

418579



P.- 55.513

PHN 4871 - Div.

Spain

VD/EV

Int. Cl.:	C07C/A01N

MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar PATENTE DE INVENCION

a nombre de N.V. PHILIPS'GLOEILAMPENFABRIEKEN

entidad holandesa

establecida en Emmasingel 29, Eindhoven, Holanda

por: "UN METODO DE PRODUCIR COMPUESTOS DERIVADOS DE UREA"

(Clase Internacional C07c A01n)

27-12-75

- 1 -





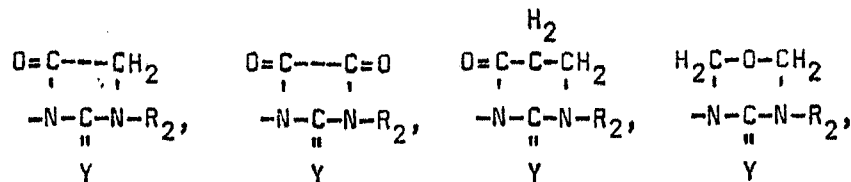
o un átomo de azufre;

R es un átomo de hidrógeno, un grupo alcoholo, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi, un grupo alcoximetilo, un grupo acilo o un grupo alcoxycarbonilo;

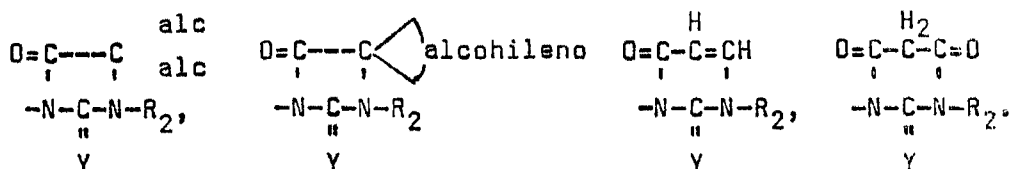
5 R<sub>1</sub> es un átomo de hidrógeno, un grupo alcoholo que puede estar sustituido con halógeno, con alcoxi, con alcoholitio o con ciano, un grupo 1-cicloalquenilo, un -- grupo bencilo que puede estar sustituido con halógeno, -- un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi, un grupo acilo, un --  
10 grupo alcoxycarbonilo, un grupo alcoxitiocarbonilo, un -- grupo alcoholisulfonilo o un grupo fenilsulfonilo, mien--  
tras que además R y R<sub>1</sub> juntamente con el grupo  $\begin{array}{c} -N-C-N-R_2 \\ \parallel \\ Y \end{array}$

15 indicado en la anterior fórmula, pueden formar un sistema de anillo; y

R<sub>2</sub> representa un grupo fenilo sustituido o no sustituido o un grupo piridilo que puede estar sustituido con halógeno, con nitro con ciano o con alcoholo halogenado. El sistema de anillo arriba mencionado puede ser  
20 representado por cualquiera de las siguientes fórmulas:



25



5 En estas fórmulas, Y y R<sub>2</sub> tienen los significados arriba mencionados, alc es un grupo alcoholo, y alcoholeno es un grupo alcoholeno saturado bivalente.

Si R<sub>2</sub> es un grupo fenilo sustituido, el grupo fenilo contiene al menos un sustituyente escogido del -- grupo que consiste en:

- 10 a) 1 a 3 átomos de halógeno;
- b) 1 a 2 grupos alcoholo, posiblemente sustituidos con -- halógeno, hidroxí, alcoxi, alcoholitio, dialcoholamino, alcoholisulfonilo y fenilo;
- 15 c) tri- o tetra-metileno;
- d) un grupo cicloalcoholo, posiblemente sustituido con -- halógeno o ciano;
- e) 1 a 2 grupos nitro o grupos ciano o grupos alcoxi;
- f) un grupo dioximetileno o dioxietileno;
- 20 g) un grupo acilo, que puede estar sustituido con halógeno;
- h) un grupo alcoholisulfonilo, fenilsulfonilo, alcoholitio, fenilitio o fenoxi, los cuales grupos pueden estar sustituidos con halógeno;
- 25 i) un grupo sulfónamido que puede estar alcoholado; y



k) un grupo fenilo, que puede estar sustituido con halógeno, nitro, ciano y alcoholo halogenado.

La actividad insecticida del anterior grupo de sustancias ha sido encontrado en una investigación de --  
5 evaluación biológica, en la cual soluciones de ensayo y suspensiones de ensayo de las sustancias activas han sido examinadas en cuanto a actividad biocida con respecto a, entre otros, *Aedes aegypti*, *Leptinotarse decemlineata*, *Pieris brassica*, *Musca domestica* y *Schistocerca gregaria*.  
10 Cada compuesto activo ha sido ensayado en diversas concentraciones, comenzando de una concentración máxima de 100 mg de sustancia activa por litro de líquido de ensayo y luego, en función de la actividad encontrada, reduciendo la concentración sucesivamente a 30, 10, 3, 1, --  
15 0,3 y 0,1 mg de sustancia activa por litro de líquido de ensayo.

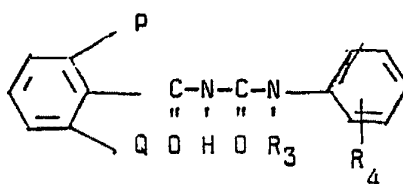
Los resultados de la investigación de evalua--  
ción muestran que los compuestos arriba mencionados de --  
acuerdo con el invento son activos contra insectos en la  
20 etapa larvaria, y que la sustancia activa ha de ser absor**u** bida por las larvas por vía de su estómago.

Los compuestos de acuerdo con el invento son --  
activos contra, entre otras plagas, gusanos, y larvas de  
moscas, escarabajos, mosquitos, langostas, cucarachas y  
25 chinches.



Más particularmente, se ha encontrado que las -  
 sustancias de acuerdo con el invento tienen un mecanismo  
 de actividad completamente nuevo y hasta ahora desconoci-  
 do, dado que se ha encontrado que las sustancias de acuer-  
 do con el invento interfieren en el mecanismo de metamór-  
 fosis que tiene lugar en insectos. Por lo tanto, las sus-  
 tancias de acuerdo con el invento son específicamente ac-  
 tivas contra insectos. Debido a su especificidad y a cau-  
 sa de la ausencia de efectos de fitotoxicidad, los com-  
 puestos de acuerdo con el invento son de importancia pri-  
 mordial.

A partir de la investigación de evaluación bio-  
 lógica en la que está basado el invento se ha encontrado  
 que especialmente los compuestos de la siguiente fórmula  
 tienen una intensa actividad insecticida:

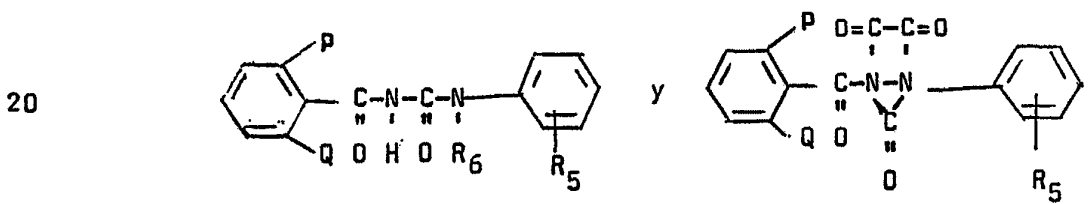


en la cual P y Q pueden ser iguales o diferentes y repre-  
 sentan cada uno un átomo de cloro, un átomo de flúor o un  
 grupo metilo, R<sub>3</sub> representa un átomo de hidrógeno, un gru-  
 po alcohilo, un grupo bencilo, un grupo acilo o un grupo

alcoxicarbonilo,  $R_4$  representa de 0 a 3 sustituyentes se-  
 leccionados del grupo que comprende 1 a 3 átomos de haló-  
 geno, un grupo alcoholo que contiene de 1 a 15 átomos --  
 de carbono y puede estar sustituido con uno o más átomos  
 5 de halógeno o con un grupo fenilo, un grupo cicloalcoholo  
 que puede estar sustituido con al menos un átomo de -  
 halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo fenilo-  
 lo, un grupo tiofenilo, un grupo benzoilo, un grupo tioal-  
 cohilo y un grupo alcoholisulfonilo.

10 Esto ocurre en particular con las sustancias -  
 de la fórmula anterior en las cuales  $R_3$  representa un --  
 átomo de hidrógeno o un grupo alcoholo inferior.

