



388439

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

PATENTE DE INVENCION

Le A 12 741-Sp.

Memoria Descriptiva

sobre:

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE COMPOSICIONES
FUNGICIDAS.

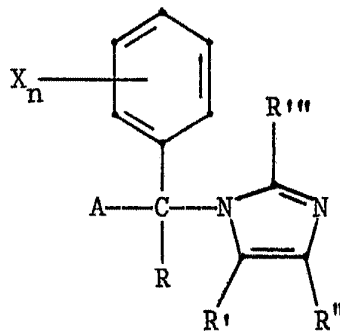
Solicitante: FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad
alemana, residente en Leverkusen-Bayerwerk, Repú-
blica Federal Alemana.

El presente invento se refiere a la aplica-
ción de N-arilalquil-imidazoles como fungicidas. Las
sustancias como tales y su producción constituyen el
objeto de una de las solicitudes de patente anteriores
5. de la recurrente.



5. Ya se ha dado a conocer que tritilimidazoles muestran generalmente buenas propiedades fungicidas (compárese: Patente norteamericana No. 3.321.366). Sin embargo, los mencionados compuestos no tienen, en cantidades bajas de aplicación, eficacia satisfactoria contra diversas clases de hongos del grupo de los ascomicetos.

Ahora se ha encontrado que los N-arilalquilimidazoles de la fórmula



10. R significa radicales alifáticos y cicloalifáticos con hasta 20 átomos de carbono, R', R'' y R''' hidrógeno y alquilo, alquenilo y cicloalquilo con hasta 6 átomos de carbono cada uno, A significa arilo, piridilo y radicales alifáticos o cicloalifáticos eventualmente sustituidos

15. con hasta 12 átomos de carbono, X significa alquilo, alcoxi, alquilmercapto con hasta 6 átomos de carbono cada uno, ariloxi y fenilo, radicales electronegativos y radicales básicos y n representa un número de 0 a 2, así como las sales de estos compuestos, muestran fuertes propiedades fungicidas.

20.

Sorprendentemente, los N-arilalquylimidazoles aplicables según la invención, ejercen una acción fungicida considerablemente más alta que los N-tritilimidazoles



5. conocidos del estado de la técnica que son las sustancias activas químicamente más parecidas de igual campo de acción. Esto vale particularmente para la lucha contra hongos de la familia de las Erysiphaceae que producen el verdadero añublo o tizón sobre plantas. Por consiguiente, las sustancias aplicables según el invento representan un enriquecimiento valioso de la técnica.

10. Las sustancias a aplicar según el invento están definidas generalmente por la precitada fórmula (I). En esta fórmula representa radicales alifáticos y cicloalifáticos con preferiblemente hasta 12 átomos de carbono; los radicales cicloalifáticos contienen eventualmente puentes de endometileno. R', R'' y R''' representan preferiblemente hidrógeno, alquilo y alquenilo con hasta 4 átomos de carbono. A representa preferiblemente fenilo y piridilo que preferiblemente pueden estar sustituidos por fluor, cloro o metilo; además, representa radicales alifáticos o cicloalifáticos con preferiblemente hasta 6 átomos de carbono. X representa alquilo, alcoxi y alquilmercapto con preferiblemente hasta 4 átomos de carbono cada uno; además, representa preferiblemente fenilo y fenoxi; además, preferiblemente fluor y cloro y grupos nitro, ciano y trifluormetilo; además, representa preferiblemente grupos amino y dialquilamino, pudiendo en el caso de dialquilamino, el grupo alquilo estar ciclizado, n representa preferiblemente los números 0 y 1.

30. Como ejemplos de las sustancias aplicables según el invento, pueden mencionarse en detalle:
1-imidazolil-(1)-1,1-bisfenil-2,2,2-trimetil-etano,
1-imidazolil-(1)-1-(4-clorofenil)-1-fenil-2,2,2-trimetil-



- etano,
1-imidazolil-(1)-1-(4-fluorfenil)-1-fenil-2,2,2-trimetil-
etano,
1-imidazolil-(1)-1-(3-clorofenil)-1-fenil-2,2,2-trimetil-
5. etano,
1-imidazolil-(1)-1-(3-metilfenil)-1-fenil-2,2,2-trimetil-
etano,
1-imidazolil-(1)-1-(2-metilfenil)-1-fenil-2,2,2-trimetil-
etano,
10. 1-imidazolil-(1)-1-(4-metilfenil)-1-fenil-2,2,2-trimetil-
etano,
1-imidazolil(1)-1-(4-fenoximetil)-fenil-2,2,2-trimetil-
etano,
1-imidazolil-(1)-1-(4-metoxifenil)-fenil-2,2,2-trimetil-
15. etano,
1-imidazolil-(1)-1-(metiltiofenil)-fenil-2,2,2-trimetil-
etano,
1-imidazolil-(1)-bisfenil-ciclohexil-metano,
imidazolil-(1)-fenil-(4-clorofenil)-ciclohexil-metano,
20. imidazolil-(1)-fenil-(3-clorofenil)-ciclohexil-metano,
imidazolil-(1)-fenil-(2-clorofenil)-ciclohexil-metano,
imidazolil-(1)-fenil-(4-fluorfenil)-ciclohexil-metano,
imidazolil-(1)-piridil-(4)-fenil-ciclohexil-metano,
1-imidazolil-(1)-piridil-(4)-1-fenil-2,2,2-trimetil-etano,
25. 1-imidazolil-(1)-piridil-(4)-fenil-ciclopropil-metano,
1-imidazolil-(1)-fenil-bis-ciclohexil-metano,
1-imidazolil-(1)-fenil-bis-ciclopropil-metano,
1-imidazolil-(1)-fenil-(4-clorofenil)-isopropil-metano,
3-imidazolil-(1)-2,4,4-trimetil-3-fenil-pentano,
30. imidazolil-(1)-bisfenil-ciclopropil-metano,



1-imidazolil-(1)-1,1-bisfenil-etano,
1-imidazolil-(1)-1-(4-clorofenil)-1-fenil-etano,
1-imidazolil-(1)-1-bisfenil- $\sqrt{2}$ -metil-biciclo-(2,2,1)-heptil-
(2)7-metano,

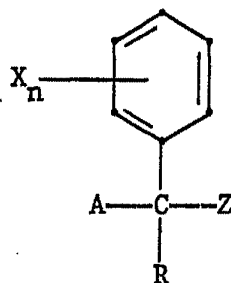
5. imidazolil-(1)-bisfenil-adamantil-metano,
imidazolil-(1)-p-clorofenil-fenil-adamantil-metano,
imidazolil-(1)-o-clorofenil-fenil-adamantil-metano.

Como sales de los arilalquil-imidazoles entran en consideración tales con ácidos fisiológicamente tolerables. Ejemplos de tales ácidos son ácidos halogenhídricos, ácidos fosfóricos, ácidos sulfónicos, ácidos mono y dicarboxílicos y ácidos hidroxicarboxílicos.

10.

Las sustancias aplicables según el invento pueden ser producidas en forma sencilla según procedimientos conocidos. Se las obtienen, por ejemplo de tal manera que un compuesto de la fórmula

15.



(II)

20.

en la cual A , R , X y n tienen los significados definidos con referencia a la fórmula (I) y Z representa cloro o bromo, eventualmente en presencia de un agente aceptor de ácidos, se hace reaccionar con por lo menos la cantidad teóricamente necesaria de un imidazol eventualmente sustituidos por radicales alquilo de bajo peso molecular, en un disolvente orgánico dentro del margen de temperatu-



ra de 20° a 150° C.

