



388523

P A T E N T E
D E
I N V E N C I O N

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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE AGENTES ANTIPARASITARIOS", a favor de la firma suiza CIBA-GEIGY AG, residente en BASILEA (Suiza).

= . =

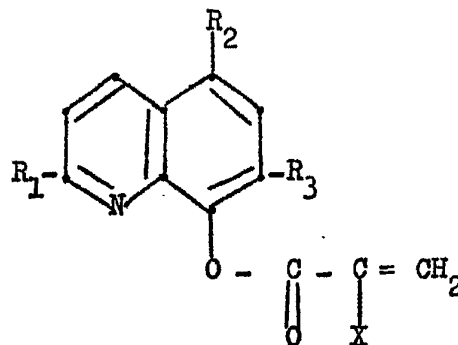
MEMORIA DESCRIPTIVA

Este invento se refiere a nuevos acrilatos de 8-oxiquinolina y 8-oxiquinaldina, a su preparación, a agentes antiparasitarios que contienen estos compuestos como materias activas y al empleo de estos compuestos para combatir a las talofitas.

5.

Dichas materias activas corresponden a la fórmula

10.



(I)

388523



en la que

- a) X representa hidrógeno o halógeno;
R₁ significa hidrógeno o metilo; y
Los sustituyentes
5. R₂ y R₃ significan hidrógeno o halógeno;
o en la que
b) X representa metilo;
R₁ significa hidrógeno; y
uno de los dos sustituyentes
10. R₂ y R₃ representa halógeno mientras el otro representa hidrógeno o ambos sustituyentes R₂ y R₃ representan halógeno,
además de que en el caso b) R₁, R₂ y R₃ significan sustituyentes distintos uno de otro cuando R₂ representa cloro o bromo;
15. o en la que
c) X representa metilo;
R₁ significa metilo; y
R₂ y R₃ significan hidrógeno o halógeno.
20. Por halógeno se entienden flúor, cloro, bromo y yodo.
Un grupo particularmente importante de compuestos lo forman los de la fórmula (I) en que R₁, R₂ y R₃ tienen el significado ya expuesto y X significa un átomo de hidrógeno, de bromo o de cloro.
25. De ellos se prefieren aquellos en los que X representa hidrógeno, cloro o bromo; R₁ representa hidrógeno o metilo y R₂ y R₃ representan cada uno hidrógeno, cloro, bromo o yodo.
30. Kirienco, Aristov y Schamchurin han investigado las posibilidades de polimerización de diversos metacrilatos de la 8-oxiquinolina (J. vsiesociusnaia obshtojei Jimi, na

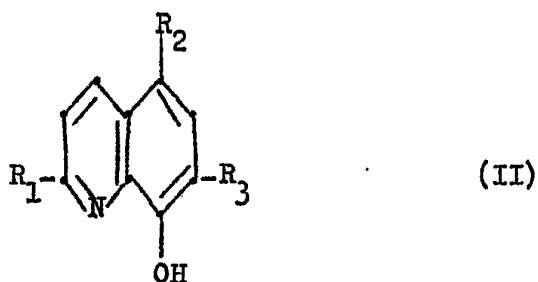


13, 238-239, 1968). Pudieron así comprobar relaciones entre el tipo de la sustitución del núcleo aromático y la tendencia a la autopolimerización.

5. La preparación de los compuestos de la fórmula (I) conformes a este invento se efectúa, sin tendencia a la resinificación, por uno de los métodos siguientes:

Se pueden preparar los compuestos por esterificación ordinaria de una 8-oxiquinolina correspondientemente substituida de la fórmula

10.



15.

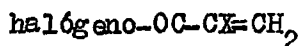
en la que

R₁, R₂ y R₃ tienen el significado expuesto en la fórmula (I),

con un derivado reactivo de ácido acrílico o metacrílico (de preferencia, el haluro de ácido) o también, cuando

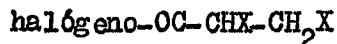
20.

en la fórmula para el producto final X ha de ser halógeno, con un haluro de ácido haloacrílico de la fórmula



o con un haluro de ácido halopropiónico de la fórmula

25.



(desdoblándose en el primer caso 1 mol de H-halógeno y en el segundo caso 1 mol de H-halógeno y consecutivamente o al mismo tiempo 1 mol de H-X, con formación del enlace doble), en presencia de un agente aceptor de ácido.

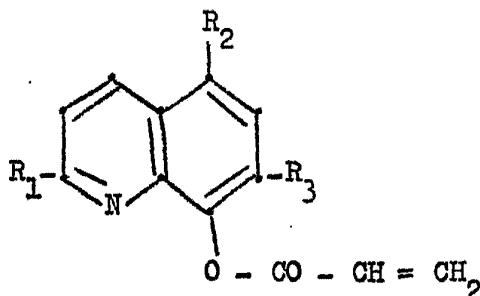
30.

Los compuestos de la fórmula (I) con X = halógeno pueden sintetizarse también por esterificación de la 8-oxi-



quinolina de la fórmula (II) con un derivado reactivo del ácido acrílico (de preferencia, el haluro de ácido) cuando en el producto originado al principio

5.



10.

se introduce el sustituyente X = halógeno por adición ulterior de un mol de X_2 al enlace doble y desdoblamiento de un mol de HX,

15.

La adición ulterior de halógeno al enlace doble se efectúa convenientemente en ácido acético glacial como disolvente. Se obtienen así rendimientos mucho mejores y productos finales más uniformes cuando durante la adición de halógeno se desactiva la función básica en III, el átomo de N básico del anillo oxiquinolínico, mediante protonización con un ácido fuerte (por ejemplo, con ácido sulfúrico).

20.

25.

La disociación de un mol de HX se efectúa por medio de carbonato o hidrocarbonato alcalino, por ejemplo en metanol o acetona acuosa. De preferencia, el desdoblamiento o disociación de HX se realiza sin embargo por medio de aminas terciarias apropiadas (por ejemplo, trietilamina) en disolventes inertes, no miscibles con el agua, como benceno, tolueno, xileno, etc. La amina terciaria puede utilizarse aquí en cantidad estequiométrica o en exceso, en cuyo caso se origina la sal HX de la amina terciaria. Pero de preferencia sólo se la utiliza en cantidad, por ejemplo, de 1 a 10% de la estequiométrica, y entonces se agrega, para completar

30.



Por talofitas se entienden en primer término los organismos inferiores, como las bacterias y los hongos.

5. Las materias activas de la fórmula (I) actúan muy bien contra los representantes de la clase de los ficomicetes (por ejemplo, hongos fitopatógenos como Botrytis y Piricularia), pero también contra varios otros agentes morbosos micóticos en los cereales, el maíz, el arroz, las hortalizas, los frutales y otros cultivos. También son utilizables como suplementos para los jabones y los detergentes, porque
10. combate los hongos cutáneos y al mismo tiempo son compatibles para la piel.