Una actividad insecticida muy potente ha sido  
 encontrada en compuestos de acuerdo con el invento que -  
 15 satisfacen las fórmulas:

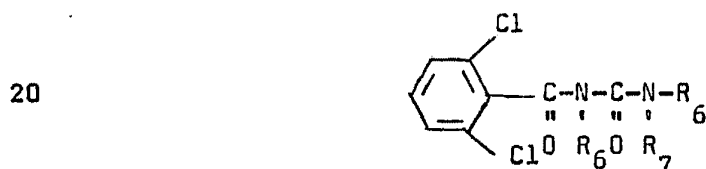


25 en las cuales P y Q pueden ser iguales o diferentes y re



5            presentan cada uno un átomo de cloro, un átomo de flúor o  
un grupo metilo,  $R_6$  es un átomo de hidrógeno o un grupo -  
alcohilo inferior y  $R_5$  representa 1 a 3 sustituyentes se-  
leccionados del grupo que comprende 1 a 3 átomos de haló-  
10            geno, un grupo alcohilo que contiene de 1 a 15 átomos de  
carbono y puede estar sustituido con al menos un átomo de  
halógeno, y un grupo cicloalcohilo que puede estar susti-  
tuido con al menos un átomo de halógeno. Más particular-  
mente, se ha averiguado que la máxima actividad se encuen-  
15            tra en los compuestos de las fórmulas anteriores en los -  
que  $R_5$  representa uno o dos sustituyentes en la posición  
3 o en la posición 4 o en las posiciones 3 y 4 del grupo  
fenilo.

                 Se ha encontrado además que está presente tam-  
15            bién una intensa actividad insecticida en las sustancias  
de acuerdo con el invento que pueden ser representadas -  
por la fórmula

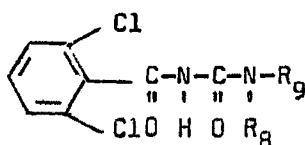


                 en la que  $R_6$  es un átomo de hidrógeno o un grupo alcohilo  
25            inferior y  $R_7$  representa un grupo fenilo que puede estar



sustituido. Sustancias representativas de este grupo de sustancias que poseen la máxima actividad pueden ser indicadas por la fórmula:

5



10 en la que  $R_9$  es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo y  $R_8$  representa un grupo fenilo que puede estar sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno, con un grupo alcoholo, con un grupo cicloalcoholo, con un grupo nitro, con un grupo tetrametileno, con un grupo metiléndioxi o con un grupo metilsulfonilo.

15

Ejemplos de compuestos que tienen la máxima actividad son: N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 238°C;

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea; punto de fusión: 253°C,

20

N-(2,6-dimetilbenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea; punto de fusión: 197°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 236°C,

25

N-(2,6-dimetilbenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea, punto de



fusión: 190-191,5°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 238°C.

5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-ciclopropilfenil)-urea, punto de fusión: 208°C,

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-cloro-4-yodofenil)-urea, punto de fusión: 254°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-cloro-4-bromofenil)-urea; - punto de fusión: 240°C.

10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-isopropilfenil)-urea, punto de fusión: 204°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-dibromofenil)-urea, punto de fusión: 252°C.

15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-fluorofenil)-urea, punto de fusión: 212°C,

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-triflurometilfenil)-urea, - punto de fusión: 230°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.butilfenil)-urea, punto de fusión: 190°C.

20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-cloro-4-metilsulfonilfenil)-urea, punto de fusión: 245°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-ter.butilfenil)-urea, punto de fusión: 212°C.

25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-difluorofenil)-urea, punto de fusión: 216°C.



- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,4-difluorofenil)-urea, punto de fusión: 248°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 236°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,5-difluoro-4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 270°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-yodofenil)-urea, punto de fusión: 215°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 225°C.
- 10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-fenilfenil)-urea, punto de fusión: 260°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-cianofenil)-urea, punto de fusión: 248°C.
- 15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 228°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-yodofenil)-urea, punto de fusión: 220°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2-fluoro-4-yodofenil)-urea, punto de fusión: 256°C.
- 20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.propilfenil)-urea, punto de fusión: 194°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-trifluorometilfenil)-urea, punto de fusión: 214°C.
- 25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-ciclopropilfenil)-urea, pun



- to de fusión: 208°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2-metil-4-clorofenil)-urea, -  
punto de fusión: 206°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-sec.butilfenil)-urea, punto  
de fusión: 168°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-iso-butil-fenil)-urea, pun-  
to de fusión: 215°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-etilfenil)-urea, punto de -  
fusión: 228°C.
- 10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.dodecilfenil)-urea, punto  
de fusión: 117°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-bencilfenil)-urea, punto de  
fusión: 207°C.
- N-(2,6-dibromobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto  
15 de fusión: 250°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-  
urea, punto de fusión: 178°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(3,4-diclorofenil)-  
urea, punto de fusión: 154°C.
- 20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-ter.butilfenil)  
-urea, punto de fusión: 158
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-(4-bromofenil)-urea, -  
punto de fusión: 182°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-bromofenil)-urea,  
25 punto de fusión: 148°C.



- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-isopropilfenil)-  
urea, punto de fusión: 135°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-n.butilfenil)-urea,  
punto de fusión: 130°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-clorofenil)-urea,  
punto de fusión: 176°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-clorofenil)-urea,  
punto de fusión: 146°C.
- 10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-ter.butilfenil)-  
urea, punto de fusión: 130°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-nitrofenil)-urea,  
punto de fusión: 195°C.
- Acido 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-(4-clorofenil)-parabánico,  
punto de fusión: 157°C.
- 15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,4,5-triclorofenil)-urea, pun  
to de fusión: 270°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(fenil)-urea, punto de fusión:  
195°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-nitrofenil)-urea, punto de -  
20 fusión: 256°C.
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-trifluorometilfenil)-urea,  
punto de fusión: 255°C.
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-n.butilfenil)-urea, punto -  
de fusión: 193°C.
- 25 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-ter.butilfenil)-urea, punto



de fusión: 214°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-isopropilfenil)-urea, punto de fusión: 196°C.

5 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-yodobencil)-urea, punto de fusión: 253°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 237°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3-trifluorometilfenil)-urea, punto de fusión: 201°C.

10 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-isobutilfenil)-N'-(metil)-urea, punto de fusión: 92°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 239°C.

15 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 247°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-fluorofenil)-urea, punto de fusión: 211°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-tiometilfenil)-urea, punto de fusión: 202°C.

20 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 124°C.

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(metoximetil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 145°C.

25 Para ilustrar la elevada actividad de estas sustancias, se mencionará que casi todos los compuestos de



acuerdo con el invento enumerados individualmente en lo que antecede, cuando se utilizan en una concentración de 10 ppm (partes por millón) dan como resultado una destrucción de 90-100% de larvas de Pieris brassica. Muchas de las anteriores sustancias producen incluso una destrucción de 90-100% en una concentración de 3 ppm. Algunos compuestos tales como:

- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea,
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea,
- 10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-butilfenil)-urea,
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-bromofenil)-urea,
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-yodofenil)-urea,
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-clorofenil)-urea.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-trifluorometilfenil)-urea.
- 15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-bromofenil)-urea
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2-fluoro-4-yodofenil)-urea.
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea,
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-bromofenil)-urea,
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-trifluorometilfenil)-urea,
- 20 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-n.butilfenil)-urea,
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-ter.butilfenil)-urea.
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-isopropilfenil)-urea.
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-yodofenil)-urea.
- N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-clorofenil)-urea,
- 25 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(3-trifluorometilfenil)-urea,



N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-isobutilfenil)-N'-(metil)-  
urea,

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea,

N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-bromofenil)-urea,

5 N-(2,6-difluorobenzoil)-N'-(4-fluorofenil)-urea,

provocan una destrucción de 90-100% de larvas de *Pieris  
brassica* en una concentración de dosificación entre 0,1  
y 1 ppm. Esta actividad excepcionalmente elevada es de  
importancia primordial y ha de ser considerada como ex--  
10 tremadamente sorprendente.

Una actividad biocida muy satisfactoria contra  
larvas del mosquito de fiebre amarilla (*Aedes aegypti*),  
es decir un efecto suficientemente destructor en una con-  
centración de 0,1 ppm o incluso menor, ha sido encontra-  
15 do, entre otros, con respecto a los siguientes compues--  
tos:

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto  
de fusión: 238°C.

20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-diclorofenil)-urea, punto de  
fusión: 236°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,4-diclorofenil)-urea, punto  
de fusión: 238°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-ciclorpropilfenil)-urea, pun-  
to de fusión: 208°C.

25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-metilfenil)-urea, punto de



fusión: 242°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(fluorofenil)-urea, punto de fusión: 212°C.

5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-trifluorometilfenil)-urea, punto de fusión: 230°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,5-difluoro-4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 270°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 225°C.

10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-fenilfenil)-urea, punto de fusión: 260°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-cianofenil)-urea, punto de fusión: 248°C.

15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-pentiltiofenil)-urea, punto de fusión: 130°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluoro-4-yodofenil)-urea, - punto de fusión: 220°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2-fluoro-4-yodofenil)-urea, - punto de fusión: 256°C.

20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.-propilfenil)-urea, punto de fusión: 194°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-sec.butilfenil)-urea, punto de fusión: 168°C.

25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-isobutilfenil)-urea, punto de fusión: 215°C.



- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-etilfenil)-urea, punto de fusión: 228°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.dodecilfenil)-urea, punto de fusión: 117°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-bencilfenil)-urea, punto de fusión: 207°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-trifluorometilfenil)-urea, punto de fusión: 214°C.
- 10 N-(2-clorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 209°C.
- N-(2-bromobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 217°C.
- N-(2,6-dibromobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 250°C.
- 15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 178°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 182°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 153°C.
- 20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 182°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 148°C.
- 25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metil)-N'-(4-clorofenil)-urea,



punto de fusión: 124°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metoximetil)-N'-(4-clorofenil)-  
-urea, punto de fusión: 122°C.