5. Los derivados de halógeno de la fórmula (II) requeridos como material de partida para esta reacción, son conocidos, respectivamente pueden ser obtenidos de los correspondientes derivados de hidroxilo por tratamiento con un agente de halogenación, tal como cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, cloruro de fosforilo, bromuro de fosforilo, cloruro de acetilo, bromuro de acetilo, en disolventes, tales como éter, cloruro de metileno, benceno o tolueno.

10. Los imidazoles, principalmente el mismo imidazol, requeridos como segundo componente de reacción, son conocidos. La reacción de los derivados de halógeno (II) con imidazol, respectivamente imidazoles sustituidos, es llevada a cabo preferiblemente en un disolvente polar, tal como acetonitrilo, nitrometano, dimetilformamida, triamida de ácido hexametilfosfórico.

15. Como agentes aceptores de ácidos pueden utilizarse bases orgánicas, tales como piridina, trietilamina, quinolina, así como carbonatos alcalinos o el mismo imidazol aplicado en exceso.

20. El aislamiento de los N-arilalquil-imidazoles es efectuado en forma usual, por ejemplo por concentración o por dilución con agua.

25. Las sustancias activas según el invento muestran un fuerte efecto fungitóxico. Gracias a su baja toxicidad para animales de sangre caliente, son apropiadas para combatir el crecimiento no deseado de hongos. El hecho de que son toleradas por plantas altas, permite su aplicación como agentes protectores de plantas contra en-

30.



fermedades provocadas por hongos.

Las sustancias activas se prestan particularmente bien para combatir hongos fitopatógenos sobre partes de planta crecidas encima de la tierra, así como hongos fitopatógenos que atacan las plantas desde el suelo.

5.

Los compuestos tienen un espectro amplio de acción. Son eficaces contra un gran número de hongos fitopatógenos de los más diversos grupos sistemáticos (hongos imperfectos, hifomicetos, ascomicetos, basidiomicetos).

10.

Es de particular interés técnico el hecho de que las sustancias son eficaces, dentro del grupo de los ascomicetos, contra formas tan diferentes como las especies *Erysiphe* y *Podosphaera* de la familia de *Erysiphaceae* (hongos provocadores de las enfermedades de verdadero añublo) y las especies *Venturia* (enfermedades de costra en frutas de pepita). Gracias a ello es posible combatir con las sustancias según el invento simultáneamente los dos grupos de hongos.

15.

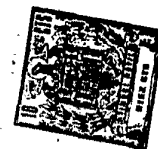
Por otra parte, las sustancias activas pueden ser aplicadas con buen resultado para combatir otros hongos fitopatógenos, por ejemplo contra hongos que provocan enfermedades en arroz y plantas de adorno. Las sustancias activas muestran un buen efecto contra *Piricularia oryzae*, *Pellicularia sasakii* y *Cochliobolus miyabeanus*, tres hongos fitopatógenos que ocurren en arroz, así como contra *Cercospora musae*.

20.

25.

Las sustancias activas se distinguen por una elevada eficacia en concentraciones bajas y por una toleración satisfactoria por las plantas. Después de la aplicación de altas concentraciones, pueden ocurrir retrasos en el crecimiento de las plantas.

30.



Las sustancias activas según el invento pueden ser elaboradas en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. Estas formulaciones son producidas en forma conocida, por ejemplo, mezclándose las sustancias activas con diluyentes, vale decir, con disolventes líquidos y/o sustancias sólidas de vehículo, eventualmente con el empleo de agentes tensioactivos, vale decir, emulsivos y/o agentes dispersantes. En el caso de la utilización del agua como diluyente, pueden emplearse por ejemplo, también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Entran en consideración esencialmente, como disolventes líquidos: hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno y benceno), hidrocarburos aromáticos clorados (por ejemplo clorobencenos), parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol y butanol), disolventes fuertemente polares (por ejemplo dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo), así como agua; como sustancias sólidas de vehículo: minerales naturales en polvo (por ejemplo, caolines, tierras arcillosas, talco y creta) y minerales sintéticos en polvo (por ejemplo ácido silícico altamente disperso y silicatos); como emulsivos: emulsivos no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de polioxi-etileno y ácidos grasos, éteres de polioxi-etileno y alcoholes grasos., por ejemplo éteres alquilaril-poliglicólicos, sulfonatos alquílicos y arílicos; como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfito y metilcelulosa.

Las sustancias activas según el invento pueden estar presentes en las formulaciones en mezcla con otros



fungicidas y/o insecticidas inorgánicos y orgánicos.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferiblemente entre 0,5 y 90 % en peso de sustancia activa.

5. Las sustancias activas pueden ser aplicadas como tales, en forma de sus formulaciones o como formas de aplicación de ellas preparadas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados en condición lista para el uso. La aplicación es efectuada en forma usual, por ejemplo por pulverización, rociada, riego o esparcimiento.

10. Las concentraciones de aplicación pueden variar dentro de límites muy amplios. Normalmente están entre aproximadamente 0,00001 y 2 %, preferiblemente entre 0,0001 y 1 %, . Si las sustancias activas son aplicadas según procedimientos especiales, por ejemplo según el procedimiento de volumen ultra-bajo, los concentrados tienen concentraciones de sustancia activa de entre 10 y 80 %, preferiblemente entre 20 y 60 %.

15. Los compuestos son también eficaces contra mohos, contra *Staphylococcus aureus* y contra formadores de esporos.

20. Los siguientes ejemplos de aplicación explican la utilización de las sustancias según el invento. Los números de las sustancias activas, indicados en las tablas, corresponden a los números en los ejemplos de preparación (compárese: hojas 35 - 38).

Ejemplo A

25. Ensayo con *Fusicladium* (costra de manzana) / efecto protector.
- 30.



Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,
emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilaril-poligli
cólico,
agua: 95 partes en peso.

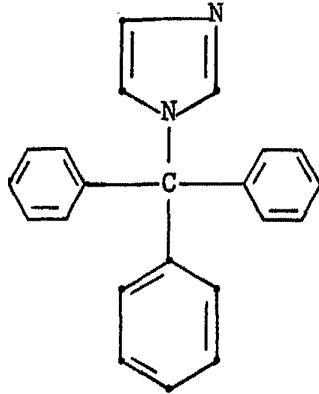
5. La cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de sustancia activa en el líquido de rociada, se mezcla con la cantidad indicada del disolvente y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de agua que contiene el aditivo mencionado.
10. La preparación líquida es rociada sobre manzanitos jóvenes nacidos de semillas en su estado de desarrollo de 4 a 6 hojas hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Las plantas permanecen durante 24 horas en el invernáculo a 20° C y una humedad relativa del aire de 70 %. Subsiguientemente son inoculadas con una suspensión acuosa de conidias del hongo provocador de la costra de manzana (*Fusicladium dendriticum* Fuck) y son sometidas a la incubación durante 18 horas en una cámara húmeda a 18-20° C y 100 % de humedad relativa del aire.
15. Las plantas permanecen nuevamente en el invernáculo durante 14 días.
Al cabo de 15 días a contar de la inoculación, se determina en % el ataque en las plantitas nacidas de semillas, con respecto a las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas.
20. 0 % significa ningún ataque; 100 % significa que el ataque es exactamente igual a aquel en las plantas testigos.
25. Las sustancias activas, sus concentraciones y los resultados surgen de la siguiente tabla:
- 30.