- Tienen acción especial contra los siguientes tipos de hongos: géneros de Cochliobolus miyabeanus, géneros de Corticium, géneros de Corospora, géneros de Alternaria,
15. Venturia inaequalis, Podosphaera leucotricha, Uromyces phaseoli, Cercospora apii, Cercospora beticola, Cercospora musae, Piricularia sp., Erysiphe cichoracearum, Penicillium digitatum, Sphaerotheca humuli, Diplocarpon rosae, Uncinula necator, Coccomyces hiemalis, Cladosporium carpophilum,
20. Erysiphe graminis hordei, Monolinia (Sclerotinia) laxa, Monolinia (Sclerotinia) fructicola, Piricularia oryzae, Puccinia recondita, P. coronata, P. glumarum, Puccinia graminis tritici, Aspergillus niger, Aspergillus terreus, Rhizoctonia, Fusarium y Verticillium. Esta enumeración no
25. pretende ser completa.

- Mas materias activas de este invento muestran asimismo acción fungitóxica para los hongos que atacan las plantas desde el suelo y ocasionan en parte traqueomicosis, como Fusarium cubense, Fusarium dianthi Verticillium alboatrum y Phialophora cinerescens.
- 30.

Los acrilatos de 8-oxiquinolina y 8-oxiquinaldina pueden aplicarse en forma de formulaciones corrientes, como,

388523



- concentrados emulgibles, polvos para aspersiones, pastas, polvos solubles, agentes de espolvoreo y granulados. Estos se preparan de manera conocida; por ejemplo, mediante extensión de las materias activas con disolventes y/o materiales de vehículo,
5. lo, eventualmente con empleo simultáneo de emulgentes y/o dispersantes (véase Agricultural Chemistry, marzo de 1960, páginas 35 a 38). En calidad de materias coadyuvantes entran en cuenta para ello, fundamentalmente: disolventes, como acaso los hidrocarburos aromáticos clorados (por ejemplo, xileno, benceno y clorobenceno), las parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), los alcoholes (por ejemplo, metanol) etanol y butanol), las aminas (por ejemplo, etanolamina y dimetilformamida) y el agua; materias de vehículo, por ejemplo polvos minerales naturales o sintéticos (caolines, arcilla, creta, talco,
10. ácido silícico muy disperso y silicatos); emulgentes, como los no ionógenos y los aniónicos (por ejemplo, ésteres de polioxietileno-ácido graso, ésteres de polioxietileno-alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo); y dispersantes, como lignina, lejías residuales de celulosa sulfítica y metil-
15. celulosa.
- 20.

Como ya se ha dicho antes, en las formulaciones que se han indicado las materias activas pueden hallarse en mezcla con otras sustancias activas conocidas.

- Las formulaciones contienen aquí, por lo general, entre 0,1 y 95 % en peso de materia activa, y preferentemente de
25. 0,5 a 90 %.

- Los agentes de este invento y respectivamente sus preparaciones se usan de la manera ordinaria; por ejemplo, mediante rociadura, espolvoreo, aspersion o nebulización. Para
30. ello la materia activa puede utilizarse, según la finalidad de empleo, en concentración de 5 a 0,00005 %. No obstante, en casos especiales es posible, o incluso necesario, rebasar en más



o en menos esta escala de concentración.

- Las materias activas de la fórmula (I) pueden mezclarse también con otros fungicidas corrientes en el comercio; se obtiene así en muchos casos un ensanchamiento del espectro de acción y en una serie de casos se obtienen también efectos sinérgicos.

En calidad de partícipes de la combinación entran en cuenta las materias activas siguientes, por ejemplo:

Compuestos inorgánicos

- 10. azufre elemental
 - polisulfuro amónico
 - polisulfuro sódico
 - polisulfuro bórico
 - polisulfuro cálcico y tiosulfato cálcico
- 15. hipoclorito cálcico
 - ácido bórico
 - decahidrato de tetraborato sódico (bórax)
 - cloruro de zinc
 - borato de magnesio
- 20. sulfato de níquel
 - cromato potásico
 - arseniato de plomo
 - cloruro de cadmio
 - carbonato de cadmio
- 25. Compuestos de cobre
 - óxido de cobre (I) (óxido cuproso)
 - caldo de Burdeos
 - pentahidrato de sulfato de cobre (II) (sulfato de cobre)
- 30. cloruro de cobre (II) básico (oxicloruro de cobre)
 - fosfato de cobre (II)
 - sulfato de cobre (II) tribásico (sulfato de cobre

388523



tribásico)

carbonato de cobre (II) básico (carbonato de cobre)

sulfato dihidracínico de cobre (II)

complejos cuproamínicos

5. mezcla de sulfato de cobre (II) y carbonato amónico
mezcla de cloruro de cobre (II) y sulfato de cobre
(II) básico
mezcla de carbonato de cobre (II) básico y sal de
zinc complejo de cromato de zinc y cobre (II)
(cromato de zinc y cobre)
10. complejo de cromato cálcico de cobre (II)-zinc-cad-
mio sal cúprica (II) del ácido oleico (oleato de
cobre) sales cúpricas (II) de ácidos grasos
sal cúprica (II) del ácido nafténico
15. sal cúprica (II) de la 8-hidroxiquinolina
sal cúprica (II) de la 1,2-naftoquinonoxima-(2)
sal cúprica (II) del salicilato de 3-fenilo

Compuestos de estaño y mercurio

- óxido de bis-(tri-n-butyl-estaño)
20. hidróxido de trifenil-estaño (hidróxido de fentina)
acetato de trifenil-estaño (acetato de fentina)
succinato de bis-(tributil-estaño)
cloruro de mercurio (I) (calomelano)
cloruro de mercurio (II)
25. óxido de mercurio (II)
complejo de cromato de zinc-mercurio
lactato de mercurio (II)
cloruro de etil-mercurio
acetato de 2-hidroxi-etil-mercurio
30. isotiocianato de etil-mercurio
bromuro de 3-etoxi-propil-mercurio
acetato de clorometoxipropil-mercurio



- cloruro de metoxietil-mercurio
silicato de 2-metoxi-etil-mercurio
sulfato de bis-(metil-mercurio)
acetato amónico de bis-(metil-mercurio)
5. acetato de etil-mercurio
acetato de 2-metoxietil-mercurio
fosfato de etil-mercurio
acetato de isopropilmetil-mercurio
cianuro de metil-mercurio
10. benzoato de metil-mercurio
N-ciano-N'-(metil-mercurio)-guanidina
pentaclorofenolato de metil-mercurio
2,3-dihidroxiopropilmercaptida de etil-mercurio
8-hidroxiquinolato de metil-mercurio (Ortho LM)
15. 1,4,5,6,7,7-hexaclorobiciclo[2.2.1]hept-5-en-2,3-di-
carboximida de N-(metil-mercurio)
1,4,5,6,7,7-hexaclorobiciclo[2.2.1]hept-5-en-2,3-
dicarboximida de N-(etil-mercurio)
sal sódica del tiosalicilato de etil-mercurio
20. p-toluensulfonanilida de N-(etil-mercurio)
acetato de fenil-mercurio (PAM)
propionato de fenil-mercurio
lactato trietanolamónico de fenil-mercurio (PAS)
fenilmercurio-urea
25. 1,4,5,6,7,7-hexaclorobiciclo[2.2.1]hept-5-en-2,3-di-
carboximida de N-(fenil-mercurio)
dimetilditiocarbamato de fenil-mercurio
formamida de fenil-mercurio
cloruro de fenil-mercurio
30. acetato de fenil-mercurio
benzoato de fenil-mercurio
borato de fenil-mercurio