5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metoximetil)-N'-(3,4-dicloro-  
fenil)-urea, punto de fusión: 145°C.

Acido 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-(4-clorofenil)-parabáni-  
co, punto de fusión: 157°C.

N-(2,6-diclorotiobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, -  
punto de fusión: 168°C.

10 N-(2,6-diclorotiobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-tiourea,  
punto de fusión: 169°C.

Ejemplos de otras sustancias activas de acuerdo con el  
invento son:

15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-clorofenil)-úrea, punto de  
fusión: 237°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,3-dimetilfenil)-urea, punto  
de fusión: 238°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(5,6,7,8-tetrahidro-2-naftil)-  
urea, punto de fusión: 196°C.

20 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-dioximetilénfenil)-urea,  
punto de fusión: 242°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-diclorociclopropilfenil)-  
urea, punto de fusión: 245°C.

25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-metilsulfonil)-urea, punto  
de fusión: 222°C.



- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-bromo-4-clorofenil)-urea, -  
punto de fusión: 254°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-[4-(para-clorofenoxi)-fenil]-  
urea, punto de fusión: 205°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,5-dicianofenil)-urea, punto  
de fusión: 255°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4,5-triclorofenil)-urea, -  
punto de fusión: 270°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-cloro-4-metilfenil)-urea, -  
10 punto de fusión: 228°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-acetilfenil)-urea, punto -  
de fusión: 212°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-cloro-4-tiometilfenil)-urea,  
punto de fusión: 242°C.
- 15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2,5-difluorofenil)-urea, punto  
de fusión: 225°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-tiometilfenil)-urea, punto  
de fusión: 216°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-cloro-4-nitrofenil)-urea, -  
20 punto de fusión: 300°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-dimetilfenil)-urea, punto  
de fusión: 202°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(2-fluorofenil)-urea, punto de  
fusión: 205°C.
- 25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-fluorofenil)-urea, punto de



- Fusión: 222°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-dimetilaminosulfonilfenil)-  
urea, punto de fusión: 232°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-nitro-4-metilfenil)-urea, -  
punto de fusión: 256°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-metoxifenil)-urea, punto de  
fusión: 194°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-feniltiofenil)-urea, punto  
de fusión: 196°C.
- 10 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-benzoilfenil)-urea, punto de  
fusión: 198°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3-diclorociclopropilfenil)-urea,  
punto de fusión: 220°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-pentilsulfonilfenil)-urea,  
15 punto de fusión: 167°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.octilfenil)-urea, punto -  
de fusión: 124°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-metiltiometilfenil)-urea, -  
punto de fusión: 214°C.
- 20 N-(2-metoxibenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de  
fusión: 170°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(fenil)-urea, punto  
de fusión: 138°C.
- 25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(hidroxi)-N'-(2,4,5-triclorofe  
nil)-urea, punto de fusión: 220°C.



- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(pentil)-N'-(3,4-diclorofenil)  
-urea, punto de fusión: 160°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(acetil)-N'-(3,4-diclorofenil)  
-urea, punto de fusión: 180°C.
- 5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etoxicarbonil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 185°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(pentil)-N'-(4-bromofenil)-urea, punto de fusión: 145°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-isopropilfenil)  
10 -urea, punto de fusión: 124°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(pentil)-N'-(4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 138°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-n.propilfenil)-urea, punto de fusión: 110°C.
- 15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-sec.butilfenil)-urea, punto de fusión: 118°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-isobutilfenil)-urea, punto de fusión: 154°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(pentil)-N'-(4-ter.butilfenil)  
20 -urea, punto de fusión: 82°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(bencil)-N'-(4-clorofenil)-urea, punto de fusión: 188°C.
- N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-n.butilfenil)-urea, punto de fusión: 152°C.
- 25 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(n.pentil)-N'-(4-n.butilfenil)



-urea, punto de fusión: 104°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metil)-N'-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea, punto de fusión: 130°C.

5 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-sec.butilfenil)-urea, punto de fusión: 131°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-isobutilfenil)-urea, punto de fusión: 163°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-n.propilfenil)-urea, punto de fusión: 146°C.

10 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-)para-clorofenil)-hidrantoin-urea, punto de fusión: 183°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(piridil-2)-urea, punto de fusión: 216°C.

15 N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-cloropiridil-2)-urea, punto de fusión: 197°C.

N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-tiourea, - punto de fusión: 240°C.

20 En virtud de su actividad, las sustancias de acuerdo con el invento pueden ser utilizadas para reprimir insectos que se encuentran en agricultura y horticultura, tales como gusanos y escarabajos, y para conservar o proteger tejidos textiles, tales como por ejemplo para proteger pieles, alfombras y géneros textiles contra el ataque, por ejemplo, de polillas y antrenos.

25 Para utilización práctica, los compuestos de -



5 acuerdo con el invento son formulados en preparados. En estos preparados, la sustancia activa es mezclada con un material de vehículo sólido, o es disuelta o dispersada en un material de vehículo líquido, si se desea -- combinado con coadyuvantes, tales como sustancias ten-- sioactivas y estabilizadores.

10 Ejemplos de preparados de acuerdo con el invento son soluciones y dispersiones acuosas, soluciones oleosas y dispersiones oleosas, pastas, polvos para espolvorear, polvos humectables, aceites miscibles, gránulos, emulsiones invertidas, preparados de aerosol y bujías de fumigación.

15 Polvos humectables, pastas y aceites miscibles son preparados en forma concentrada, que son diluidos con agua antes o durante la utilización.

20 Las emulsiones invertidas son utilizadas principalmente en aplicaciones aéreas, siendo tratadas grandes áreas superficiales con una cantidad comparativamente pequeña de preparado. Un corto tiempo antes de, o incluso durante, la pulverización la emulsión invertida -- puede ser preparada en el aparato de pulverización emulsificando agua en una solución oleosa o una dispersión oleosa de la sustancia activa. Algunas formas de preparados serán descritas ahora con mayor detalle a título de ejemplo.

25



Preparados granulares se producen, por ejemplo, recogiendo la sustancia activa en un disolvente, después de lo cual el material de vehículo granular, tal como - gránulos porosos (por ejemplo piedra pómez y arcilla de  
5      atapulgita), gránulos no porosos minerales (arena o gr<sub>u</sub>da triturada) y gránulos orgánicos (por ejemplo posos - de café secos y tallos de tabaco cortados), es impregna- do con la solución, eventualmente en presencia de un -- aglutinante.

10            Un preparado granular puede ser producido tam bién comprimiendo la sustancia activa juntamente con mi nerales en forma de polvo en presencia de lubricantes y aglutinantes, y desintegrando y tamizando el producto - comprimido hasta el tamaño de grano deseado.

15            Se pueden obtener polvos para espolvorear mez ciando íntimamente la sustancia activa con un material de vehículo sólido inerte en una concentración, por --- ejemplo, de 1 a 50% en peso. Ejemplos de materiales de vehículo sólidos apropiados son: talco, caolín, arcilla  
20      plástica, tierra de diatomeas, dolomita, yeso, creta, - bentonita, atapulgita y SiO<sub>2</sub> coloidal, o mezclas de és- tos, y de sustancias similares. Alternativamente, se pue den utilizar materiales de vehículo orgánicos tales co- mo, por ejemplo, cáscaras de nuez trituradas.

25            Polvos humectables se producen mezclando de -



10 a 80 partes en peso de un vehículo inerte sólido tal como, por ejemplo, uno de los materiales de vehículo -- arriba mencionados, con desde 10 a 80 partes en peso de la sustancia activa, desde 1 a 5 partes en peso de un agente dispersante tal como, por ejemplo, los lignínsulfonatos o alcoholnaftalénsulfonatos conocidos para este fin, y preferiblemente también con desde 0,5 a 5 partes en peso de un agente humectante tal como uno de los sulfatos de alcohol graso, alcoholarilsulfonatos o productos de condensación de ácido graso, por ejemplo los conocidos bajo la marca registrada "Igepon".

Para producir aceites miscibles, la sustancia activa es disuelta o dividida finamente en un disolvente apropiado, que preferiblemente es malamente miscible con agua, después de lo cual se añade a la solución un emulsificador. Ejemplos de disolventes apropiados son: xileno, tolueno, destilados de petróleo con elevado contenido de compuestos aromáticos, por ejemplo nafta disolvente, aceite de alquitrán destilado y mezclas de estos líquidos. Ejemplos de emulsificadores son: alcoholfenoxipoliglicoléteres, polioxietilensorbitanésteres de ácidos grasos o polioxietilensorbita-ésteres de ácidos grasos. En estos aceites miscibles, la concentración del compuesto activo no está restringida dentro de estrechos límites y puede variar, por ejemplo, entre 2 y 50% en pe



so. Además de ser un aceite miscible, el líquido y la -  
composición primaria muy concentrada pueden ser una so-  
lución de la sustancia activa en un líquido satisfacto-  
riamente miscible con agua, por ejemplo acetona, a la -  
5 cual solución se ha de añadir o se ha añadido un agente  
dispersante y posiblemente un agente humectante. La di-  
lución con agua poco antes de o durante la operación de  
pulverización da como resultado una dispersión acuosa -  
de la sustancia activa.