Tabla

Ensayo con Fusicladium / efecto protectorio.

| Sustancia activa | ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa (en %) de | | |
|------------------|---|--------|---------|
| | 0,025 | 0,0062 | 0,00156 |



84 - -

(conocida)

| | | | |
|---|---|----|----|
| 1 | 0 | 17 | 61 |
| 2 | 6 | 16 | 37 |
| 3 | 0 | 4 | 51 |

Ejemplo B

Ensayo con Erysiphe

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilaril-poliglucólico,

agua: 95 partes en peso.

La cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada, se mezcla con la cantidad indicada del disolvente y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de agua que contiene el aditivo indicado.

5.

10.

388439



5. La preparación líquida es rociada sobre plantas jóvenes de pepino del estado de desarrollo de aproximadamente tres hojas hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Las plantas de pepino permanecen para su secamiento durante 24 horas en el invernáculo. Entonces sobre las mismas, para su inoculación, se espolvorean conidias del hongo *Erysiphe cichoreacearum*. Subsiguientemente se colocan las plantas en el invernáculo a 23-24° C y a una humedad relativa del aire de aproximadamente 75 %.

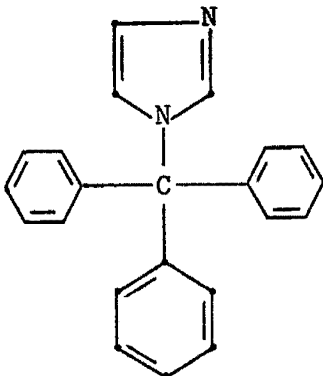
10. Al cabo de 12 días, se determina el ataque en las plantas de pepino en % de aquél en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas.

15. 0 % significa ningún ataque; 100 % significa que el ataque es exactamente igual a aquél en las plantas testigos.

Las sustancias activas, sus concentraciones y los resultados surgen de la siguiente tabla:

Tabla

Ensayo con *Erysiphe*.

| Sustancia activa | ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa (en %) de | |
|---|---|---------|
| | 0,00078 | 0,00019 |
|  | 7 | 26 |
| | (conocida) | |

(conocida)

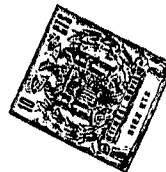


Tabla (continuación)

Ensayo con Erysiphe

| Sustancia activa | ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa (en %) de | |
|------------------|---|---------|
| | 0,00078 | 0,00019 |
| 1 | 0 | 0 |
| 2 | 0 | 0 |
| 3 | 0 | 0 |
| 4 | 0 | 0 |
| 5 | 0 | 0 |
| 6 | 0 | 0 |
| 7 | 0 | 0 |
| 8 | 0 | 0 |
| 9 | 7 | 20 |

Ejemplo C

Ensayo con Fusicladium (costra de manzana) / efecto curativo

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilaril-poligli
cólico,

agua: 95 partes en peso.

La cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada, se mezcla con la cantidad indicada del disolvente y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de agua que contiene el aditivo indicado.

Manzanitos nacidos de semillas del estado de desarrollo de 4 a 6 hojas son inoculados con una suspen-

5.

10.



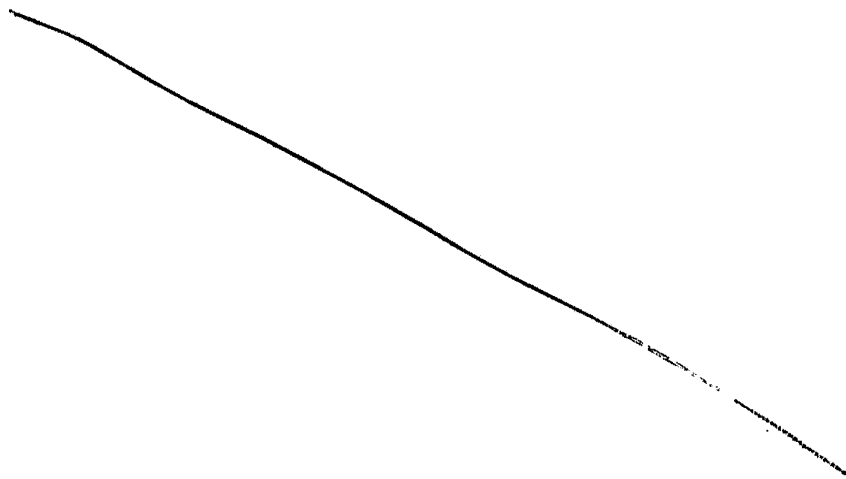
5. sión acuosa de conidias del hongo provocador de la costra de manzana (*Fusicladium dendriticum* Fuck.) y son sometidos a la incubación durante 18 horas en una cámara húmeda a 18-20° C y 100 % de humedad relativa del aire. Subsiguientemente se colocan las plantas en un invernáculo, donde se secan.

10. Después de un tiempo adecuado de permanencia en el invernáculo, sobre las plantas es rociado el líquido preparado en la forma arriba indicada hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Entonces se colocan las plantas nuevamente en el invernáculo.

15. Al cabo de 15 días a contar de la inoculación, se determina el ataque en los manzanitos por el hongo en % de aquél en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas.

0 % significa ningún ataque; 100 % significa un ataque exactamente igual a aquel en las plantas testigos.

20. Las sustancias activas, sus concentraciones, el intervalo entre inoculación y rociada, así como los resultados surgen de la siguiente tabla

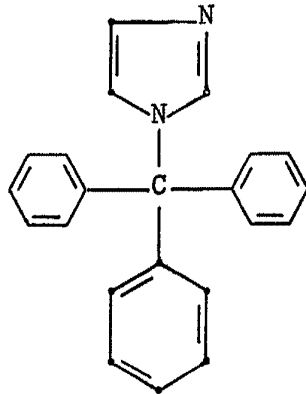




Tabla

Ensayo con Fusicladium / efecto curativo.

| Sustancia activa | intervalo 42 horas | ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa de | |
|------------------|-----------------------|--|---------|
| | | 0,1 % | 0,025 % |



68 -

(conocida)

| | | |
|---|---|---|
| 1 | 0 | - |
| 2 | 1 | 0 |
| 3 | 0 | 0 |

Ejemplo D

Ensayo con Podosphaera (añublo de manzana) / efecto protector.

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,

5. emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilaril-poliglicólico,

agua: 95 partes en peso.

10. La cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada, se mezcla con la cantidad indicada del



disolvente y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de agua que contiene el aditivo mencionado.

5. La preparación líquida es rociada sobre manzanitos nacidos de semillas en su estado de desarrollo de 4 a 6 hojas hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Las plantas permanecen durante 24 horas en un invernáculo a 20° C y 70 % de humedad relativa del aire. Subsiguientemente son inoculadas por espolvoreo de conidias del hongo provocador del añublo de manzana (Podosphaera Leucotricha Salm.) y colocadas en un invernáculo con una temperatura de 21 a 23° C y una humedad relativa del aire de aproximadamente 70 %.

10.

15. A los 10 días de la inoculación, se determina el ataque en los manzanitos de semillas en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas.

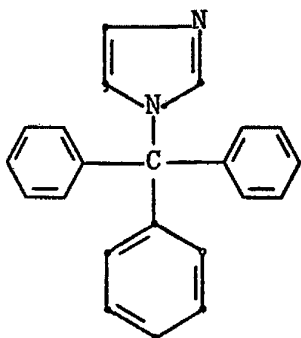
0 % significa ningún ataque; 100 % significa un ataque exactamente igual a aquel en las plantas testigos.

