

4345061

Int. SA: C07D239/62//A01N9/22

PATENTE DE INVENCION

Le A 15 448-Spa.

*Memoria Descriptiva*

*sobre:*

PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR DERIVADOS DE ACIDO AMIDOCARBONILTIOBARBITURICO.

=====

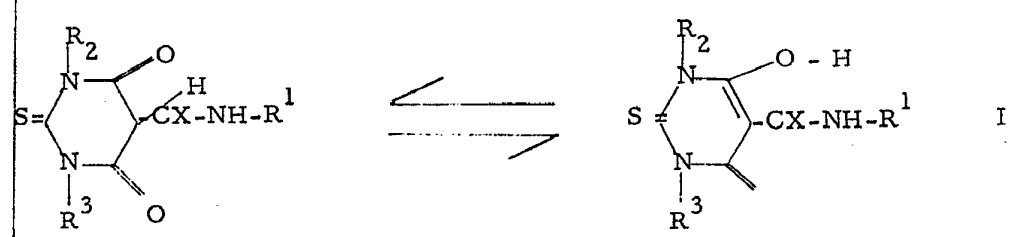
*Solicitante:* BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana, residente en Leverkusen-Bayerwerk, República Federal Alemana.

=====

La presente invención se refiere a un procedimiento para preparar nuevos derivados de ácido amidocarboniltiobarbitúrico, útiles como agentes protectores de plantas, particularmente como insecticidas, acaricidas y fungicidas.

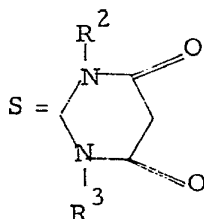
Ya se dió a conocer que derivados de ácido tio-  
 barbitúrico, tales como ácido 5-acetil-3,3-dimetil-2-tiobarbitúrico, tie-  
 nen propiedades insecticidas, acaricidas, fungicidas y herbicidas. Su  
 5 eficacia, sin embargo, no es siempre del todo satisfactoria, particu-  
 larmente en el caso de bajas cantidades y concentraciones de aplica-  
 ción (compárese: Patente publicada no examinada de la República Fede-  
 ral Alemana Nº. 2.138.049).

Ahora se ha encontrado que tienen excelentes pro-  
 piedades insecticidas, acaricidas y fungicidas los nuevos derivados de  
 10 ácido amidocarboniltiobarbitúrico de fórmula

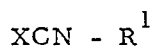


en la que R<sup>1</sup> es arilo eventualmente sustituido, aralquilo eventualmen-  
 te sustituido, cicloalquilo eventualmente sustituido, cicloalquilalquilo,  
 alquilo, alcoxilalquilo, alquiltioalquilo, halogenoalquilo, alquenilo, ci-  
 cloalquenilo, halogenoalquenilo, alquiltiocarbonilo, alcoxicarbonilo, - -  
 15 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, individualmente e independientemente uno de otro son alquilo,  
 alquenilo, cicloalquilo, arilo, aralquilo y/o hidrógeno bajo la condición  
 de que el otro radical no sea hidrógeno, y X es oxígeno o azufre, y  
 sus sales con bases fisiológicamente tolerables.

Además, se ha encontrado que se obtienen los de-  
 rivados de ácido amidocarboniltiobarbitúrico de fórmula I, si ácidos -  
 20 tiobarbitúricos de fórmula



en la cual  $R^2$  y  $R^3$  tienen los significados arriba definidos, se hacen reaccionar con isocianatos e isotiocianatos de fórmula