10 Un preparado de aerosol de acuerdo con el in-  
vento se obtiene de la manera usual incorporando la sus-  
tancia activa, eventualmente en un disolvente, en un --  
líquido volátil apropiado para utilizarse como agente -  
propulsor, por ejemplo la mezcla de derivados clorados  
15 y fluorados de metano y etano comercialmente disponible  
bajo la marca registrada "Freon".

Bujías de fumigación o polvos de fumigación,  
es decir preparados que cuando son quemados son capaces  
de emitir un humo pesticida, se obtienen recogiendo la  
20 sustancia activa en una mezcla combustible que puede --  
contener, por ejemplo, un azúcar o una madera, preferi-  
blemente en forma triturada, como combustible, una sus-  
tancia para mantener la combustión tal como, por ejem-  
plo, nitrato de amonio o clorato de potasio, y además -  
25 una sustancia para retardar la combustión, por ejemplo



caolín, bentonita y/o ácido silícico coloidal.

Además de los ingredientes arriba mencionados, los preparados de acuerdo con el invento pueden contener otras sustancias conocidas para utilizarse en preparados de este tipo.

Por ejemplo, un lubricante tal como estearato de calcio o estearato de magnesio se puede añadir a un polvo humectable o a una mezcla que ha de ser granulada. También, "adhesivos" tales como derivados de poli(alcohol vinílico) celulosa u otros materiales coloidales, tales como caseína, pueden ser añadidos para mejorar la adherencia del pesticida a la superficie que ha de ser protegida.

Los preparados de acuerdo con el invento pueden incluir también otros compuestos pesticidas conocidos. - Esto amplía el espectro de actividad de los preparados y puede producir efecto sinérgico.

Los siguientes compuestos fungicidas, insecticidas y acaricidas conocidos son apropiados para utilizarse en un preparado combinado de este tipo:

Insecticidas tales como:

1. Hidrocarburos clorados, por ejemplo 2,2-bis(para-clorofenil)-1,1,1-tricloroetano y hexacloro-epoxioctahidrodimetanonafthaleno;



2. Carbamatos, por ejemplo N-metil-1-naftil-carbamato;
3. Dinitrofenoles, por ejemplo 2-metil-4,6-dinitrofenol y 2-(2-butil)-4,6-dinitrofenil-3,3-dimetilacrilato;
4. Compuestos de fósforo orgánicos, tales como dimetil-  
5 -2-metoxi-carbonil-1-metilvinil-fosfato, O,O-dietil-O-para-nitrofenilfósforotionato, N-monometilamida de ácido O,O-dimetil-ditiofosforilacético.

Acaricidas tales como:

- 10 5. Difenilsulfuros, tales como por ejemplo sulfuro de para-clorobencilo y para-clorofenilo y sulfuro de -2,4,4',5-tetraclorodifenilo;
6. Difenilsulfonatos, por ejemplo para-clorofenilbenzenosulfonato;
- 15 7. Metilcarbinoles, por ejemplo 4,4-dicloro-a-tricloro metil-benzhidrol;
8. Compuestos de quinoxalina, tales como metilquinoxalin-ditiocarbonato.

Fungicidas tales como:

- 20 9. Compuestos órganmercuricos, por ejemplo acetato de fenilmercurio y cianoguanida de metal mercurio;
10. Compuestos de órganoestaño, por ejemplo hidróxido de trifenil estaño y acetato de trifenilestaño;
- 25 11. Alcohilénbisditiocarbamatos, por ejemplo etilénbisdi



tiocarbamato de zinc y etilénbisditiocarbamato de magnesio;

12. y además:

2,4-dinitro-6-(2-octilfenilcrotonato)

- 5 1-Bis(dimetilamino)-fosforil-3-fenil-5-amino-1,2,4-triazol, 6-metilquinoxalín-2,3-ditiocarbonato; 1,4-ditioantraquinón-2,3-dicarbonitrilo, N-triclorometiltioftalimida, N-triclorometiltiotetrahidroftalimida, 10 N-(1,1,2,2-tetracloro-etiltio)-tetrahiroftalimida, N-diclorofluorometiltiofenil-N'-dimetilsulfonildiamida y tetracloroisofalocitrilo.

La dosificación deseable para utilización práctica de acuerdo con el invento dependerá naturalmente de diversos factores, tales como el campo de utilización, 15 la sustancia activa escogida, la forma de preparado, la naturaleza y el grado de la infección.

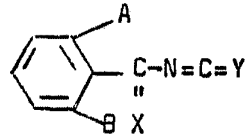
Para utilización agrícola, en general, una dosis correspondiente a 10-5000 gramos de sustancia activa por 20 hectárea rendirá el efecto deseado.

Los compuestos de acuerdo con el invento son nuevas sustancias que pueden ser producidas por métodos conocidos para la producción de sustancias similares o por métodos análogos. Por ejemplo, las sustancias pueden 25 ser producidas



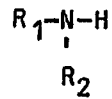
a) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

5



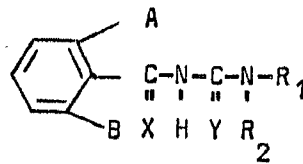
en que A, B x e Y tienen los significados arriba mencio-  
nados, con un compuesto de la fórmula:

10



en que R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> tienen los significados arriba menciona-  
dos, para obtener un compuesto de la fórmula:

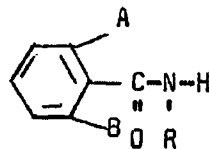
15



20

b) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

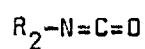
25



26.6.71



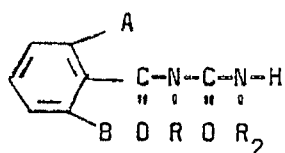
en que A, B y R tienen los significados arriba menciona  
dos, con un compuesto de la fórmula



5

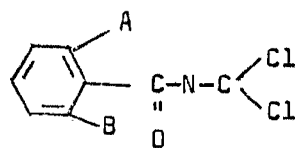
en que  $R_2$  tiene los significados arriba mencionados, pa  
ra obtener un compuesto de la fórmula

10



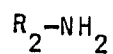
c) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula:

15



20

en que A y B tienen los significados arriba mencionados,  
con un compuesto de la fórmula:

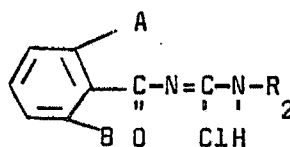


25



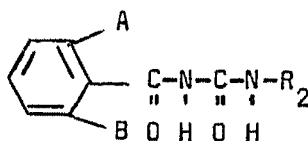
en que  $R_2$  tiene los significados arriba mencionados, e -  
hidrolizando subsiguientemente el producto de reacción -  
resultante, que puede ser mostrado por la fórmula:

5



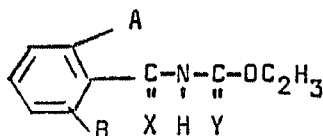
10 para obtener un producto final de la fórmula

15

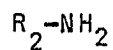


d) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

20

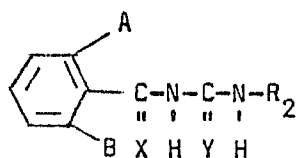


25 en que A y B tienen los significados arriba mencionados,  
con un compuesto de la fórmula:



en que  $R_2$  tiene los significados arriba mencionados, para obtener un compuesto de la fórmula

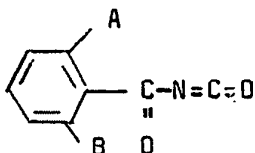
5



10

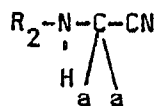
e) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

15



en que A y B tienen los significados arriba mencionados, con un compuesto de la fórmula

20



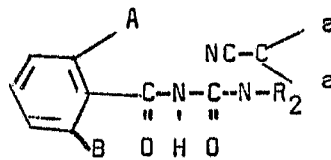
en que  $R_2$  tiene los significados arriba mencionados y  $\underline{a}$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcoholo, -

25



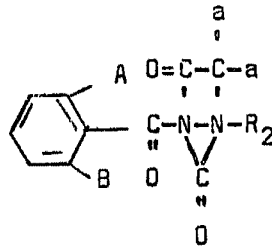
mientras que además los sustituyentes a juntamente con -  
 el átomo de carbono unido con ellos pueden formar un gru-  
 po cicloalcohilo que contiene de 3 a 6 átomos de carbo-  
 no, y subsiguientemente acidificando el producto de reac-  
 5 ción resultante, que puede ser representado por la fórmu-  
 la