388523



- hidróxido de fenil-mercurio
- yoduro de fenil-mercurio
- nitrato de fenil-mercurio básico
- monoetanolaminolactato de fenil-mercurio
- 5. salicilato de fenil-mercurio
- hidroximercurio-clorofenol
- hidroximercurio-triclorofenol
- hidroximercurio-nitrofenol
- N-fenilmercurio-etilendiamina
- 10. acetato monoetanolamónico de fenil-mercurio
- acetato de piridil-mercurio
- 8-hidroxiquinolato de difenil-mercurio
- complejo de mercurio (II) con fosfatos orgánicos
- mezcla de 2,3-dihidroxiopropilmercaptida de metil-mercurio y acetato de metil-mercurio
- 15. mezcla de 2,3-dihidroxiopropilmercaptida de etil-mercurio y acetato de etil-mercurio
- mezcla de hidroximercurio-clorofenol e hidroximercurio-nitrofenol
- 20. complejo orgánico de mercurio y cadmio

Otros compuestos orgánicos de metal

- succinato de cadmio
- di-n-propil-xantogenato de cadmio
- 8-hidroxiquinolato de cadmio
- 25. acetato de fenilamino-cadmio
- dilactato de fenilamino-cadmio
- sulfuro de metil-arsina
- octoato de zinc
- oleato de zinc

30. Compuestos orgánicos simples (alifáticos)

- formalina
- paraformaldehido

388523



- acroleína
bromuro de metilo
isotiocianato de metilo
tetrayodoetileno
5. 1,3-dicloropropeno e hidrocarburos de C₃ clorados
afines
1-cloro-3-bromopropeno-(1)
trans-1,4-dibromobuteno-(2)
1,3-dicloropropeno-(1)
1-cloro-2-nitro-propeno
10. 2-cloro-1-nitro-propeno
tricloronitrometano
diclorotetrafluoroacetona
sal sódica del ácido propiónico
sal cálcica del ácido propiónico
15. éster bis-beta-cloroetílico de ácido clorofumárico
ácido sórbico y su sal potásica
acetato de 2-propen-1,1-diol
2-aminobutano
acetato de dodecilguanidina (dodina)
ftalato de dodecilguanidina
20. alfa-cloroacetil-1,3-aminopropionitrilo
valinamida de alfa-bromoacetilo
1,2-dicloro-1-(metilsulfonil)-etileno
1,2-dicloro-1-(butilsulfonil)-etileno
trans-1,2-bis-(n-propilsulfonil)-etileno
25. Derivados de benceno
para- diclorobenceno
heptaclorobenceno (HCB)
1,2,4,5-tetracloro-4-nitrobenceno (tecnaceno)
pentacloronitrobenceno (quintoceno)
1,3,5-tricloro-2,4,6-trinitrobenceno



mezcla isomérica de 1,3,4-tricloro-2,6-dinitrobenceno
y 1,2,3-tricloro-4,6-dinitrobenceno
nitrilo de ácido 2,4,5,6-tetracloroisoftálico
tiocianato de 2,4-dinitrofenilo

5. difenilo
orto-nitrodifenilo
1-cloro-2,4-dinitronaftalina
acenafteno

Fenoles

10. 2,4,6-triclorofenol
2,4,5-triclorofenol
acetato de 2,4,5-triclorofenilo
cloroacetato de 2,4,5-triclorofenilo
triclorofenol, sal zincica
15. acetato de m-cresilo
2,3,4,6-tetraclorofenol
pentaclorofenol (PCP)
orto-dihidroxibenceno
2,4-dioxi-n-hexilbenceno
20. 2-fenilfenol
aldehido 3,5-dibromosalicílico
2-bencil-4-clorofenol
2,2'-dihidroxi-5,5'-dicloro-difenilmetano (diclorofeno)
2,2'-dihidroxi-3,3',5,5',6,6'-hexacloro-difenilmetano
25. sulfuro de 2,2'-dihidroxi-5,5'-dicloro-difenilo
sulfuro de 2,2'-dihidroxi-3,3',5,5'-tetracloro-difenilo
sulfuro de 2,2'-dihidro-3,3',5,5'-tetracloro-difenilo,
sal disódica
4-cloro-ortofenilfenol
30. 1,4-dicloro-2,5-dimetoxibenceno (clorneb)
anilida salicílica
salicilato de bismuto



trifluorometilsalicilanilida halogenada con cloro o bromo

salicilanilida bromada

(3,5-dimetil-4-clorofenoxi)-etanol

5.

Derivados de dinitrofenol

crotonato de 2-(1-metil-n-propil)-4,6-dinitrofenil-2-metilo (binapacriilo)

carbonato de 2-(1-metil-n-propil)-4,6-dinitrofenilisopropilo (dinobuton)

10.

crotonato de 2-(1-metil-n-heptil)-4,6-dinitrofenilo (dinocap)

carbonato de metil-2,6-dinitro-4-(1-etil-hexil)-fenilo
+ carbonato de metil-2,6-dinitro-4-(1-propil-pentil)-fenilo (dinocton)

15.

butirato de 4-nonil-2,6-dinitro-fenilo

tiocarbonato de S-metil-2-(1-metil-n-heptil)-4,6-dinitrofenilo

Derivados de anilina

2,6-dicloro-4-nitroanilina (diclorano)

20.

carbamato de 2-cianoetil-N-fenilo

carbamato de propinil-N-fenilo

alfa-(2-bromoacetoxi)-acetanilida

Derivados de quinona

2,3,5,6-tetracloro-benzoquinona-(1,4) (cloranilo)

25.

2,3-dicloro-naftoquinona-(1,4) (diclon)

2-amino-3-cloro-naftoquinona-(1,4)

2-cloro-3-acetamino-naftoquinona-(1,4)

4-metil-2,3,5,10-tetrahidro-3,5,10-trioxo-4H4-H-nafto-(2,3-b)-1,4-tiacina

30.

2,3,6,7-tetracloro-4a,8a-epoxi-1,2,3,4,4a,8a-hexahidro-1,4-metanonaftalin-5,8-diona



quinonoximobenzoil-hidrazona (benquinox)

Derivados de triclorometiltio

- N-(triclorometiltio)ftalimida (folpet)
N-(triclorometiltio)-ciclohex-4-en-1,2-dicarboximida
5. (captan)
N-(1,1,2,2-tetracloroetiltio)-ciclohex-4-en-1,2-dicarboximida (captafol)
N-metansulfonil-N-triclorometiltio-para-cloroanilina
N'-diclorofluorometiltio-N,N-dimetil-N'-fenilsulfamida
10. (diclofluanida)
S-(2-piridil-1-óxido)-S'-triclorometil-disulfuro, clorhidrato

Fosfatos orgánicos

- O,O,O-trimetil-tiofosfato
15. O,O-dietyl-ftalamida-fosfono-tioato
5-amino-bis-(dimetilamido)-fosfinil-3-fenil-1,2,4-triazol (triamifos)
5-metilamino-bis-(dimetilamido)-fosfinil-3-fenil-1,2,4-triazol
20. O,O-dietyl-O-2-piracínil-fosfotioato
O-etyl'S,S-difenil-ditiofosfato
O-etyl-S-bencil-fenilditiofosfonato
O,O-dietyl-S-bencil-tiofosfato