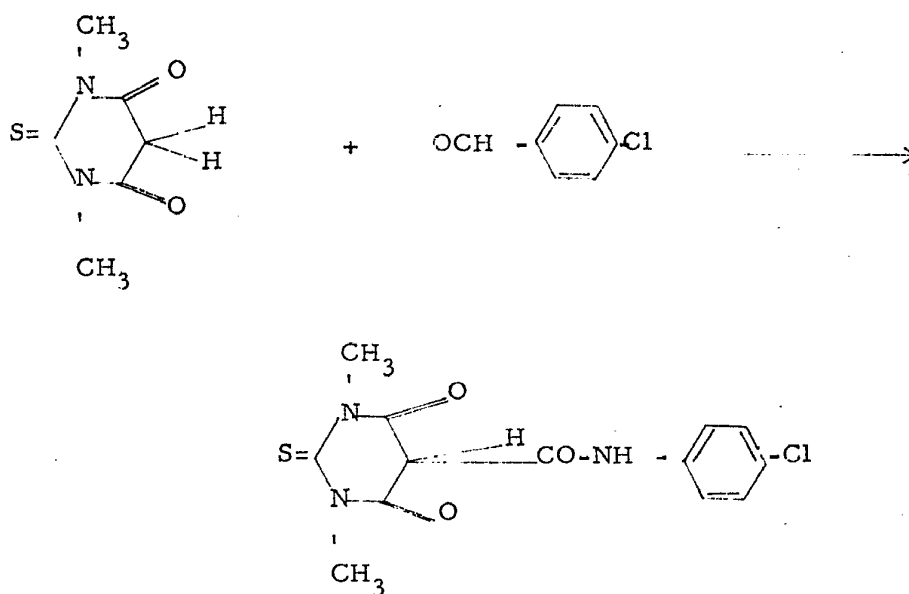


III

5 en la cual X y  $R^3$  tienen los significados arriba especificados, eventualmente en presencia de aceptores de ácidos y de disolventes o diluyentes, a temperaturas entre 10 y 150 ° C.

10 Sorprendentemente, los derivados de ácido amidocarboniltiobarbitúrico muestran un efecto insecticida, acaricida y fungicida considerablemente superior a aquel de los de los derivados de ácido tiobarbitúrico conocidos del estado de la técnica, por ejemplo del ácido 5-acetil-1,3-dimetil-2-tiobarbitúrico. Por consiguiente, representan un verdadero enriquecimiento de la técnica.

15 Si, como sustancias de partida, se emplean 1,3-dimetil-2-tiobarbitúrico e isocianato de 4-clorofenilo, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



5 Los ácidos tiobarbitúricos empleados como substancias de partida estan definidos en forma general por la formula II. En la fórmula II, R<sup>2</sup> representa preferiblemente alquilo lineal o ramificado con 1 a 6, particularmente 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6, particularmente 2 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, particularmente ciclohexilo, así como fenilo, R<sup>3</sup> por otra parte, representa preferiblemente alquilo lineal o ramificado con 1 a 6, particularmente 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 5 a 6 átomos de --

10 carbono, particularmente ciclohexilo, así como fenilo y bencilo y además hidrógeno.

Los ácidos tiobarbitúricos empleados como substancias de partida ya son conocidos; a título de ejemplo, sean mencionados:

- 15 ácido 1,3-dimetil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 1-metil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 2-etil-1-metil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 3-isopropil-1-metil-2-tiobarbitúrico,

ácido 1-metil-3-propil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 3-butil-1-metil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 1-isobutil-1-metil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 3-sec-butil-1-metil-2-tiobarbitúrico,  
5 ácido 3-ter-butil-1-metil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 1,3-diciclohexil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 1,3-difenil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 3-bencil-1-metil-2-tiobarbitúrico,  
ácido 3-alil-1-metil-2-tiobarbitúrico.

10 Los isocianatos e isotiocianatos empleados como  
substancias de partida estan definidos generalmente por la fórmula III.  
En la fórmula III,  $R^1$  representa preferiblemente alquilo lineal o rami-  
ficado con 1 a 12, particularmente 1 a 6 átomos de carbono; alcoxi-  
15 alquilo y halogenoalquilo con 1 a 12, particularmente 1 a 6 átomos de  
carbono en la parte alquilo y 1 a 3 átomos de carbono en la parte al-  
coxi, respectivamente con 1 a 3 átomos de halógeno, particularmente  
de cloro; además, alquiltioalquilo con 1 a 6 átomos de carbono en la  
parte alquilo y con 1 a 3 átomos de carbono en la parte alquiltio; ade-  
20 más, alquenilo y halogenoalquenilo con 2 a 6 átomos de carbono y -  
eventualmente 1 a 3 átomos de carbono; cicloalquilo, cicloalquilalquilo  
y cicloalquenilo con 5 a 6, particularmente 6 átomos de carbono en el  
radical cicloalquilo, respectivamente en el radical cicloalquenilo; así  
como arilo o aralquilo eventualmente substituído con 6 a 10 átomos de  
25 carbono. Además,  $R^1$  representa alcoxi- o alquiltiocarbonilo con 1 a -  
4 átomos de carbono en la parte alquilo.

Como substituyentes del radical arilo o aralqui-  
lo  $R^1$  que pueden estar contenidos una o varias veces, entran en con-  
sideración preferiblemente halógeno, particularmente fluor, cloro o --  
bromo; halogenoalquilo y halogenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono  
30 y 2 a 5 átomos de halógeno, particularmente cloro y/o fluor; alquilo

lineal o ramificado con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi y alquiltio -- con 1 a 4 átomos de carbono; alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono y/o el grupo nitro.