10



para obtener un compuesto de la fórmula

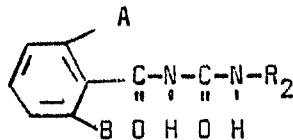
15



20

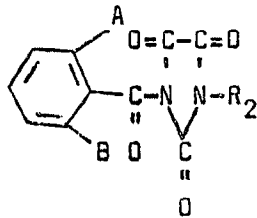
f) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

25



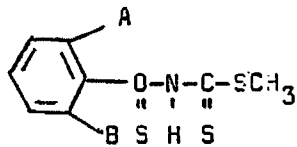
en que A, B y R<sub>2</sub> tienen los significados arriba menciona-  
dos, con cloruro de oxalilo, para obtener un compuesto -  
de la fórmula

5



10

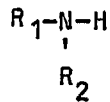
g) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula:



15

en que A y B tienen los significados arriba mencionados,  
con un compuesto de la fórmula

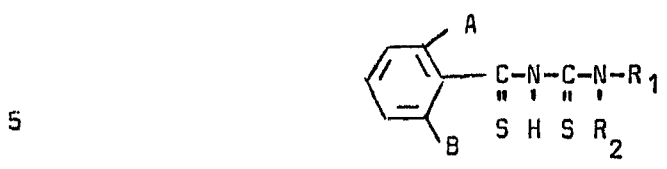
20



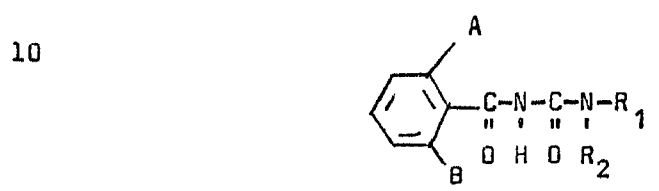
en que R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> tienen los significados arriba mencionados,

25

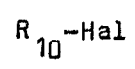
para obtener un compuesto de la fórmula:



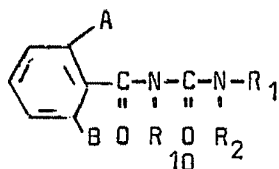
h) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula:



15 en que A, B, R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> tienen los significados arriba mencionados, con un compuesto de la fórmula

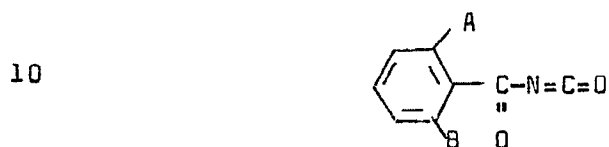


20 en que R<sub>10</sub> es un grupo alcoholo o un grupo alcoximetilo y Hal es un átomo de halógeno, para obtener un compuesto de la fórmula:

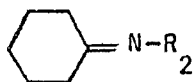


5

i) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula



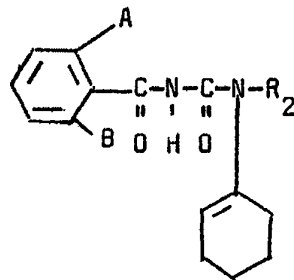
en que A y B tienen los significados arriba mencionados,  
15 con un compuesto de la fórmula



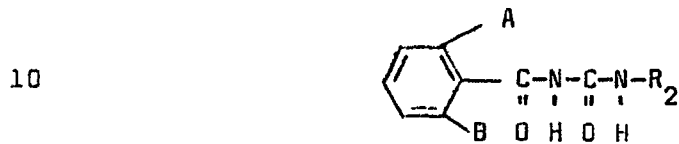
20

en que R<sub>2</sub> tiene los significados arriba mencionados, pa-  
ra obtener un compuesto de la fórmula

25

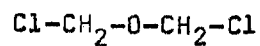


k) haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

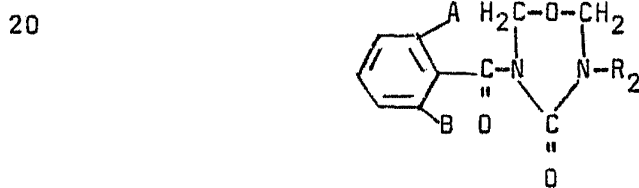


en que A, B y R<sub>2</sub> tienen los significados arriba mencionados, con un compuesto de la fórmula

15



para obtener un compuesto de la fórmula



25 Entre estos métodos, el método a) se utiliza -  
de modo preferente. La eficacia del método a) es satis--

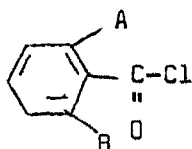


factoria.

El método a se lleva a cabo en presencia de un disolvente a una temperatura de reacción que puede variar desde 0°C hasta el punto de ebullición del disolvente -- utilizado. Ejemplos de disolventes apropiados son hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, hidrocarburos clorados, tales como cloroformo, cloruro de metileno o cloro de etileno, u otro disolvente inerte, tal como acetonitrilo.

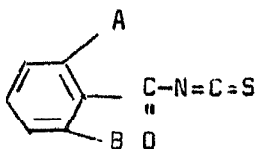
El producto de partida para el método a se puede obtener tratando la correspondiente benzamida con cloruro de oxalilo en presencia de un disolvente, tal como un hidrocarburo clorado, por ejemplo, cloruro de metileno.

Ejemplos de otros métodos para sintetizar los productos de partida para el procedimiento a son:  
I hacer reaccionar un compuesto de la fórmula



con tiocianato de amonio, para obtener un compuesto de --

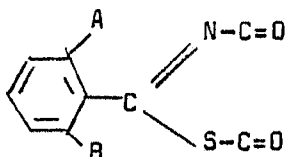
la fórmula:



5

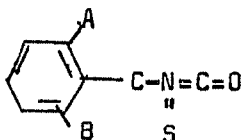
II calentar una solución de un compuesto de la fórmula  
la

10



15

para obtener una sustancia de la fórmula



20

El método b se lleva a cabo preferiblemente -  
en un medio de reacción que contiene piridina y sodio.  
25 La reacción se efectúa a una temperatura elevada, por -



ejemplo 100°C.

El método c se lleva a cabo en presencia de una base capaz de fijar el HCl desprendido. Ejemplos de bases apropiadas son trietilamina y 3,4-dicloroanilina.

5 La reacción de condensación se lleva a cabo en presencia de un disolvente, tal como benceno, tolueno, clorobenceno, cloruro de metileno, cloroformo o tetracloruro de carbono. La temperatura de reacción puede variar entre 0°C y el punto de ebullición del disolvente utilizado. La hidrólisis del producto intermedio del método c  
10 se puede efectuar de modo simple. Por ejemplo, el producto intermedio puede ser expuesto a aire húmedo o puede ser agitado con agua.

La reacción descrita en el método d tiene lugar en presencia de un disolvente. Ejemplos de disolventes apropiados son xileno, tolueno, clorobenceno y otros disolventes inertes similares que tienen un punto de ebullición mayor de aproximadamente 100°C. La reacción se lleva a cabo a una temperatura que es aproximadamente  
15 igual al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción es de varias horas.

En el método e, la primera etapa se lleva a cabo en presencia de un disolvente tal como benceno seco. Durante la reacción, la mezcla de reacción es enfriada  
20 ligeramente. El producto intermedio obtenido en la pri-



mera etapa es acidificado mediante un tratamiento, por -  
ejemplo, con una solución de un ácido inorgánico en áci-  
do acético. Acidos inorgánicos apropiados son HBr, H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>,  
HCl y similares.

5                   La reacción con cloruro de oxalilo de acuerdo  
con el método f se lleva a cabo en presencia de un di--  
solvente. Disolventes apropiados son hidrocarburos aromá-  
ticos, tales como benceno y tolueno, e hidrocarburos clo-  
10                   rados, tales como cloroformo, tetracloruro de carbono y  
dicloroetano. La reacción se lleva a cabo a temperatura  
elevada, por ejemplo al punto de ebullición del disol--  
vente utilizado.

                  La reacción de acuerdo con el método g se desa-  
rolla en presencia de un disolvente, tal como un hidro-  
15                   carburo, por ejemplo tolueno, y a una temperatura de ---  
reacción que puede variar entre la temperatura ambiente  
y el punto de ebullición del disolvente utilizado.

                  El procedimiento descrito bajo el encabezamien-  
to h se lleva a cabo en presencia de un disolvente y una  
20                   sustancia básica. Un medio de reacción apropiado es, ---  
por ejemplo, dimetilformamida que contiene un hidróxido  
de metal alcalino.

                  La reacción de acuerdo con el método i se lle-  
va a cabo en presencia de un disolvente, tal como un ---  
25                   éter, por ejemplo éter dietílico. La temperatura de reac-



ción es de modo preferible aproximadamente igual a la --  
temperatura ambiente.

Las condiciones de reacción para llevar a cabo  
el método k son las mismas que se describen para el método  
5 do h.

El invento será descrito ahora de modo más com  
pleto con referencia a los siguientes ejemplos:

1.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea.

10 9,5 g de 2,6-diclorobenzamida y 10,34 g de 3,4  
-diclorofenilisocianato en 25 ml de piridina, a los que  
se ha añadido 1 g de sodio, son calentados sobre un baño  
de vapor de agua (100°C +) durante 24 horas. La mezcla -  
de reacción es vertida sobre hielo que contiene ácido --  
15 clorhídrico concentrado y el precipitado sólido es lava-  
do a fondo sucesivamente con agua y con alcohol. La sus-  
tancia es recristalizada en acetonitrilo. Punto de fu---  
sión: 232°C.