20. Las sustancias activas, sus concentraciones y los resultados surgen de la siguiente tabla:

Tabla

Ensayo con Podosphaera / efecto protectorio.

| Sustancia activa | ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa de |
|------------------|--|
| | 0,00156 0,00078 |



18

49



Tabla (continuación)

Ensayo con Podosphaera / efecto protectorio.

| | |
|------------------|--|
| Sustancia activa | ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa de |
| | 0,00156 0,00078 |

(conocida)

| | | |
|---|---|----|
| 1 | 5 | 9 |
| 2 | 1 | 1 |
| 3 | 4 | 7 |
| 4 | 1 | 7 |
| 5 | 0 | 0 |
| 6 | 0 | 3 |
| 7 | 1 | 5 |
| 8 | 1 | 18 |

Ejemplo E

Ensayo con Piricularia y Pellicularia.

Disolvente: 4 partes en peso de acetona,
 agente dispersante: 0,05 partes en peso de oleato de sodio,
 agua: 95,75 partes en peso,
 otro aditivo: 0,2 partes en peso de gelatina.

5.

La cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada, se mezcla con la cantidad indicada del disolvente y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de agua que contiene los aditivos mencionados.

10.

La preparación líquida es rociada sobre 2 lotes de 30 plantas de arroz de una edad de unas 2 a 4 se-

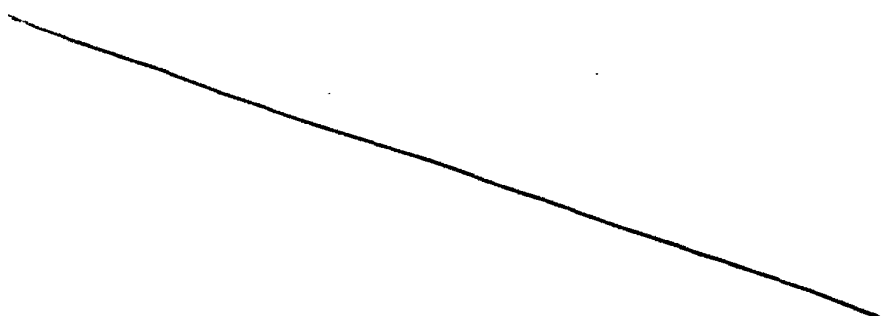


- manas, hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Hasta su secamiento las plantas permanecen en un invernáculo a una temperatura de 22 a 24° C y a una humedad relativa del aire de aproximadamente 70 %. Subsiguientemente, un lote de las plantas es inoculado con una suspensión acuosa de 100.000 a 200.000 esporos/ml de *Piricularia Oryzae* y es colocado en un ambiente de 24-26° C y de una humedad relativa del aire de 100 %. El otro lote de las plantas es infectado con un cultivo de *Pellicularia sasakii* cultivado sobre malta/agar-agar y es sometido a 28-30° C y a 100 % de humedad relativa del aire.

5. A los 5 a 8 días de inoculación, se determina el ataque en todas las hojas existentes en el momento de la inoculación con *Piricularia arylzae* en % de aquel de las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas. En el caso de las plantas infectadas con *Pellicularia sasakii*, el ataque es determinado al mismo tiempo en las vainas de hojas también en relación con las plantas testigos no tratadas, pero también infectadas.

10. 0 % significa ningún ataque; 100 % significa un ataque exactamente igual a aquel de las plantas testigos.

15. Las sustancias activas, sus concentraciones y los resultados surgen de la siguiente tabla:

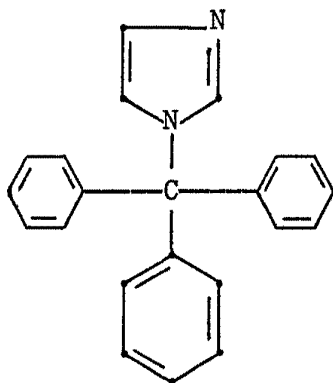




Tabla

Ensayo con Piricularia (a) y Pellicularia (b)

| Sustancia activa | ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de la sustancia activa (en %) de | | | |
|------------------|---|-------|------|-------|
| | a | | b | |
| | 0,05 | 0,025 | 0,05 | 0,025 |



pr. 50 75

(conocida)

| | | | | | |
|----|-----|----|----|----|----|
| 1 | pr. | 0 | 0 | 0 | |
| 2 | pr. | 0 | 0 | 25 | 7 |
| 3 | pr. | 0 | 0 | 0 | 13 |
| 4 | pr. | 33 | | 0 | 25 |
| 7 | pr. | 25 | | 0 | 25 |
| 8 | pr. | 0 | 0 | 8 | |
| 9 | pr. | 25 | 25 | 50 | 58 |
| 20 | pr. | | | 0 | 42 |

Nota: pr. significa protectivo.



Ejemplo F

Ensayo de tratamiento de retoño / roya de cereales.
(micosis destructora de hojas)

5. Para la producción de una preparación adecuada de sustancia activa, se recogen 3 partes en peso de sustancia activa en 50 partes en peso de dimetilformamida y se agregan 947 partes en peso de agua. Se diluye el concentrado con una solución acuosa al 5 % de dimetilformamida hasta la deseada concentración final del líquido de rociada.

10. Para ensayar la eficacia protectora, se contaminan plantitas de trigo del tipo Michigan Amber en su estado de desarrollo de una hoja con una suspensión de uredoesporos de Puccinia triticina en agua/agar-agar al 1 %. Después de secarse la suspensión de esporos, sobre las plantas de trigo se rocía la preparación de sustancia activa hasta su mojadura al grado de rocío y, para la incubación, se las colocan en un invernáculo durante 24 horas a aproximadamente 18° C y 100 % de humedad relativa de aire.

15. El ensayo con respecto a la eficacia curativa es efectuado correspondientemente, pero con la diferencia de que el tratamiento de las plantas de trigo con la preparación de sustancia activa procede recién 48 horas después de la contaminación, cuando la infección ya se manifiesta.

20. Después de 10 días de permanencia de las plantas a una temperatura de 18° C y a una humedad relativa del aire de 80 a 90 %, se evalúa el ataque de las plantas con pústulas de roya y se determina el grado de eficacia

30.



de la preparación de sustancia activa en %, significando 0 % que el ataque es exactamente igual a aquél en las plantas testigos no tratadas, y 100 % que no se desarrolló ninguna pústula de roya.

5. Las sustancias activas, sus concentraciones en el líquido de rociada y el grado de eficacia surgen de la siguiente tabla:

Tabla

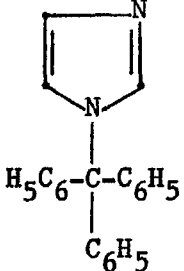
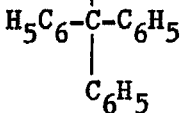
Ensayo de tratamiento de retoños / roya de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento protectorio.