5 Los isocianatos, respectivamente isotiocianatos - de la fórmula III empleados como sustancias de partida, ya son conocidos o pueden ser producidos según métodos usuales. Como ejemplos sean mencionados:

- isocianato de 4-metilsulfonilmetilo,
- isocianato de 4-metoxifenilo,
- 10 isocianato de 4-etoxifenilo,
- isocianato de 3-clorofenilo,
- isocianato de 3-bromofenilo,
- isocianato de 3-fluorfenilo,
- isocianato de 4-bromofenilo,
- 15 isocianato de 4-fluorfenilo,
- Isocianato de 4-clorofenilo,
- isocianato de 4-metilfenilo,
- isocianato de 4-ter-butilfenilo,
- isocianato de 4-nitrofenilo,
- 20 isocianato de 4-trifluormetilfenilo,
- isocianato de 3-trifluormetilfenilo,
- isocianato de 3-metilfenilo,
- isocianato de 2-clorofenilo,
- isocianato de 2-metilfenilo,
- 25 isocianato de 2-metoxifenilo,
- isocianato de 3,4-ciclorofenilo,
- isocianato de 3-cloro-2-metilfenilo,
- isocianato de 2-cloro-4-nitrofenilo,
- isocianato de 4-cloro-2-metilfenilo,
- 30 isocianato de 4-cloro-3-metilfenilo,

- isocianato de 4-cloro-3-trifluormetilfenilo,
- isocianato de 3-cloro-4-trifluormetilfenilo,
- isocianato de 2-cloro-4-trifluormetilfenilo,
- isocianato de 2-cloro-4-clorofluormetilfenilo,
- 5 isocianato de 3-cloro-4-trifluormetoxifenilo,
- isocianato de 2,4,6-triclorofenilo,
- isocianato de 2,6-dicloro-4-trifluormetilfenilo,
- isocianato de 4-bromo-2-isopropilfenilo,
- isocianato de 4-bromo-2,6-dietilfenilo,
- 10 isocianato de 2,6-diisopropil-4-nitrofenilo,
- isocianato de -naftilo,
- isocianato de metilo,
- isotiocianato de metilo,
- isotiocianato de etilo,
- 15 isocianato de n-butilo,
- isocianato de ter-butilo,
- isocianato de propilo,
- isotiocianato de propilo,
- isocianato de isopropilo,
- 20 isocianato de alilo,
- isocianato de 2-metoxietilo,
- isocianato de ciclohexilo,
- isotiocianato de ciclohexilo,
- isocianato de 2-metilciclohexilo,
- 25 isocianato de 4-metilciclohexilo,
- isocianato de ciclohexilmetilo,
- isocianato de 6-clorohexilo,
- isocianato de 2-cloroetilo,
- isocianato de 4-cloro-but-2-en-ilo,
- 30 isocianato de but-2-en-ilo,

isocianato de 1-metoxi-propilo,  
isocianato de 1-clorometilprop-2-en-ilo.

5 Como sales de los ácidos amidocarboniltiobarbitú-  
ricos según la invención, entran en consideración tales con bases fisio-  
lógicamente tolerables, por ejemplo sales de trietilamina, sales de am-  
nio, sales de sodio, sales de potasio y similares.

10 Como diluyentes en el procedimiento según la in-  
vención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos iner-  
tes. A estos pertenecen preferiblemente hidrocarburos, tales como li-  
groina, éter de petróleo, benceno, tolueno, xileno; hidrocarburos clora-  
dos, tales como cloroformo, tetracloruro de carbono, cloruro de etile-  
no o metileno; cetonas, tales como acetona y metiletilcetona; éteres, -  
tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter diisobutílico, éter -  
dibutílico, tetrahidrofurano y dioxano.

15 Como aceptores de ácidos pueden aplicarse todos  
los usuales agentes ligadores de ácidos. De preferencia, sean mencio-  
nados hidróxidos alcalinos, hidróxidos alcalinotérreos, carbonatos de -  
metales alcalinos y alcalinoterreos, bases orgánicas y similares. Son  
particularmente apropiadas bases orgánicas terciarias, tales como por  
20 ejemplo trietilamina, piridina, dimetilciclohexilamino, dimetilbencilami-  
na, y agentes ligadores inorgánicos de ácidos, tales como carbonatos  
de sodio y potasio e hidrógeno.

25 Las temperaturas de reacción pueden varias den-  
tro de un margen amplio. Por lo general, se trabaja entre aproximada-  
mente 10 y 150 ° C, preferiblemente entre 20 y 100 ° C, y a la pre-  
sión normal.