20 2.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea.

a) Producción de 2,6-diclorobenzoilisocianato.

25 95 g de 2,6-diclorobenzamida son suspendidos -  
en 250 a 300 ml de cloruro de metileno seco. Después de  
la adición de 56 ml de cloruro de oxalilo, la mezcla es  
calentada lentamente hasta el punto de ebullición, tempe



ratura a la cual el material de partida se disuelve con rapidez con un intenso desprendimiento de ácido clorhídrico. Después de poner en ebullición durante 15 a 18 horas, la mezcla es concentrada por evaporación en vacío.

5 El 2,6-diclorobencilisocianato resultante es utilizado para la siguiente etapa de reacción sin purificación adicional.

b) Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea.

10 35 g de 2,6-diclorobenzoilisocianato en 100 ml de benceno anhidro son añadidos gota a gota, con agitación y enfriamiento, a una solución de 24,3 g de 3,4-dicloroanilina en 200 ml de benceno seco. Se desprende mucha cantidad de calor y se forma un precipitado que es --  
15 separado mientras está caliente y luego es lavado con benceno caliente. La N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea resultante es pura, tal como se muestra -- por cromatografía en capa delgada (como acetato de etilo en calidad de disolvente). Si se desea, el producto puede ser recristalizado en acetonitrilo. Punto de fusión:  
20 238°C.

3.- Producción de N-(2,6-diclorotiobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea.

25 26,0 g de 2-(2,6-diclorofenil)-tiazolín-4,5-diona son suspendidos en 250 ml de tolueno seco y son ca



5 lentados a 90°C mientras se agita. Se desprende gas y se obtiene una solución de color violeta, a la cual se añaden 16,2 g de 3,4-dicloroanilina disueltos en 30 ml de tolueno. Después de agitar durante 15 minutos, la solución es enfriada y el precipitado obtenido es separado. Rendimiento: 20,1 g. Punto de fusión: 168°C.

4.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-tiourea.

10 10,5 g de cloruro de 2,6-diclorobenzoil son añadidos gota a gota con agitación a una solución de 3,8 g de tiocianato de amonio en 15 ml de acetona. Después de poner en ebullición durante 15 minutos, la mezcla de reacción es añadida gota a gota a una solución de 8,1 g de 3,4-dicloroanilina en 15 ml de acetona. Después de agitar durante 30 minutos, la mezcla de reacción es vertida en agua y es extraída con éter. La solución etérea es secada y es concentrada por evaporación y el residuo es recogido en benceno. Después de tratar y recristalizar en benceno se obtienen 1,3 g de la sustancia del título. --  
15 Punto de fusión: 240°C.  
20

5.- Producción de N-(2,6-diclorotiobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-tiourea.

25 3,0 g de N-(2,6-diclorotiobenzoil)-S-metil-ditiocarbamato y 1,6 g de 3,4-dicloroanilina son disueltos en 25 ml de tolueno y subsiguientemente son calentados a



reflujo durante 5 horas. El precipitado amarillo resultante es tratado de la manera usual. Rendimiento: 2,1 g. Punto de fusión: 168-170°C.

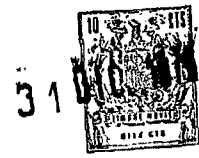
5      6.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metil)-N'-(4-clorofenil)-urea.

10      10,3 g de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea y 1,88 g de hidróxido de potasio en forma de polvo (al 90%) son disueltos en 40 ml de dimetilformamida, después de lo cual se añaden gota a gota 4,7 g de yoduro de metilo a la solución transparente. La reacción resultante es exotérmica. Después de agitar durante 2 horas, la solución es diluida con agua helada y la sustancia sólida es aislada. Rendimiento: 10,3 g. Punto de fusión: 124-126°C.

15      De una manera completamente similar pero utilizando cloruro de metoximetilo en lugar de yoduro de metilo, se produce N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metoximetil)-N'-(4-clorofenil)-urea. Punto de fusión: 121,5-122,5°C.

20      7.- Producción de 3-para-clorofenil-5-(2,6-diclorobenzoil)-2,3,5,6-tetrahidro-4H-1,3,5-oxadiazinona-4.

25      6,5 g de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-urea y 1,3 g de hidróxido de potasio en forma de polvo al 90% son disueltos en 25 ml de dimetilformamida, después de lo cual se añaden a la solución 2,18 g de di-



clorodimetiléter. Después de agitar durante 2 horas a 0°C, se añade otra porción de 1,3 g de hidróxido de potasio - en forma de polvo al 90%, después de lo cual la mezcla es agitada durante 24 horas a la temperatura ambiente. Después de dilución con agua helada, la sustancia sólida obtenida es aislada y cromatografiada. Rendimiento: 2,1 g. Punto de fusión: 164-168°C.

8.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-clorofenil)-N'-(ciclohexenil-1)-urea.

3ml g de 1-(4-cloruanilino)-ciclohexeno son disueltos en 50 ml de éter absoluto y a esta solución se añadió una solución de 3,25 g de 2,6-diclorobenzoil-isocianato en 10 ml de éter absoluto. Después de un corto tiempo se produce un precipitado que es separado y es lavado con éter. Rendimiento: 5,1 g. Punto de fusión: 156-158°C.

9.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea.

Una solución de 1,62 g de 3,4-dicloruanilina y 1,01 g de trietilamina en 20 ml de benceno fue añadida gota a gota a una solución de 2,71 g de dicloruro de 2,6-diclorobenzoilisocianato en 25 ml de benceno, mientras se agita a 20°C. Hay un ligero aumento de temperatura y se produce un precipitado blanco. Después de agitar durante 2 horas, la sustancia blanca es separada y el fil-



31

trado es expuesto a airea húmedo. Después de 24 horas -  
se producen cristales casi perfectos, que son aislados.  
Punto de fusión: 236°C. Rendimiento: 1,3 g.

5     10.- Producción de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea.

2,62 g de N-(2,6-diclorobenzoil)-etiluretano y  
1,62 g de 3,4-dicloroanilina son añadidos a 10 ml de xi-  
leno y son calentados al punto de ebullición durante 2 -  
horas, siendo separado por destilación el alcohol forma-  
do. Después de enfriar, los cristales formados son sepa-  
10     rados por filtración. Rendimiento: 3,4 g. Punto de fu-  
sión: 236°C.

11.- Producción de 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-(pa-  
ra-clorofenil)-hidantoina.

15     a     Preparación de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(ciano-  
metil)-N'-(para-clorofenil)-urea.

16,0 g de 2,6-diclorobenzoilisocianato son aña-  
didos en pequeñas porciones a una solución de 11,66 g de  
para-cloroanilino-acetonitrilo en 100 ml de benceno se-  
20     co con moderado enfriamiento. Después de algún tiempo, -  
se separa por cristalización una sustancia, la cual des-  
pués de aproximadamente 12 horas es separada y lavada --  
con benceno. Después de secar, el peso es de 25,25 g, es  
decir 93,7%, siendo de 185°C el punto de fusión con des-  
25     composición espontánea sobre el banco de calentamiento -



31

de Kofler. La cromatografía en capa delgada (el disolvente es acetato de etilo o cloroformo) muestra que la sustancia es pura; sin embargo, si se desea, esta puede ser recristalizada en 250 ml de benceno con un rendimiento -

5

b) Preparación de 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-(para-clorofenil)-hidantoína.

25 g de la sustancia preparada por el método - descrito en 11a fueron agitados a la temperatura ambiente en 150 ml de solución de HBr aproximadamente al 15% - en ácido acético, disolviéndose la sustancia casi completamente con rápida formación de un precipitado espeso. - Después de ser calentada (a 40°C) durante un corto tiempo y de ser dejada reposar durante algunas horas, la suspensión es vertida en medio litro de agua, separada, lavada con agua y secada. Rendimiento: 24 g. Punto de fusión: 176-180°C.

10

15

12.- Producción de ácido 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-(para-clorofenil)-parabánico.

10,3 g de N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(para-clorofenil)-urea son puestos en ebullición en 100 ml de 1,2-dicloroetanol seco que contiene 3 ml de cloruro de oxalilo durante 24 horas. La urea se disuelve con el desprendimiento de ácido clorhídrico. Después de concentrar por evaporación y después de añadir 25 ml de ligroína, -

20

25



31

el residuo se vuelve cristalino. La sustancia puede ser recristalizada en 30 ml de benceno. Punto de fusión: -- 157°C. Rendimiento: 8 g.

5 Se deberá hacer observar que las sustancias -  
enumeradas en la memoria fueron producidas de una mane-  
ra que es enteramente análoga a los métodos ilustrados  
en los anteriores ejemplos. Para producir el gran núme-  
ro de compuestos de acuerdo con el invento se utiliza -  
frecuentemente de modo especial el método a) arriba des-  
10 crito que está ilustrado por los Ejemplos 2, 3, 4 y 5.