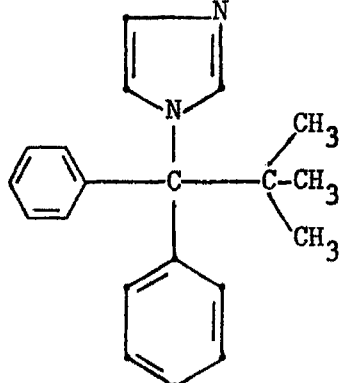
10.

| Sustancias activas | Concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|

| | | |
|-----------------|---|---|
| sin tratamiento | - | 0 |
|-----------------|---|---|

| | | |
|---|-----|---|
|  | 0,1 | 0 |
|  | 0,3 | 0 |

(conocida)

| | | |
|---|------|----|
|  | 0,01 | 63 |
|---|------|----|

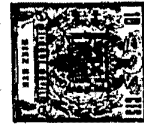


Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / roya de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento protectorio.

| Sustancias activas | Concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
| | 0,01 | 91 |
| | 0,01 | 100 |
| | 0,01 | 88 |



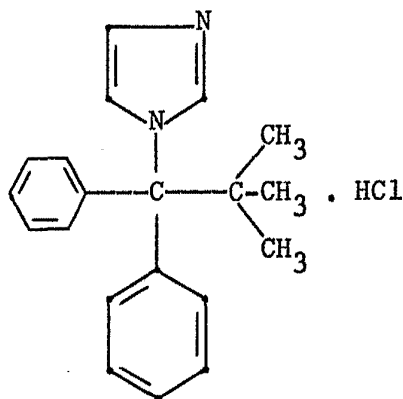
Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / roya de cereales

(micosis destructora de hojas)

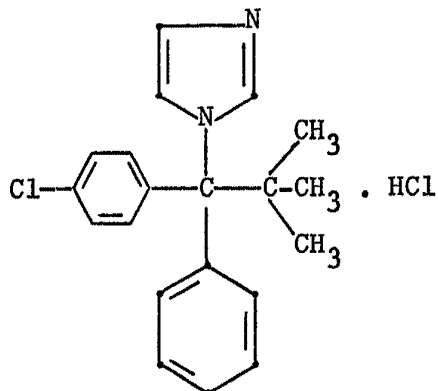
Tratamiento protectorio.

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|



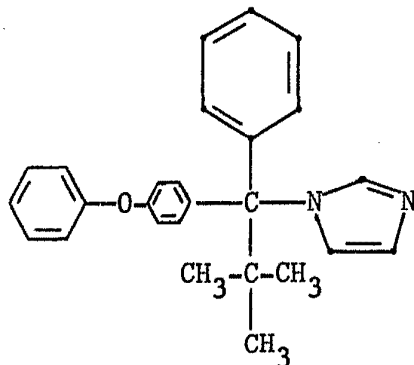
0,01

63



0,01

69



0,01

37

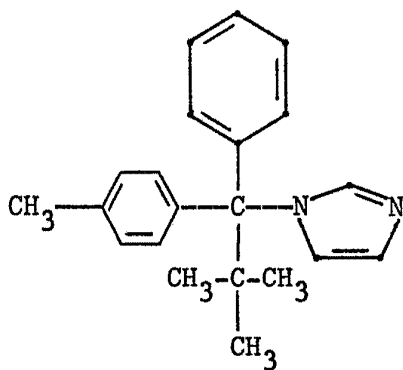


Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / roya de cereales
(micosis destructora de hojas)

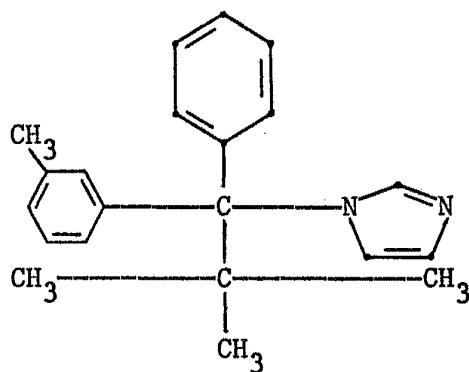
Tratamiento protectorio.

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|



0,01

20



0,01

22



Tabla

Ensayo de tratamiento de retoños / roya de cereales
(micosis destructora de hojas)

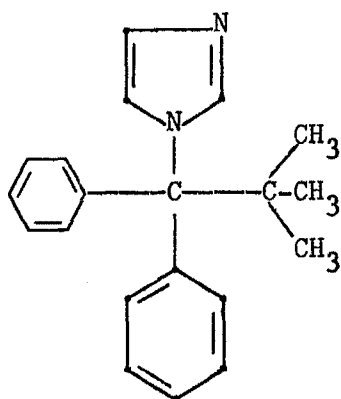
Tratamiento curativo.

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|

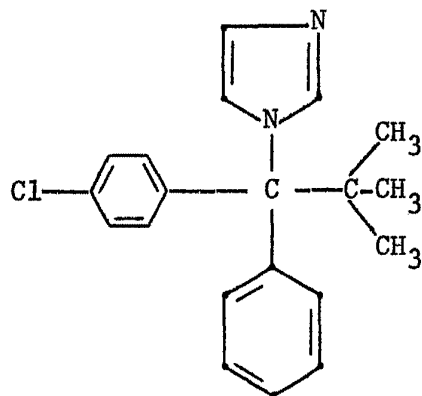
sin tratamiento

-

0

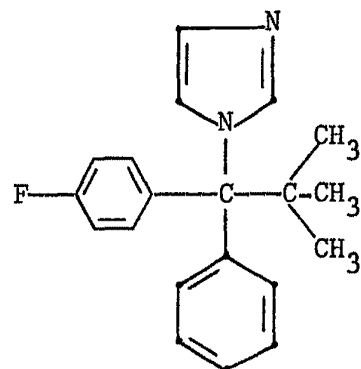


100



0,01

100



0,01

100



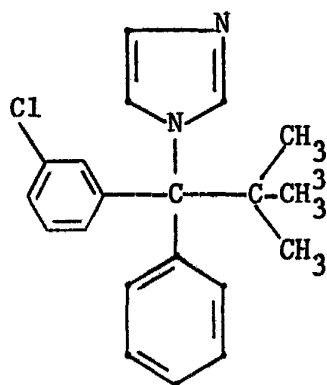
Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / roya de cereales

(micosis destructora de hojas)

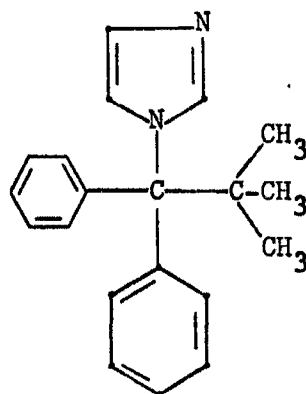
Tratamiento curativo.

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|



0,01

31



. HCl

0,01

100

Ejemplo G

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales.

(micosis destructora de hojas)

5. Para la producción de una preparación adecuada de sustancia activa, se recogen 3 partes en peso de sustancia activa en 50 partes en peso de dimetilformamida y se agregan 947 partes en peso de agua. Se diluye el



concentrado con una solución acuosa al 5 % de dimetilformamida hasta la deseada concentración final del líquido de rociada.

5. Para ensayar la eficacia protectora, primeramente se rocía la preparación de sustancia activa sobre plantitas de cebada del tipo Amsel en su estado de desarrollo de una hoja hasta su mojadura al grado de rocío. Después del secamiento, sobre las plantas de cebada se espolvorean conidias de *Erysiphe graminis* y se las colocan en un invernáculo.
- 10.

Para ensayar la eficacia curativa, se procede en forma correspondiente, pero en sucesión invertida. El tratamiento de las plantas de cebada en su estado de desarrollo de una hoja, es efectuado recién al cabo de 48 horas a contar de la contaminación con las conidias de *Erysiphe graminis*.