Ditiocarbamatos

25. sal cáncica del ácido ditiocarbácínico
N-metil-ditiocarbamato sódico (metam)
N-metoxietil-ditiocarbamato sódico
N,N-dimetil-ditiocarbamato sódico (DDC)
N,N-dimetil-ditiocarbamato amónico
30. N,N-dimetil-ditiocarbamato de zinc (ziram)
N,N-dimetil-ditiocarbamato de hierro (ferbam)
N,N-dimetil-ditiocarbamato de cobre



- etilen-1,2-bis-ditiocarbamato disódico (nabam)
- etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de zinc (zineb)
- etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de hierro
- etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de manganeso (II)
- 5. (manec)
- etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de calcio
- etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de amonio
- propilen-1,2-bis-ditiocarbamato de zinc (mezineb)
- (propineb)
- 10. etilen-1,2-bis-ditiocarbamato de bis-(dimetiltiocarbamilo)
- complejo constituido por (maneb) y sal cincica (mancozeb)
- monosulfuro de tetraetiltiuramo
- bis-(N,N-dimetilditiocarbamilmercapto)-metilarsina
- 15. disulfuro de tetrametilriuramo (tiram)
- disulfuro de dipirrolidiltiuramo
- disulfuro de N,N'-bis-(dimetilamino)-tiuramo
- sulfuro de polietilentiuramo
- 20. complejo constituido por (zineb) y disulfuro de polietilentiuramo (metiram)

O-heterociclos

- éter bis-(3,4-dicloro-2(5)-furanofílico) (anhídrido mucoclórico)
- 25. 2-metoximetil-5-nitrofurano
- 5-nitro-furfuraldoxima-(2)
- 5-nitro-furfuril-amidoxima-(2)
- 1-oxi-3-acetil-6-metil-ciclohexen-(5)-diona-(2,4)
- (ácido dehidroacético)

1-N-heterociclos

- 30. 3-[2-(3,5-dimetil-2-oxiciclohexil)-2-hidroxietyl]-glutarimida (cicloheximida)



- ftalimida
- 1-óxido de piridin-2-tiol o 1-hidroxi-piridin-2-tiona
- sal cínica del 1-óxido de piridin-2-tiol
- sal manganésica (II) del 1-óxido de piridin-2-tiol
5. cloruro de S-1-(1-óxido-2-piridil)-isotiuronio
- alfa, alfa-bis-(4-clorofenil)-3-piridinometanol
- (parinol)
- 8-hidroxi-quinolina (8-quinolinol)
- sulfato de 8-hidroquinolina (quinosol)
10. salicilato de benzoil-8-hidroxi-quinolina
- 3,4-diclorobenzoato de 3-(2-metilpiperidino)-propilo
- 6-etoxi-1,2-dihidro-2,2,4-trimetil-quinolina
- (etoxiquina)
- bromuro de N-lauril-isoquinolinio
15. cloruro de 9-(para-n-hexiloxifenil)-10-metil-acridinio
- para-toluensulfonato de 9-(para-n-hexiloxifenil)-10-
- metil-acridinio

2- y 3-N-heterociclos

- acetato de 2-n-heptadecilimidazolidina (gliodin)
20. 1-hidroxi-etil-2-heptadecilimidazolidina
- 1-fenil-3,5-dimetil-4-nitrosopirazol
- 1-para-clorofenil-3,5-dimetil-4-nitrosopirazol
- 1-para-sulfamilfenil-3,5-dimetil-4-nitrosopirazol
- N-(1-fenil-2-nitropropil)-piperacina
25. 2-dimetilamino-6-metil-5-n-butil-4-hidroxi-pirimidina
- N-dodecil-1,4,5,6-tetrahidropirimidina
- N-dodecil-2-metil-1,4,5,6-tetrahidropirimidina
- 2-n-heptadeciltetrahidropirimidina
- clorhidrato de cloruro de 1-(4-amino-4-propil-5-pirimi-
30. dil-metil)-2-metilpiridinio
- 2-(2'-fural)-bencimidazol (furidazol)
- ferricianuro de 3-dodecil-1-metil-2-fenilbencimidazolio



388523

N-(butilcarbamoil)-carbamato de metil-N-bencimidazol-2-
-ilo (benomilo)

2-(orto-cloroanilino)-4,6-dicloro-triacina simétrica
2-etilamino-6-metil-5-n-butyl-4-hidroxi-pirimidina

5.

S-heterociclos

5-cloro-4-fenil-1,2-ditio-3-ona

2,3-diciano-1,4-ditia-antrequinona (ditianona)

2-(4-tiazolil)-bencimidazol

NO-, NS- y OS-heterociclos

10. 4-(2-clorofenilhidrazono)-3-metil-5-isoxazolona
(drazoxolona)

tiazolidinon-4-tiona-(2) (rodanina)

3-(para-clorofenil)-5-metil-rodanina

3,5-dimetiltetrahidro-1,3,5-tiadiacino-2-tiona (dazomet)

15. 3,3'-etilen-bis-(tetrahidro-4,6-dimetil)-2H-1,3,5-
-tiadiacino-2-tiona) (milneb)

3-bencilidenamino-4-feniltiazolino-2-tiona

6-clorobenzotiazol-2-tiol, sal cálcica

diclorhidrato de 6-beta-dietilamino-etoxi-2-dimetilamino-
-benzotiazol

20.

monoetanolamonio-benzotiazol-2-tiol

laurilpiridinio-5-cloro-2-mercaptobenzotiazol

sales cálcicas y sódicas del 2-mercaptobenzotiazol y del
ditiocarbamato de dimetilo

25. diclorhidrato de 6-(beta-dietilaminoetoxi)-2-dimetila-
minobenzotiazol

3-triclorometiltiobenzotiazolona

3-triclorometiltiobenzoxazolona

3-(triclorometil)-5-etoxi-1,2,4-tiadiazol

6-metil-2-oxo-1,3-ditio[4,5-b]-quinoxalina

30.

(quinometionato)

2-tio-1,3-ditio[4,5-b]-quinoxalina (tioquinox)

2,3-dihidro-5-carboxanilido-6-metil-1,4-oxatina

388523



1,1-dióxido de 3,3,4,4-tetracloro-tetrahidrotiofeno
4,4-dióxido de 2,3-dihidro-7-carboxanilido-6-metil-
1,4-oxatina

Compuestos de amonio cuaternarios

5. bromuro de cetil-trimetilamonio
cloruro de n-alquilo (C₁₂, C₁₄, C₁₆)-dimetilbencilamonio
bromuro de alquenil-dimetiletilamonio
bromuro de dialquil-dimetilamonio
10. cloruro de alquil-dimetilbencilamonio
cloruro de alquilo (C₉-C₁₅)-tolilmetiltrimetilamonio
cloruro de di-isobutilresoxietoxietildimetilbencilamonio
cloruro de para-di-isobutilfenoxietoxietildimetilbencilamonio
15. bromuro de benzoiltrimetilamonio