13.- A partir de las sustancias enumeradas en  
esta memoria se han preparado polvos humectables mez-  
clando 25 partes en peso de la sustancia activa con 3 -  
partes en peso de lignínsulfonato de calcio, 2 partes -  
15 en peso de dibutilnaftalensulfonato y 70 partes en peso  
de caolín.

14.- Concentrados líquidos de las sustancias  
activas de acuerdo con el invento han sido preparados -  
disolviendo 10 partes en peso de la sustancia activa en  
20 dimetilformamida a lo cual se puede añadir una pequeña  
cantidad de ciclohexanona, y añadiendo subsiguientemen-  
te a la solución obtenida desde 6 a 7 partes en peso de  
un emulsificador, tal como una mezcla de nonilfenolpoli-  
glicoléter y alcoholbencenosulfonato de metal alcalino-  
25 térrico.



15.- Las sustancias activas de acuerdo con el invento han sido dispersadas en agua en concentraciones de 100, 30, 10, 3, 1, 0,3 y 0,1 mg de la sustancia activa por litro de dispersión acuosa. Plantas de coles de Bruselas jóvenes son pulverizadas con una dispersión --  
5 acuosa de la sustancia de acuerdo con el invento que ha de ser investigada, hasta que la dispersión se escurre. Después de que las plantas se han secado, son colocadas en cilindros Perspex, y luego cada una de ellas son in--  
10 fectadas con 5 larvas de Pieris brassica (gusanos de la mariposa de col blanca). Después los cilindros son cu--  
biertos con gasa y son almacenados a una temperatura - de 24°C y a una humedad relativa de 60-70%. Después de --  
5 días se determina el porcentaje de mortalidad. Cada en  
15 sayo es conducido en triplicado. Los resultados de los - ensayos están dados en la siguiente tabla. Los significados  
dos de los símbolos utilizados en la tabla son:

- 20        † = mortalidad de 90 a 100%  
         ‡ = mortalidad de 50 a 90%  
         - = mortalidad menor de 50%.

25



TABLA

Actividad biocida sobre larvas de *Pieris brassica*.

	Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.						
		100	30	10	3	1	0,3	0,1
5	N-(2,6-diclorobenzoil) -N'-(3,4-diclorofenil) -urea.	+	+	+	+	±	±	-
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(3,4-diclorofenil) -urea.	+	+	+	+	+	+	-
10	N-(2,6-dimetilbenzoil) N'-(3,4-diclorofenil)- urea	+	±	±	±	±		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-clorofenil)-urea	+	+	+	+	+	+	±
	N-(2,6-dimetilbenzoil)- N'-(4-clorofenil)-urea	+	+	+				
15	N-(2,6-diclorobenzoil) -N'-(2,4-diclorofenil)- urea	+	+	+	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-ciclopropilfenil)- urea	+	+	+	+	±		-
20	N-(2,6-diclorobenzoil) -N'-(3-cloro-4-yodo-fe nil)-urea	+	+	+	±			-
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-cloro-4-bromo-fe nil)-urea	+	+	+	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-isopropilfenil)- urea	+	+	+	±			-

25

26.6.71



	Compuesto	Actividad						
		Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.						
		100	30	10	3	1	0,3	0,1
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-dibromofenil)- urea	+	+	+	-			
5	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-fluorofenil)- urea	+	+	+	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-trifluorometilfenil)- urea.	+	+	+	-			
10	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-n.butilfenil)- urea	+	+	+	+	+	-	
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-cloro-4-metilsulfo- nilfenil)-urea.	+	+	+	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-ter.butilfenil)- urea.	+	+	+	+	+	±	-
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-difluorofenil)- urea.	+	+	+	+	+	±	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2,4-difluorofenil)- urea	+	+	+	+	±	-	
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-bromofenil)-urea	+	+	+	+	+	+	-
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2,5-difluoro-4-bromo fenil)-urea	+	+	+	+	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-yodofenil)-urea	+	+	+	+	+	±	-
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-fluoro-4-cloro- fenil)-urea	+	+	+	+	+	+	-



Compuesto	Actividad						
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
5	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-fenilfenil)-urea	+	+	+	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-cianofenil)-urea	+	+	+	+	±	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-fluoro-4-bromo- fenil)-urea	+	+	+	+	+	+
10	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-fluoro-4-yodofe- nil)-urea	+	+	+	+	+	
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2-fluoro-4-yodo-fe- nil)-urea	+	+	+	+	+	+
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-n.propilfenil)- urea	+	+	+	-		
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-trifluorometilfe- nil)-urea	+	+	+	+	+	+
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-ciclopropilfenil)- urea	+	+	+	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2-metil-4-clorofe- nil)-urea	+	+	+	-		
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-sec.butilfenil)- urea.	+	+	+			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-isobutilfenil)- urea	+	+	+			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-etilfenil)-urea	+	+	+			
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-etilfenil)-urea	+	+	+			



Compuesto	Actividad						
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
5	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-n.dodecilfenil)-urea						
		+	+	+			
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(4-bencilfenil)-urea						
		+	+	+			
	N-(2,6-dibromobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea						
		+	+	±	±	-	
10	N-(3,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea						
		+	+	+	+	+	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea						
		+	+	+	+	±	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-terbutilfenil)-urea						
		+	+	+	+	±	-
15	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-bromofenil)-urea						
		+	+	+	+	+	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-bromofenil)-urea						
		+	+	+	+	+	±
20	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-isopropilfenil)-urea						
		+	+	+	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(etil)-N'-(4-n.butilfenil)-urea						
		+	+	+	+	-	
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(4-clorofenil)-urea						
		+	+	+	+	±	-
25							



Compuesto	Actividad						
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
5 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-clorofe nil)-urea	+	+	+				
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-ter.bu tilfenil)-urea	+	+	+				
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-nitro- fenil)-urea	+	+	+				
10 Acido 3-(2,6-dicloroben zoil)-4-(4-clorofenil)- parabánico	+	+	+				
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2,4,5-triclorofenil) urea	+	+	±	-			
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(fenil)-urea	+	+	±	-			
15 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-nitrofenil)-urea	+	+	±	-			
N-(2,6-difluorobenzoil)- N'-(trifluorometilfenil) urea	+	+	+	+	+		
N-(2,6-difluorobenzoil)- N'-(4-n.butilfenil)-urea	+	+	+	+	+		
20 N-(2,6-difluorobenzoil)- N'-(4-ter.butilfenil)- urea	+	+	+	+	+		
N-(2,6-difluorobenzoil)- N'-(4-isopropilfenil)- urea.	+	+	+	+	+		
25 N-(2,6-difluorobenzoil)- N'-(3-fluoro-4-yodo Fenil) -urea	+	+	+	+	+		

310



Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
5	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(3-fluoro-4-cloro- fenil)-urea	+	+	+	+	+	
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(3-trifluorometil- fenil)-urea	+	+	+	+	+	
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(4-isobutilfenil)- N'-(metil)-urea	+	+	+	+	+	
10	N-(2,6-difluorobenzoil) N'-(4-clorofenil)-urea	+	+	+	+	+	
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(4-bromofenil)-urea	+	+	+	+	+	
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(4-fluorofenil)-urea	+	+	+	+	+	
15	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(4-tiometilfenil)- urea	+	+	+	±	-	
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(metil)-N'-(4-cloro- fenil)-urea	+	+	+			
	N-(2,6-difluorobenzoil) -N'-(metoximetil)-N'-( 3,4-diclorofenil)-urea	+	+	+			
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-clorofenil)-urea	+	±	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(5,6,7,8-tetrahidro- 2-naftil)-urea	+	-				
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-dioximetilénfe- nil)-urea	+	±	-			



Compuesto	Actividad						
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
5	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-diclorociclopro- pilfenil)-urea	+	+	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-metilsulfonil)- urea	+	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-bromo-4-clorofe- nil)-urea	+	-				
10	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-para-clorofenoxi- fenil)-urea	+	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,5-dicianofenil)- urea	+	±	-			
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2,5-difluorofenil)- urea	+	-				
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-dimetilfenil)- urea	+	-				
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-dimetilaminosulfo- nilfenil)-urea	±	±	±	-		
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-feniltiofenil)- urea	+	+	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-benzoilfenil)- urea	+	+	±			
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-pentiltiofenil)- urea	+	+	-			



Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.					
	100	30	10	3	1	0,3 0,1
5	N-(2,5-diclorobenzoil)- N'-(3-diclorociclopro- pilfenil)-urea	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-pentilsulfonilfe- nil)-urea	+	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-n.octilfenil)- urea	+	±	-		
10	N-(2-metoxibenzoil)-N'- (3,4-diclorofenil)-urea	+	±	-		
	N-(2-clorobenzoil)-N'- (3,4-diclorofenil)-urea	+	±	±	-	
	N-(2-brómobenzoil)-N'- (3,4-diclorofenil)-urea	+	+	-		
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(hidroxi)-N'-(2,4,5- triclorofenil)-urea	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(pentil)-N'-(3,4-diclo- rofenil)-urea	+	+	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-diclorofenil)- urea.	+	+	-		
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etoxicarbonil)-N'- (3,4-diclorofenil)-urea	+	+	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(pentil)-N'-(4-bromo- fenil)-urea	+	+	±	-	
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-isopro- pilfenil)-urea	+	±	-		



Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
5	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(pentil)-N'-(4-cloro fenil)-urea	+	+	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-n.pro- pilfenil)-urea.	+	+	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-sec.butil fenil)-urea	+	±	±			
10	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-isobutil fenil)-urea	+	+	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(pentil)-N'-(4-ter. butilfenil)-urea	+	±	-			
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(bencil)-N'-(4-cloro fenil)-urea	+	+	±			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N-(metoximetil)-N'-(4- clorofenil)-urea	+					
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-n.butil fenil)-urea	+	+	±			
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N-(metil)-N'-(3,4-dicloro rofenil)-urea	+	+	±			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-sec.bu- tilfenil)-urea	+	±	±			
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-isobutil fenil)-urea	+	±	-			



Compuesto	Actividad						
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.						
	100	30	10	3	1	0,3	0,1
N-(2,6-diclorobenzoil)- N <sup>o</sup> -(metil)-(4-n.propil- fenil)-urea	+	-					
3-(2,6-diclorobenzoil)- -1-(para-clorofenil)-hi dantoína.	+	-					
N-(2,6-diclorobenzoil)- N <sup>o</sup> -(4-cloropiridil-2) urea.	+	+	±	-			

10

Ejemplo 16.- Las sustancias de acuerdo con el invento son dispersadas en agua en concentraciones de - 1, 0,3, 0,1, 0,03 y 0,01 mg de sustancia activa por litro de dispersión.

15

Las dispersiones acuosas son inoculadas luego con 20 larvas de un día de edad del mosquito de fiebra amarilla (*Aedes aegypti*) y son mantenidas a una temperatura de 25°C. Las larvas son alimentadas con levadura de malta. Después de 6 días se determina el porcentaje de mortalidad, tomando en cuenta la mortalidad natural. Los resultados de este ensayo están dados en la siguiente -- tabla. Los significados de los símbolos son:

20

+ = mortalidad de 90 a 100%

± = mortalidad de 50 a 90%

- = mortalidad menor de 50%.

25

Se deberá hacer observar que cuando no se deter

26.6.71



mina el porcentaje de mortalidad después de 6 días, sino después de 14 días, éste es mucho mayor. El porcentaje de mortalidad después de 14 días se puede deducir de modo razonablemente satisfactorio de la siguiente tabla, que se refiere a un periodo de espera de 6 días, cambiando los resultados "±" por resultados "+".

TABLA

Actividad biocida sobre larvas de *Aedes aegypti*

Compuesto	Actividad				
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.				
	1	0,3	0,1	0,03	0,01
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-diclorofenil)- urea	±	±	±	±	±
15 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-clorofenil)-urea	±	±	±	±	-
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2,4-diclorofenil)- urea	±	±	±	-	-
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-ciclopropilfenil) urea	+	±	±	-	-
20 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-cloro-4-bromofe- nil)-urea	+	±	-	-	-
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-fluorofenil)-urea	+	+	±	-	-
25 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-trifluorometilfe- nil)-urea	+	+	+	±	±

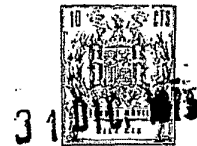


31

Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.				
	1	0,3	0,1	0,03	0,01
5 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-n.butilfenil)- urea	±	±	-		
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2,5-difluoro-4-bromo- fenil)-urea	+	+	+	+	+
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-fluoro-4-clorofe- nil)-urea	+	+	+	+	+
10 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-fenilfenil)-urea	+	+	+	+	+
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-cianofenil)-urea	+	+	+	-	
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-trifluorometilfe- nil)-urea	+	+	±	±	±
15 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-fluoro-4-yodo-fe- nil)-urea	+	+	+	+	+
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2-fluoro-4-yodo-fe- nil)-urea	+	+	+	+	+
20 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-n.propilfenil)- urea	+	+	+	+	+
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-ciclopropilfenil) urea	+	+	-		
N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2-metil-4-clorofe- nil)-urea	+	+	-		
25 N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-sec.butilfenil)- urea.	+	+	+		



Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.				
	1	0,3	0,1	0,03	0,01
5	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-isobutilfenil)- urea	+	+	±	
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-etilfenil)-urea	+	+	±	
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-n.dodecilfenil)- urea	+	+	+	
10	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-bencilfenil)-urea	±	±	±	
	N-(2,6-dibromofenzoil)- N'-(3,4-diclorofenil)- urea	±	±	±	±
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(3,4-di- clorofenil)-urea	±	±	±	-
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(3,4-diclo rofenil)-urea	±	±	±	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-bromo- fenil)-urea	+	+	+	-
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-bromo- fenil)-urea	+	+	+	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-nibutil fenil)-urea	±	±	-	
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(metil)-N'-(4-cloro- fenil)-urea	+	+	-	
25					

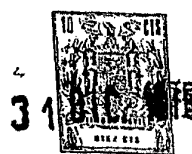


	Compuesto	Actividad Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.				
		1	0,3	0,1	0,03	0,01
5	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(etil)-N'-(4-clorofe nil)-urea	+	+	-		
	Acido 3-(2,6-dicloroben zoil)-1-(4-clorofenil)- parabánico	+	+	+		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-metilfenil)-urea	±	±	±	-	
10	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-acetilfenil)-urea	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-cloro-4-tiometil- fenil)-urea	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-tiometilfenil)- urea	+	±	-		
15	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-cloro-4-nitrofe-- nil)-urea	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3,4-dimetilfenil)- urea	±	-			
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(2-fluorofenil)-urea	+	+	-		
20	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(3-fluorofenil)-urea	±	±	-		
	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-pentiltiofenil)- urea	+	+	+	-	
25	N-(2,6-diclorobenzoil)- N'-(4-metiltiometilfe- nil)-urea.	±	±	-		



31

Compuesto	Actividad				
	Concentración expresada en mg de sustancia activa por litro.				
	1	0,3	0,1	0,03	0,01
5	N-(2-clorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea	±	±	±	
	N-(2-bromobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea	±	±	±	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea	±	±	±	±
10	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(pencil)-N'-(4-bromofenil)-urea	+	+	-	
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(bencil)-N'-(4-clorofenil)-urea	+	+	-	
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metil)-N'-(4-clorofenil)-urea	+	+	+	
15	N-(2,6-diclorobenzoil)-N-(metoximetil)-N'-(4-clorofenil)-urea	+	+	+	
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metoximetil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea	+	+	+	
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(metil)-N'-(metil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea	+	+	-	
20	N-(2,6-diclorotienbenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-urea	±	±	±	-
	N-(2,6-diclorobenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-tiurea.	±	±		
	N-(2,6-diclorotienbenzoil)-N'-(3,4-diclorofenil)-tiurea.	+	+	+	±



La presente solicitud, que corresponde  
a la presentada en Holanda, con fecha 15 de Mayo de  
1.970, bajo el Número 70 070 40, se acoge a los benefi  
cios del Artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propie  
dad Industrial.

10

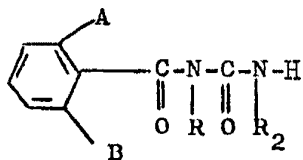
REIVINDICACIONES

15

Los puntos de invención, propia y nueva,  
que se presentan para que sean objeto de esta solicitud  
de Patente de Invención en España por VEINTE años, son  
los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

1ª.- Un método de producir compuestos de  
rivados de urea de la fórmula general

25

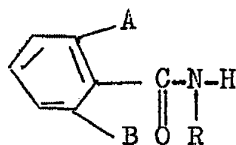


27-12-75

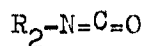
- 68 -



en que A es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno,  
 un grupo metilo o un grupo metoxi, B representa también  
 un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo me-  
 5 tilo o un grupo metoxi, con la condición de que A y B no  
 representan ambos a la vez un átomo de hidrógeno, R es  
 un átomo de hidrógeno, un grupo alcohilo, un grupo hidro-  
 xi, un grupo alcoxi, un grupo alcoximetilo, un grupo aci-  
 lo, o un grupo alcoxicarbonilo, y R<sub>2</sub> representa un grupo  
 10 fenilo sustituido o no sustituido o un grupo piridilo que  
 puede estar sustituido con halógeno, con nitro, con ciano  
 o con alcohilo halogenado, caracterizado porque se hace  
 reaccionar un compuesto de la fórmula:



15 en que A, B y R tienen los significados arriba mencionados,  
 con un compuesto de la fórmula:



en que R<sub>2</sub> tiene el significado arriba mencionado, para ob-  
 20 tener un compuesto de la fórmula general antes indicada.

2ª.- Un método de producir compuestos derivados de urea.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede  
 y para los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de sesenta y nueve hojas escri-  
 25 tas a máquina por una sola cara.

Madrid,

P.A.

01 Dic. 1915

Alberto de Eizaguirre  
 Por el A.S.P.