15. Después de 6 días de permanencia de las plantas a una temperatura de 22° C y a una humedad relativa del aire de 80 a 90 %, se evalúa el ataque de las plantas con pústulas de añublo y se determina el grado de eficacia de la preparación de sustancia activa en %, significando 0 % que el ataque es exactamente igual a aquél en las plantas testigos no tratadas, y 100 % que no se desarrolló ninguna pústula de añublo.
- 20.

25. Las sustancias activas, sus concentraciones en el líquido de rociada y el grado de eficacia surgen de la siguiente tabla:



Tabla

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales.
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento protectorio

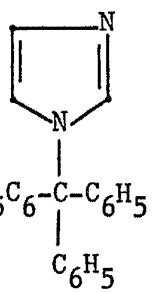
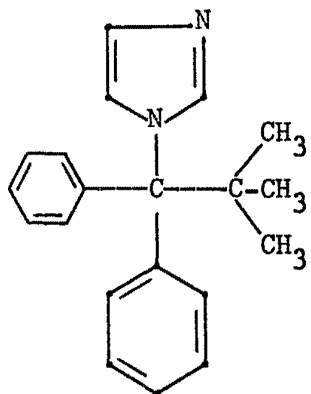
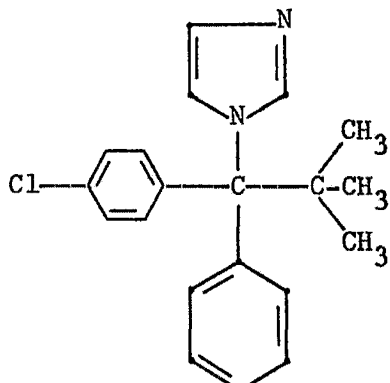
| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|---|--|------------------------|
| sin tratamiento | - | 0 |
|  | 0,03 | 20 |
| | 0,01 | 42 |
| (conocida) | | |
|  | 0,0001 | 50 |
| | 0,001 | 83 |
| | 0,01 | 92 |
|  | 0,001 | 79 |
| | 0,01 | 94 |

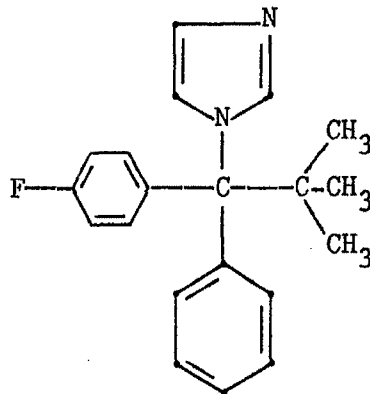


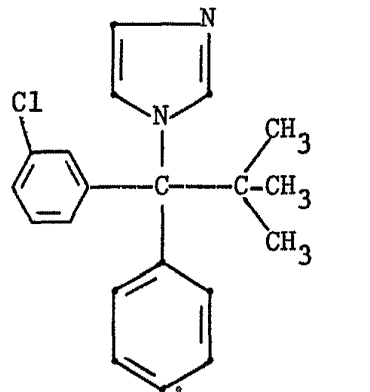
Tabla (continuación)

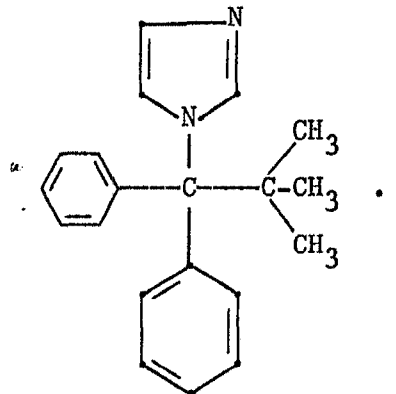
Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento protectorio.

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociado en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|

| | | |
|--|--------|-----|
|  | 0,0001 | 75 |
| | 0,001 | 92 |
| | 0,01 | 100 |

| | | |
|---|--------|-----|
|  | 0,0001 | 83 |
| | 0,001 | 92 |
| | 0,01 | 100 |

| | | |
|---|-------|----|
|  | 0,001 | 92 |
| | 0,01 | 92 |

. HCl



Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento protectorio.

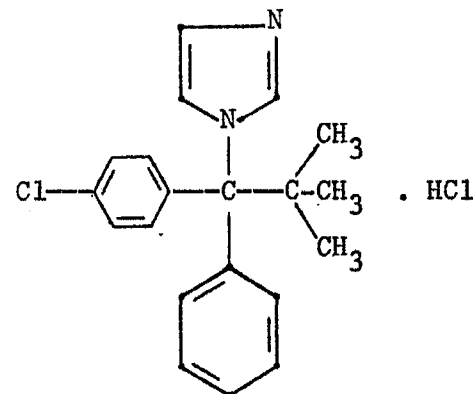
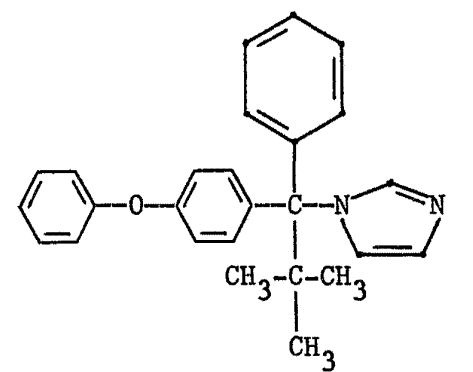
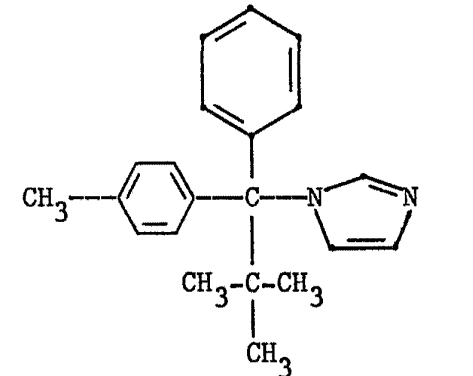
| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|---|--|------------------------|
|  | 0,0001 | 60 |
| | 0,001 | 97 |
| | 0,01 | 97 |
|  | 0,01 | 75 |
| | | |
|  | 0,001 | 83 |
| | 0,01 | 83 |

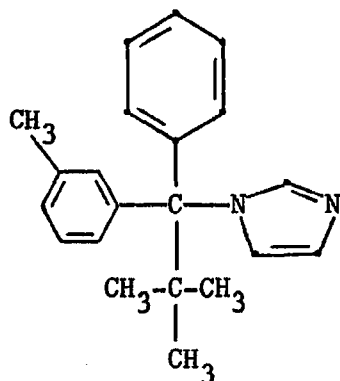


Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento preventivo

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|



| | |
|--------|-----|
| 0,0001 | 50 |
| 0,001 | 93 |
| 0,01 | 100 |

Tabla

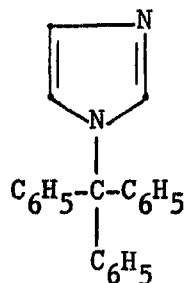
Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento curativo

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|

sin tratamiento

| | |
|---|---|
| - | 0 |
|---|---|



| | |
|-------|----|
| 0,001 | 12 |
| 0,01 | 31 |



Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales

(miosis destructora de hojas)