Antibióticos fungicidas

- gliotoxina
20. 2,4-diguanidino-3,5,6-trihidroxiciclohexil-5-deoxi-2-O-(2-deoxi-2-metilamino-alfa-L-glucopiranosil)-3-C-formil-beta-L-lixopentano-furanosida
(estreptomocina)
- 7-cloro-4,6-dimetoxicumaran-3-on-2-spiro-1'-(2'-metoxi-6'-metilciclohex-2'-en-4'-ona)
(griseofulvina)
25. 4-dimetilamino-1,4,4alfa,5,5alfa,6,11,12alfa-octahidro-3,5,6,10,12,12alfa-hexahidroxi-6-metil-1,11-dioxo-2-naftacencarboximida
(oxitetraciclina)
30. 7-cloro-4-dimetilamino-1,4,4alfa,5,5alfa,6,11,12alfa-octahidro-3,6,10,12,12alfa-pentahidroxi-6-metil-1,11-dioxo-2-naftacencarboximida
(clorotetraciclina)



- (pimaricina)
- (lancomidina)
- (fleomicina)
- (kasugamicina)
- 5. (fitoactina)
D(-)-treo-2,2-dicloro-N-[beta-hidroxi-alfa-(hidroximetil)-p-nitrofen-etil]-aretamida
(cloramfenicol)
S-bencilamino-bencensulfonato de blasticidina
- 10. Diversos
N-(3-nitrofenil)-itaconimida
ácido fenoxiacético
p-dimetilamino-bencendiazosulfonato sódico
acroleino-fenilhidrazona
- 15. 2-cloroacetaldehido-(2,4-dinitrofenil)-hidrazona
2-cloro-3-(tolilsulfonil)-propionitrilo
1-cloro-2-fenil-pentan-diol-(4,5)-tione-(3)
complejo de p-nonilfenoxipolietilenoxietanol-yodo
clorhidrato de (alfa-nitrometil)-o-clorobenciltio-
-etilamina
- 20. 3-(p-terciobutil-fenilsulfonil)-acrilonitrilo
octaclorociclohexenona
alcohol pentaclorobencílico
acetato de pentaclorobencilo
- 25. pentaclorobenzaldehido-cianhidrina
2-norcanfanometanol
2,6-bis-(dimetilaminometil)-ciclohexanona
decaclorooctahidro-1,3,4-meteno-2H-diclobuta[cd]-
-pentalen-2-ona
- 30. cloruro de 1-(3-cloralil)-3,5,7-triaza-lazonia-
adamantano
alquitrán de hulla y alquitrán de altos hornos

388523



Mezclas

- mezcla de sulfato de níquel y maneb
- mezcla de maneb y mercaptobenzotiazol
- mezcla de zineb y mercaptobenzotiazol
- 5. mezcla de zineb y cloruro de níquel (II)
- mezcla de zineb y sulfato de níquel (II)
- mezcla de ziram y sulfato de cobre básico
- mezcla de ziram-zinc-mercaptobenzotiazol
- mezcla de tiram e hidrato de cloruro de cadmio
- 10. mezcla de tiram e hidroximercurio-clorofenol
- mezcla de tiram y acetato de fenilmercurio
- mezcla de sulfuro de polietilen-bis-tiuramo y oxiclo-
ruro de cobre
- mezcla de bis-(dimetilditiocarbamato) de metilarsina,
ziram y tiram
- 15. mezcla de folpet y acetato de fenilmercurio
- mezcla de dodina, ferbam y azufre
- mezcla de ditianona y oxiclорuro de cobre
- mezcla de diclon, ferbam y azufre
- 20. mezcla de dinocap y dinitrooctilfenol
- mezcla de captan-quintoceno y sulfato de cobre tribá-
sico
- mezcla de propionato de cadmio y propionato de fenil-
mercurio
- 25. mezcla de formaldehído y urea
- mezcla de dilactato de fenilamonio-cadmio y formamida
de fenilmercurio
- mezcla de sulfato de cobre básico y sales de zinc.

Ejemplo 1

30. Preparación de acrilatos de oxiquinolina

Se agitó 1 kg de 5-cloro-7-bromo-8-oxiquinolina
(3,87 moles) en 4 litros de benceno y se trató la mezcla con

388523



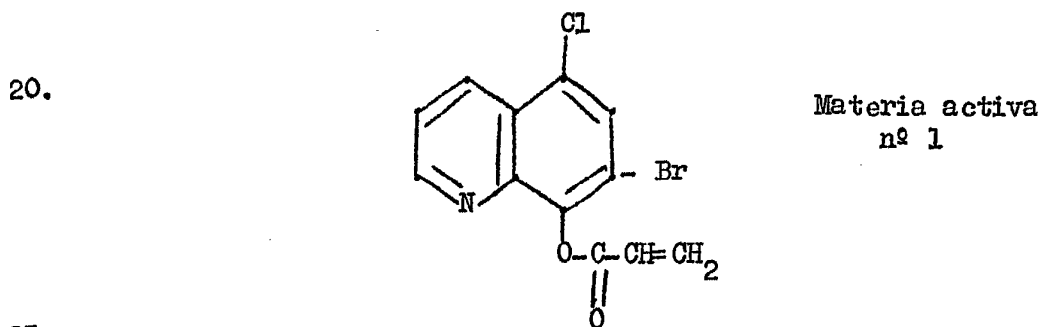
0,411 kg de trietilamina destilada (4,06 moles).

5. Agitando bien, se hicieron afluir en el curso de media hora 0,353 kg de cloruro de ácido acrílico (3,90 moles) disueltos en 1 litro de benceno. Se prosiguió la agitación por una hora, a 70° C de temperatura interna, y luego se dejó enfriar hasta la temperatura del ambiente y, por succión, se separó del clorhidrato de trietilamina precipitada el producto bruto.

10. Se añadieron al filtrado 400 cc de lejía sódica y se agitó por 42 horas para que ambas fases se mezclaran bien entre sí. Luego se separó de la sal sódica (alrededor de 80 G), por succión, la 5-cloro-4-bromo-8-oxiquinolina inalterada.

15. Se separaron las fases en el filtrado y la fase benéfica se neutralizó por agitación con 3 x 300 cc de agua, se trató con carbón activo y se secó con Na₂SO₄, después de lo cual se eliminó el disolvente en el evaporador giratorio.

Se obtuvieron, como residuo cristalino, 1,066 kg (= 88 % de la teoría) de



25. Punto de fusión después de la recrystalización: 100,5 - 101,5° C.

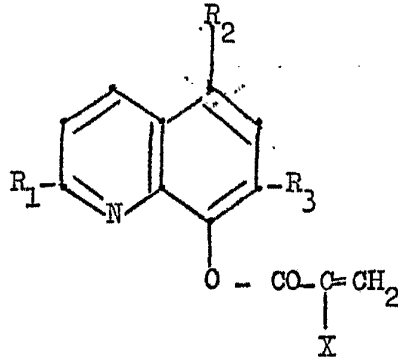
El compuesto es recrystalizable en ciclohexano (1 g/alrededor de 4 cc) o en abundancia de éter de petróleo, con lo cual aparece en cristales grandes.

30. De manera análoga se obtuvieron las sustancias de la fórmula

388523



5.



(III)

10.

15.

20.

25.

