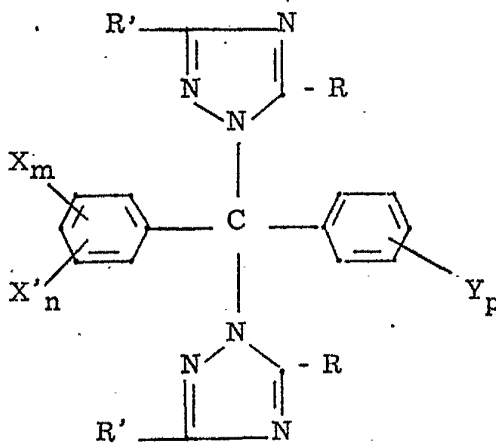
moles de bistriazolil-4-clorofenil-fenilmetano (compárese Ejemplo 2) con 0,44 moles de ácido láctico en acetonitrilo como diluyente.-

- NOTA -

5. 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. Se presento una solicitud de patente en Alemania bajo el nº P 19 49 012.1 de 27 de septiembre de 1969, acogiéndose por lo tanto a los beneficios que Conceden los Convenios Internacionales en vigor, por lo que solicita una Patente de Invención por 20 años, en España, sobre PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE BISTRIAZOLIL-BISFENIL-METANOS., caracterizándose por lo siguiente:

10.

15. 1.-Procedimiento para la obtención de bistriazolil-bisfenil-metanos, de fórmula





en la cual representan:

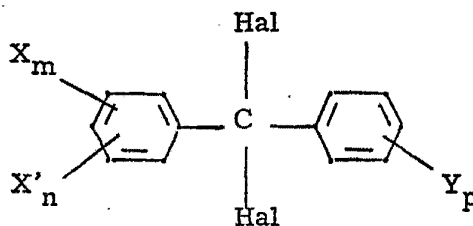
R y R' hidrógeno, fluor cloro, bromo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y arilo eventualmente sustituido,

X, X' e Y halógeno; nitro, ciano, trifluormetilo, así como alquilo alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo y alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono cada uno, así como fenilo, fenoxi, feniltio, fenilsulfonilo y/o bencilo, y

5.

m, n y p uno de los números 0, 1 y 2, así como de sus sales, caracterizado porque difenil-dihalogenometanos de fórmula

10.



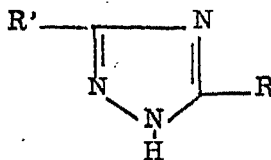
en la cual

Hal representa cloro o bromo y

X, X', Y, m, n y p tienen los significados más arriba indicados,

15.

se hacen reaccionar con derivados de triazol de fórmula



en la cual

R y R' tienen los significados más arriba definidos,

en presencia de un agente ligador de ácidos. -

384014

26



2.-Procedimiento para la obtención de bistriazol
-bisfenil-metanos, tal y como queda sustancialmente des-
crito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 44 hojas escritas a má-
quina por una solá cara.

Madrid, 26 SEP 1970

FARBENFABRIKEN BAYER
AKTIENGESELLSCHAFT

J. GOMEZ ACEBO Y MODET
p. p. Firmado: A. GARCIA BRAVO