Tratamiento curativo

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|

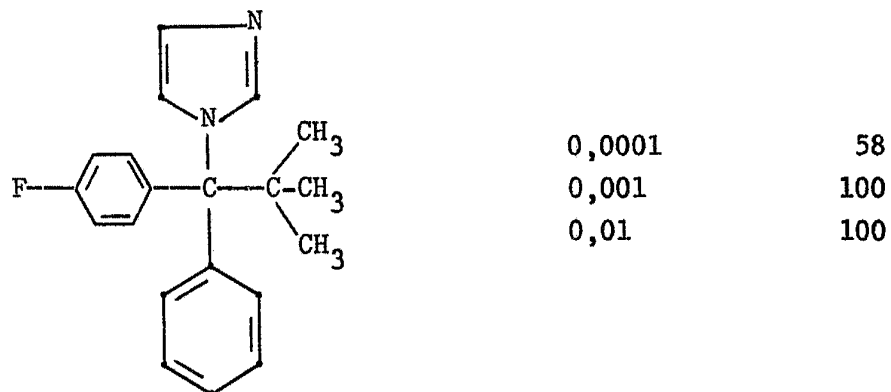
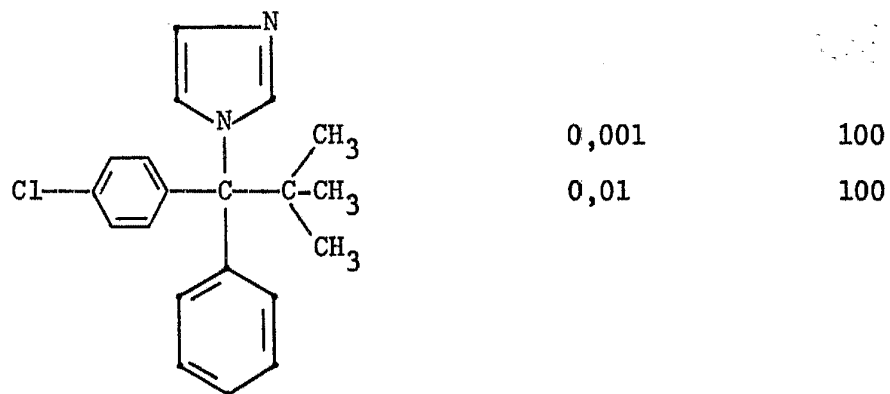
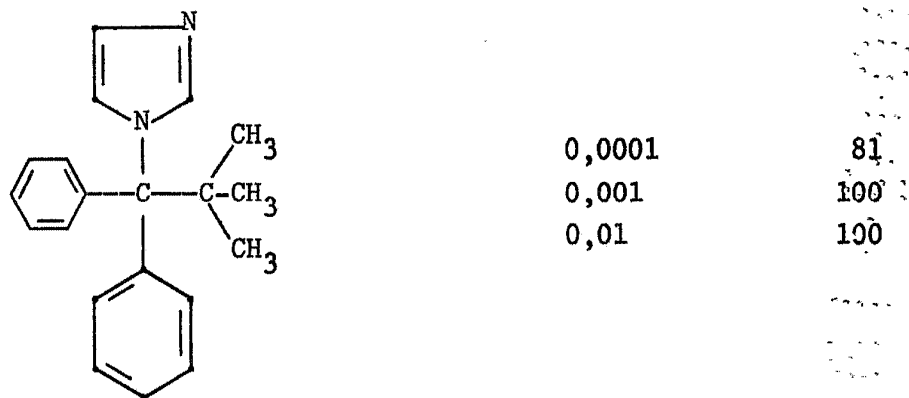




Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento curativo

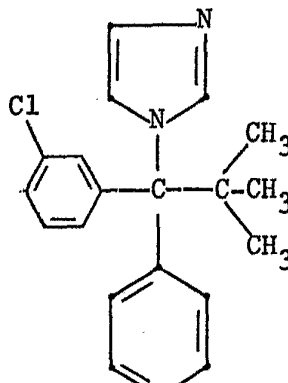
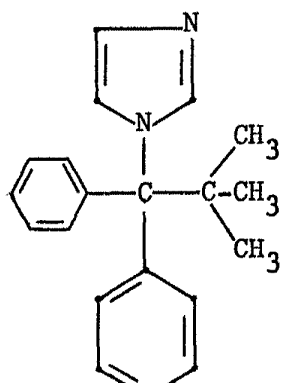
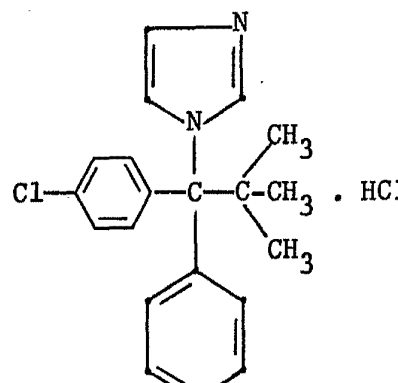
| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociado en % | grado de eficacia en % |
|---|--|------------------------|
|  | 0,001 | 100 |
| | 0,01 | 100 |
|  | 0,0001 | 27 |
| | 0,001 | 100 |
| | 0,01 | 100 |
|  | 0,0001 | 35 |
| | 0,001 | 100 |
| | 0,01 | 100 |



Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento curativo

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|

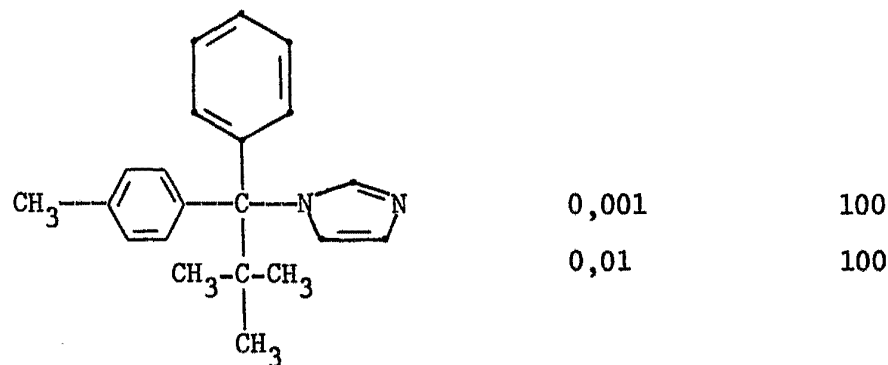
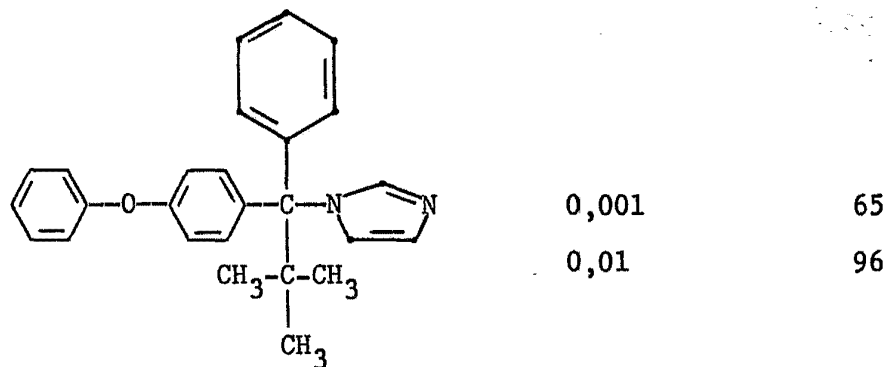
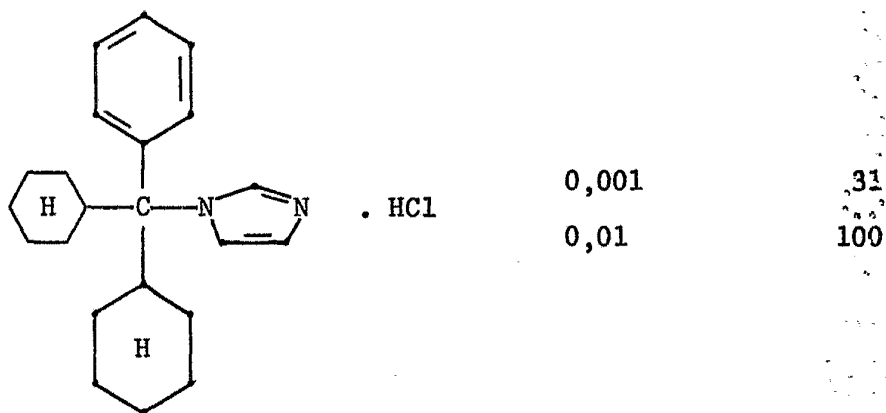