Com- pues to No	R ₁	R ₂	R ₃	X	Constante física
2	H	Cl	Cl	H	P. de f. 80 - 81°C
3	H	Cl	J	H	P. de f. 102-103°C
4	H	Cl	H	H	P. de f. 78 - 80°C
5	H	Br	Br	H	P. de f. 114-116°C
6	H	J	J	H	P. de f. 118-120°C
7	H	H	H	H	P. de f. 51 - 52°C
8	CH ₃	Cl	Cl	H	P. de f. 77 - 79°C
9	CH ₃	H	H	H	Kp ₁₀ 176-178°C
10	CH ₃	Br	H	CH ₃	P. de f. 58 - 61°C
11	CH ₃	Br	Br	CH ₃	P. de f. 75 - 78°C
12	H	Cl	Br	CH ₃	P. de f. 74 - 75°C
13	H	Cl	J	CH ₃	P. de f. 93 - 95°C
14	H	J	J	CH ₃	P. de f. 111-113°C
15	CH ₃	H	H	CH ₃	P. de f. 68 - 70°C
16	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	P. de f. 80 - 82°C

388523



Ejemplo 2

Síntesis de alfa-bromoacrilatos de oxiquinolina

Mientras se refrigeraba con hielo, se disolvieron en 40 cc de ácido acético glacial 8,17 g de ácido sulfúrico al 5. 96 %.

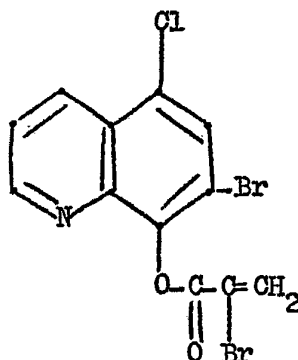
A 50 g de la materia activa nº 1 disueltos en 140 cc de ácido acético glacial se añadió la solución anterior, despacio, refrigerando con hielo y agitando. Luego, con refrigeración externa por agua y agitando, se instilaron en una hora, a 10. la temperatura del ambiente, 25,8 g de bromo en 30 cc de ácido acético glacial (viraje al rojo). Se agitó a la temperatura del ambiente por 2 horas todavía, con lo que se produjo un intenso aclaramiento del color hacia el amarillo claro. Se destiló entonces el disolvente en el evaporador giratorio, con vacío de 15. chorro de agua y a 40-50°C de temperatura del baño.

El residuo de la destilación (alrededor de 100 a 110 g), que contenía ácido acético glacial, se agitó con 200 cc de benceno y la suspensión resultante se deslió, con buena centrifugación y a la temperatura del ambiente, en 250 cc de lejía sódica 20. ca 4-n; el calor exotérmico que se produjo se compensó por adición de hielo. Se agitó por un cuarto de hora todavía y a continuación se añadieron 2 cc de trietilamina y se prosiguió agitando por media hora más, a fin de que ambas fases se mezclaran bien entre sí. Luego se filtró por succión y se lavó con un poco de benceno. Las fases se separaron en el filtrado. La fase 25. bencénica se lavó con 2 x 100 cc de agua (con lo que quedó alcalina) y se la trató con Na_2SO_4 suficiente y con 20 g de carbón activo (intensa aclaración del color). Por último, se destiló el disolvente en el evaporador giratorio.

30. Después de la recristalización en ciclohexano se obtuvo el 70 % de la teoría de



5.



Materia activa
nº 17

Punto de fusión
110-112º C

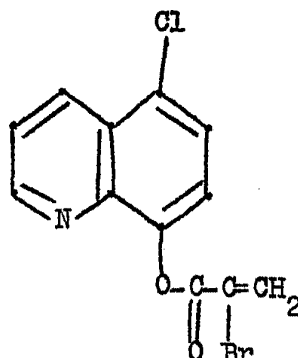
10.

Ejemplo 3

A 72 partes de 5-cloro-8-hidroxiquinolina y 100 partes de trietilamina en 1000 volúmenes de tolueno se añadieron a gotas, en el curso de media hora, 126 partes de cloruro de 1,2-dibromopropionilo en 200 volúmenes de tolueno, con lo cual la temperatura subió hasta 55º C. Al cabo de dos horas se filtró para separar el clorhidrato de trietilamina precipitado y el bromhidrato de trietilamina precipitado y se concentró el filtrado en el evaporador giratorio, con presión reducida. Por adición de 200 volúmenes de éter de petróleo (punto de ebullición, 50 a 70º C) y raspado con la varilla de vidrio, se hizo cristalizar el producto reaccional de la fórmula

15.

25.



Materia activa
nº 18

Punto de fusión: 100-103º C; 116 g (93 % de la teoría en relación a la 5-cloro-8-hidroxiquinolina).

30.

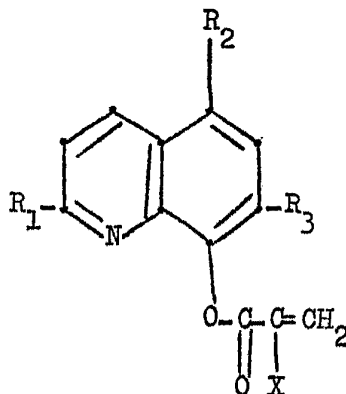
De manera análoga se obtuvieron las sustancias de la



388523

fórmula

5.



(V)

10.

15.

20.

25.

Com- pues to Nº	R ₁	R ₂	R ₃	X	Constante física
19	H	Cl	Cl	Br	P. de f. 99-100°C
20	H	H	H	Br	P. de f. 84-86°C
21	H	Br	Br	Br	P. de f. 108-110°C
22	H	Cl	J	Br	P. de f. 145-149°C
23	H	J	J	Br	P. de f. 119-122°C
24	CH ₃	H	H	Br	P. de f. 49-51°C
25	H	Cl	H	Cl	P. de f. 84-87°C
26	H	Cl	Cl	Cl	P. de f. 98-100°C
27	H	Cl	Br	Cl	P. de f. 97-101°C
28	H	Cl	J	Cl	P. de f. 129-131°C
29	H	H	H	Cl	P. de f. 68-72°C
30	H	Br	Br	Cl	P. de f. 109-113°C

Ejemplo 4

Se disuelven 20 g de materia activa en una mezcla de 48 g de alcohol diacetónico, 16 g de xileno y 16 g de un producto de condensación, de peso molecular alto y anhidro, a base de óxido de etileno y una mezcla de ácidos grasos superiores. Este

388523



concentrado puede diluirse con agua para formar emulsiones fungicidas y caldos y aspersion fungicidas de cualquier concentracion que se desee.

Ejemplo 5

5. Se mezclan 80 g de materia activa con 2 a 4 g de un humectante (por ejemplo, sal sódica de un monosulfato de éter alquilpoliglicólico), 1 a 3 g de un coloide protector (por ejemplo, lejía residual sulfítica) y 15 g de un material de vehículo sólido, inerte (por ejemplo, caolín, bentonita, creta o kieslgur) y se muele la mezcla finamente en un molino apropiado.
10. El polvo humectable que resulta, después de desleído con agua da una suspensión fungicida muy estable.

Ejemplo 6

15. Se mezclan 5 g de materia activa con 95 g de carbóno cálcico y se muele la mezcla. El producto se emplea como agente fungicida de esparcimiento.

Ejemplo 7

20. Se mezclan 5 g de materia activa con 95 g de un material pulverulento de vehículo (por ejemplo, arena o carbonato cálcico) y se moja la mezcla con 1 a 5 g de agua o de isopropanol. A continuación se la granula. Antes de la granulación puede agregarse a esta mezcla o a una más rica en materia activa (por ejemplo, de 10 g de materia activa y 90 g de carbonato cálcico) un múltiplo (por ejemplo, de 100 a 900 partes) de un abono artificial, eventualmente soluble en agua (por ejemplo, sulfato amónico).
- 25.

Ejemplo 8

30. Se muelen muy finamente en un molino de bolas 20 g de materia activa y 80 g de talco. La mezcla resultante sirve de agente fungicida de espolvoreo.

388523



Ejemplo 9

Mezclando 50 g de materia activa, 45 g de xileno, 2,5 g de un producto de condensación de óxido de etileno, con un alquilfenol y 2,5 g de una mezcla de las sales sódicas del ácido dodeciloxietyl-sulfúrico, se obtiene una solución fungicida emulgable en agua.

Ejemplo 10

Se cultivaron en el invernadero, unas plantas de tomate, que luego se rociaron profilácticamente, por una vez, con un caldo acuoso para aspersiones según el Ejemplo 4, que contenía 0,1 % de la materia activa nº 17. Dos días después, las plantas así tratadas se inficionaron con conidios de Alternaria solani (E. et M.) J. et Gr. y se mantuvieron por dos días en una cámara de humedad. Después de dos días más de incubación en el invernadero, las plantas tratadas con el preparado de ensayo mostraron una afectación micótica del 5 %, mientras las plantas de control, no tratadas, aparecían atacadas en el 100 %.

Ejemplo 11

Se cultivaron en el invernadero plantas de arroz, que luego se rociaron profilácticamente, por una vez, con un caldo acuoso para aspersiones según el Ejemplo 4, que contenía 0,1 % de una materia activa; dos días después, las plantas así tratadas se inficionaron con conidios de Piricularia oryzae Bri. et Cav. Al cabo de 7 días de incubación en una cámara de humedad, las plantas tratadas mostraron el ataque micótico que a continuación se expone, mientras las plantas de control, no tratadas, estaban afectadas en el 100 %.

388523



Compuesto Nº	Ataque	Compuesto Nº	Ataque
20	10%	30	10%
18	10%	6	5%
27	5%	23	5%
5	5%	16	10%

Ejemplo 12

Se cultivaron en el invernadero unas plantas de pepino, que se rociaron una vez, profilácticamente, con un caldo acuoso para aspersiones según el Ejemplo 4, el cual contenía 0,1 %, 0,01 % y 0,001 % de una materia activa. Dos días más tarde, las plantas así tratadas se inficionaron con esporas de Erysiphe cichoriacearum D.C. Al cabo de 12 a 14 días, las plantas tratadas con las concentraciones que se han indicado mostraban sólo escasa afectación, mientras que las plantas de control, no tratadas, estaban atacadas en el 100 %.

Compuesto Nº	Concentración	Ataque
18	0,1 %	10 %
19	0,01%	5 %
1	0,001%	5 %
17	0,01%	5 %
27	0,01%	5 %
3	0,001%	5 %
13	0,01%	5 %
5	0,01%	5 %
21	0,01%	5 %
30	0,01%	5 %
6	0,01%	5 %
16	0,01%	5 %

388523



Ejemplo 13

Se cultivaron en el invernadero plantas de habichuelas y se las regó por una vez con un caldo acuoso según el Ejemplo 4, que contenía 0,1 % de una materia activa. Dos días después se inficionaron con uredosporas de Uromyces phaseoli (Pers.) Wint. las plantas así tratadas y se las mantuvo por 48 horas en una cámara de humedad. Al cabo de 10 a 14 días de incubación, las plantas tratadas mostraron la afectación micótica que se expone a continuación, mientras que las plantas de control, no tratadas estaban atacadas en el 100 %.

Compuesto Nº	Ataque	Compuesto Nº	Ataque
7	5 %	3	5 %
20	5 %	22	5 %
4	5 %	5	5 %
18	5 %	21	5 %
2	5 %	30	5 %
19	5 %	9	10 %
1	5 %	24	5 %
27	5 %	8	5 %

Ejemplo 14

En cajas de Petri que se habían forrado con papel de filtro humedecido se depositaron cada vez tres hojas de Vicia faba totalmente desarrolladas y del mismo tamaño, que se habían regado hasta gotear, en un aparato rociador, con un caldo de 0,1% de substancia activa, preparado con la substancia activa nº 30, formulada como polvo al 10 % para aspersiones (10 WP). Cuando las hojas estuvieron otra vez secas, se inficionaron con una suspensión de esporas del hongo (concentración: 100.000 esporas por cc), normalizada y recién preparada, y se mantuvieron por 48 horas en atmósfera húmeda y a 20°C. Al cabo de este tiempo muestra-

388523



ron manchas negras, al principio puntiformes, que pronto se extendieron. El número y el tamaño de los lugares de infección sirvieron de escala para evaluar la actividad de la substancia en ensayo. Mientras que los controles no tratados aparecieron atacados en el 100 %, las hojas tratadas con el compuesto nº 30 sólo estaban afectadas en el 5 %.

Ejemplo 15

Se determinó la actividad antibacteriana, en la prueba de dilución, procediendo de la manera siguiente:

10. Bacteriostasis y bactericidia

a) Se disolvieron en 10 cc de propilenglicol 20 mg de materia activa y de esta solución se añadieron 0,25 cc a 4,75 cc de caldo de glucosa estéril y se diluyó todavía al 1:10 en los tubitos. Estas soluciones se inocularon luego con una bacteria y se incubaron durante 48 horas a 37° C (bacteriostasis).

15.

Veinticuatro horas después se extendió un asa de la solución inoculada sobre placas de glucosa-agar, que se incubaron durante 24 horas a 37° C (bactericidia). Transcurrido dicho tiempo, se determinaron las siguientes concentraciones-límite, en ppm,

20.

para la bacteriostasis y la bactericidia:

Bacteria	Comp. Nº 2	Comp. Nº 19	Comp. Nº 1	Comp. Nº 17	Comp. Nº 20	Comp. Nº 18
Trich. men tagrophytes	-	10	-	-	-	-
Ps. aeruginosa	-	500	-	-	-	-
25. Rhiz. nigricans	<3	-	10	30	10	10
Asp. niger	<3	10	<3	10	<3	10
Esch. coli	10/30	2	10/10	30/~30	30/~100	100/~100
30. Staph. aureus	3/10	3	10/~10	30/~30	30/30	3/3



- b) Determinación de la concentración inhibidora mínima (CIM) para las bacterias y los hongos en la prueba de placa en gradiente

5. Se mezclaron con agar-caldo de carne caliente los compuestos de la fórmula (I) en formulaciones apropiadas (por ejemplo, de soluciones en sulfóxido de dimetilo) de determinada concentración y las mezclas flúidas se vertieron sobre una capa fundamental de agar, solidificada y cuneiforme (= espesor de capa decreciente), y se dejaron también solidificar.
10. Con una pipeta de Pasteur se aplicaron entonces en líneas y perpendicularmente al gradiente cultivos de bacterias. Después de 24 horas de incubación a 37° C, se determinó el punto de la capa en que se había logrado la inhibición del crecimiento con la concentración mínima de materia activa (en ppm).
15. Para las razas de bacterias que a continuación se reseñan, se lograron las concentraciones inhibidoras mínimas siguientes (expresadas en ppm de materia activa):