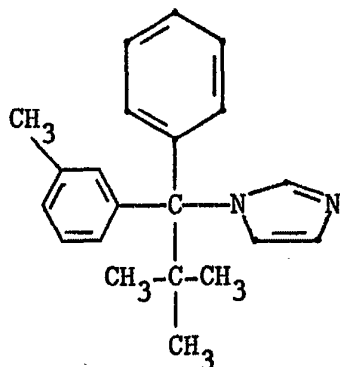


Tabla (continuación)

Ensayo de tratamiento de retoños / añublo de cereales
(micosis destructora de hojas)

Tratamiento curativo

| Sustancias activas | concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada en % | grado de eficacia en % |
|--------------------|--|------------------------|
|--------------------|--|------------------------|



0,001

96

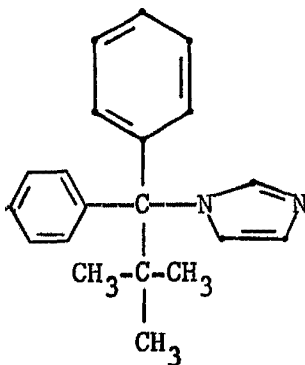
0,01

100

Ejemplos de preparación

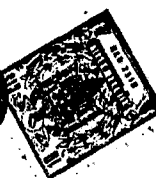
Los compuestos aplicables según la invención pueden producirse de la siguiente manera:

Ejemplo 1



5.

Se disuelven 25,9 g. (1 mol) de 1-cloro-1,1-difenil-2,2,2-trimetiletano del P.f. = 67° C en 200 ml de triamida de ácido hexametilfosfórico y se agita la



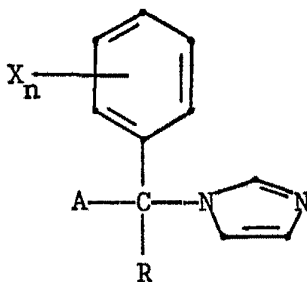
5.

solución con 68 g. (1 mol) de imidazol durante 15 horas a 170° C. Subsiguientemente se elimina el disolvente por destilación en vacío, se digiere el residuo con agua y se lo recoge por succión. Después de la recristalización en 20 veces su cantidad de ligroína, se obtienen 19,4 g. de 1-imidazolil-(1)-1,1-difenil-2,2,2-trimetil-etano del P.f. = 120° C. El rendimiento asciende a un 67 % de la teoría.

El producto puede obtenerse también al partirse del compuesto 1-bromo.

10.

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



Ejemplo

| No. | X | n | A | R | propiedades P.f. (° C) |
|-----|------|---|---|-----------------------------------|---------------------------|
| 2 | 4-Cl | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | 137 |
| 3 | 4-F | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | 117 |
| 4 | 3-Cl | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | 90 |
| 5 | - | 0 | | ter-C ₄ H ₉ | hidrocloruro, 170 |
| 6 | 4-Cl | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | hidrocloruro 181 |



Ejemplo

| No. | X | n | A | R | propiedades P.f. (° C) |
|-----|-----------------------|---|---|---|---------------------------|
| 7 | 4-CH ₃ | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | 139 |
| 8 | 3-CH ₃ | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | 87 |
| 9 | 4--O- | 1 | | ter-C ₄ H ₉ aceite, n _D ²⁴ = 1,5683 | |
| 10 | - | 0 | | | 150-153 |
| 11 | - | 0 | | | 85-86 |
| 12 | 4-CH ₃ -S- | 1 | | ter-C ₄ H ₉ hidrocioruro, | 140 |
| 13 | 2-CH ₃ | 1 | | ter-C ₄ H ₉ | 112 |
| 14 | - | 0 | | | 110 |
| 15 | - | 0 | | | 122 |
| 16 | - | 0 | | | hidrocioruro, 141 |
| 17 | - | 0 | | -CH ₃ hidrocioruro, | 195 |
| 18 | - | 0 | | | hidrocioruro, 117-119 |

388439



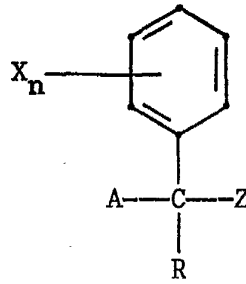
| Ejemplo No. | X | n | A | R | propiedades P.f. (° C) |
|-------------|---|---|---|---|--------------------------|
| 19 | - | 0 | | | 80-83 |
| 20 | - | 0 | | | hidrocloruro, 247-249 |
| 21 | - | 0 | | | 112 |

N O T A

5. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarse 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 20 de febrero de 1970, bajo el número P 20 07 794.5; acogiéndose por
10. 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, sobre: PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE COMPOSICIONES FUNGICIDAS; caracterizándose por lo siguiente:
15. 1.- Procedimiento para la obtención de composiciones fungicidas de N-arilalquil-imidazoles, caracterizado porque un compuesto de fórmula II

mE

388439



(II)

5. en la cual: A significa arilo, piridilo y radicales alifáticos o cicloalifáticos eventualmente sustituidos con hasta 12 átomos de carbono, R significa radicales alifáticos y cicloalifáticos con hasta 20 átomos de carbono, X significa alquilo, alcoxi, alquilmercapto con hasta 6 átomos de carbono cada uno, ariloxi y fenilo, radicales electronegativos y radicales básicos, y n representa un número de 0 a 2, en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, se hace reaccionar como mínimo con la cantidad teóricamente necesaria de un imidazol, en caso dado sustituido por restos de alquilo inferior, en un disolvente orgánico a temperaturas entre 20 y 150°, y esta sustancia resultante se mezcla con disolventes líquidos que contienen un material tensioactivo o con materiales de carga sólidos e inertes que, en caso dado, contienen un material tensioactivo, empleándose 0,1 - 95 partes en peso de material activo por 99,9 - 5 partes en peso de materiales.
- 10.
- 15.
20. 2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque como disolventes se emplean aromatos, aromatos clorados, parafinas, alcoholes, aminas o derivados amínicos; como materiales de carga sólidos, las molturaciones de minerales naturales o molturaciones de minerales sintéticos; y como materiales tensioactivos
25. emulsionadores no ionógenos o aniónicos, o lignina, des-

ME



lixiviaciones sulfúricas o metilcelulosa.

3.- Procedimiento para la obtención de composiciones fungicidas, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

5.

Esta Memoria consta de 40 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

30 MAYO 1973

FARBENFABRIKEN-BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

L. GOMEZ ACEBO Y MOJER
p. p. Firmado: L. Goeta Fernández

ME