Cultivos de bacterias o de hongos	Comp. N° 2	Comp. N° 1	Comp. N° 17	Comp. N° 18
20. <i>Paecilomyces varioti</i>	10	20	6	3
<i>Trichophyton Tinactin res.</i>	-	1	2	3
<i>Trichophyton mentagrophytes</i>	10	1	4	2
<i>Trichophyton interdigitale</i>	10	1	3	2
<i>Aspergillus elegans</i>	-	25	6	3
<i>Saccharomyces cerevisiae</i>	-	10	4	5
25. <i>Rhodotorula rubra</i>	10	-	-	-
<i>Candida albicans</i>	10	20	4	4,5
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	>100	60	70	100
<i>Proteus vulgaris</i>	10	25	30	40
<i>Klebsiella pneumoniae</i>	-	20	30	60
30. <i>Salmonella typhimurium</i>	-	25	30	50
<i>Escherichia coli</i>	6,5	15	25	25
<i>Streptococcus mitis</i>	1	0,5	0,5	0,7
<i>Staphylococcus aureus</i>	5,5	10	20	3

388523

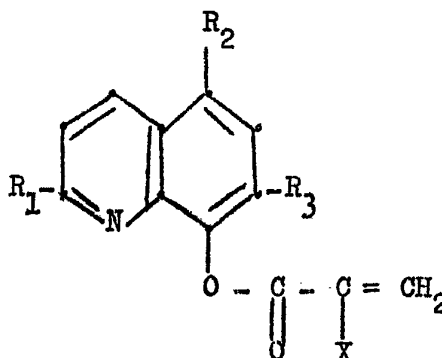


REIVINDICACIONES

Descrito el objeto del presente invento se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones con prioridad de patentes suiza núms. 2138/70 del 13 de Febrero de 5. 1971.

1.- Procedimiento para la preparación de agentes anti-parasitarios de la fórmula general

10.



15.

en la que

a) X representa hidrógeno o halógeno;
R₁ significa hidrógeno o metilo; y
los substituyentes

20. R₂ y R₃ significan hidrógeno o halógeno;
o en la que

b) X representa metilo;
R₁ significa hidrógeno; y
uno de los dos substituyentes

25. R₂ y R₃ representa halógeno mientras el otro representa hidrógeno o ambos substituyentes R₂ y R₃ representan halógeno,
además de que en el caso b) R₁, R₂ y R₃ significan substituyentes distintos uno de otro cuando R₂ representa cloro o bromo;

30.

o en la que

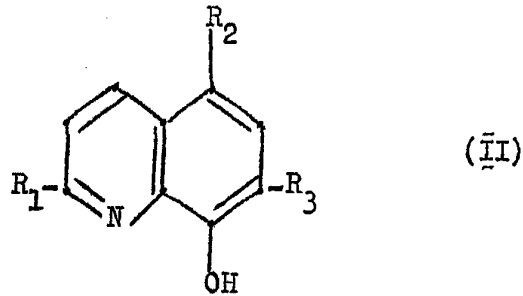
ME

388523



- c) X representa metilo;
- R₁ significa metilo; y
- R₂ y R₃ significan hidrógeno o halógeno, caracterizado por-
que se esterifica una 8-oxiquinolina, correspondientemente subs-
tituida, de la fórmula

5.

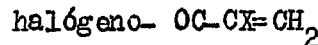


10.

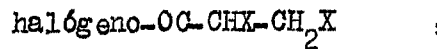
en la que R₁, R₂ y R₃ tienen el significado ya expuesto, con un derivado reactivo del ácido acrílico o metacrílico, o también, si en el producto final X ha de ser halógeno, con

15.

- a) un haluro de ácido halo-acrílico de la fórmula



o con un haluro del ácido halopropiónico de la fórmula



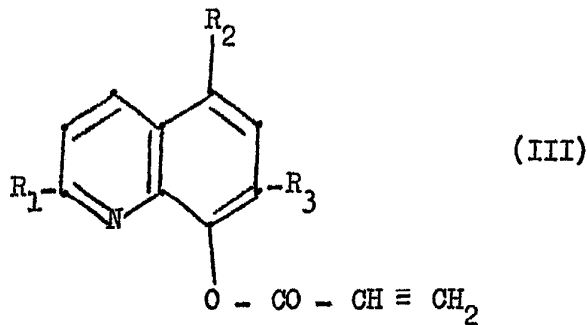
20.

desdoblándose en el primer caso 1 mol de H-halógeno y en el segundo caso 1 mol de H-halógeno y consecutivamente, o al mismo tiempo, 1 mol de H-X con formación de doble enlace; reacción que se verifica en presencia de un agente aceptor de ácido, o

25.

- b) con un derivado del ácido acrílico, preferentemente el haluro de ácido, formándose en este caso el producto de fórmula

30.



ME



- donde se introduce el sustituyente X = halógeno, adicionando ulteriormente, en medio acético glacial, 1 mol de X₂ al doble enlace; y preferentemente, desactivando la función básica de la fórmula III mediante protonización con ácido fuerte, de preferencia ácido sulfúrico, efectuándose la disociación de 1 mol de
5. HX por carbonato o bicarbonato alcalino en medio metanol o acetona acuosos; y preferentemente por aminas terciarias apropiadas, preferentemente trietilamina en disolvente inerte, de preferencia benceno, tolueno y xileno, en proporción estequiométrica de
10. amina o de 1 a 10 % de la estequiométrica, completando en este caso, el desdoblamiento de H-X con una cantidad estequiométrica a lo menos de hidróxido alcalino en solución acuosa, preferentemente 4-normal, la cual regenera la amina terciaria de su sal H-X intermedia, prosiguiendo la reacción en forma que solo bastan
15. cantidades catalíticas de amina terciaria y verificándose el proceso de desdoblamiento a temperatura ambiente, ó
- c), en una sola etapa, se hace reaccionar la 8-hidroxiquinolina o 8-hidroxiquinaldina, correspondientemente substituidas, con el haluro de ácido 2,3-dihalogenopropiónico, en disolvente inerte,
20. en presencia de la amina terciaria, de preferencia trietilamina; y si en el disolvente es insoluble la sal halohídrica de amina terciaria y soluble el producto de reacción deseado, se separa la sal de amina por filtración y se evapora el disolvente o se precipita el producto final de la fórmula I con X = halógeno,
25. cuyos acrilatos de 8-oxiquinolina y 8-oxiquinaldina, formulados solos o conjuntamente con otras materias activas microbicidas, constituyen agentes para combatir las talofitas patógenas.

2.- Procedimiento para la preparación de agentes anti-parasitarios.

30. Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 35 páginas foliadas y escritas a má-

ME

= 35 =

388523



quina por una sola de sus caras.

Madrid, a 12 de Febrero de 1971

p.a.

JAIME ISERN

P. P.

Firmado: FELIPE PRIETO

mpc.