30 En la realización del procedimiento según la inven-  
ción, por 1 mol de ácido tiobarbitúrico de la fórmula II se aplican 1 -  
mol de isocianato de la fórmula III y 1 a 1,2 moles de un aceptor inor-  
gánico de ácidos o 0,1 a 1 mol de un aceptor orgánico de ácidos. Un -

exceso de esta cantidad indicada no produce un mejoramiento esencial del rendimiento.

5                   Para el aislamiento, se elimina el disolvente por destilación, se recobe el residuo en agua, se acidifica y se separa -- por filtración lo no disuelto. El filtrado es desechado. El residuo es lavado bien con alcohol, secado y, en el caso dado, purificado por recristalización.

10                   Como ya se ha mencionado varias veces, las sustancias activas según el invento se distinguen por una sobresaliente eficacia insecticida y acaricida contra parásitos de plantas y de higiene. -- Tienen un buen efecto contra insectos tanto chupadores, como mordedores y contra ácaros (Acarina). Por esta razón, los compuestos según -- la invención son aplicados con buen resultado como agentes antiparasitarios en la protección de plantas.

15                   A los insectos chupadores pertenecen esencialmente pulgones (Aphidae), tales como el pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae*), el pulgón negro de las habichuelas (*Doralis fabae*), el pulgón de la avena (*Rhopalosiphum padi*), el pulgón de las arvejas (*Macrosiphum pisi*), el pulgón de las papas (*Macrosiphum solanifolii*); además, 20 el pulgón de agalla del grosellero (*Cryptomyzus korschelti*), el pulgón harinoso de manzanos (*Sappaphis mali*), el pulgón harinoso de ciruelos (*Hyalopterus arundinis*) y el pulgón negro de cerezos (*Myzus cerasi*); -- además, cochinillas (*Coccina*), por ejemplo, la cochinilla de la hiedra -- (*Aspidiotus hederæ*) la cochinilla de los agrios (*Lecanium hesperidum*), 25 así como el pulgón pegajoso (*Pseudococcus maritimus*); tisanópteros -- (*Thysanoptera*), tales como *Hercinothrips femoralis*, y chinches, por -- ejemplo, la chinche de las remolachas (*Piesma quadrata*), la chinche del algodón (*Dyusdercus intermedium*), la chinche de cama (*Cimex lectularius*), la chinche feroz (*Rhodnius prolixus*) y la chinche de Chagas (*Triatoma infestans*); además, cigarras, tales como *Euscelis bilobatus* y -- 30

*Nephotettix bipunctatus*.

En cuanto a los insectos mordedores, principalmente han de mencionarse las orugas de mariposas (Lepidoptera), tales como la palomilla de las coles (*Plutella maculipennis*), la lagarta peluda (*Lymantria dispar*), la esfinge ano de oro (*Euproctis chysorrhoea*), la oruga de librea (*Malacosoma neustria*); además, la noctuela de las coles (*Mamestra brassicae*) y la noctuela de los sembrados (*Agrotis segetum*), la gran piéride de las coles (*Pieris brassicae*), la pequeña falena invernal (*Cheimatobia Brumata*), la lagarta pequeña de la encina (*Tortrix viridana*), la oruga negra de antiope (*Laphygma frugiperda*) y la rosquilla negra del algodón egipcio (*Prudenia litura*); además, la polilla de textiles (*Hyponomeuta padella*), la polilla de la harina (*Ephestia kühniella*) y la gran polilla de la cera (*Galleria mellonella*).

Además, a los insectos mordedores pertenecen los coleópteros (Coleoptera), por ejemplo el gorgojo (*Sitophilus granarius*) = (*Calandra granaria*), la dorifora (*Leptinotarsa decemlineata*), la crisomela de la romaza (*Gastrophysa viridula*), la crisomela del rábano picante (*Phaedon cochleariae*), el escarabajo brillante de la colza (*Meligethes aeneus*), el coleóptero del frambueso (*Byturus tomentosus*), el gorgojo de las habichuelas (*Bruchidius = Acantohoscelides obtectus*), el dermesto (*dermestes frischi*), el escarabajo de Khapra (*Trogoderma granarium*), el gorgojo pardo rojizo de la harina de arroz o tribolio castaño (*Tribolium castaneum*), el gorgojo del maíz (*Calandra o Sitophilus zeamais*), el anobio de pan (*Stegobium paniceum*), el tenebrio común (*Tenebrio molitor*) y la carcoma dentada de los cereales (*Oryzaephilus surinamensis*), pero también las especies que habitan en la tierra, por ejemplo larvas de eláteros (*Agriotes spec.*) y larvas de abejorros (*Melolontha melolontha*), cucarachas, tales como la cucaracha alemana (*Blatella germanica*), la cucaracha americana (*Periplaneta ame*

5  
ricana), la cucaracha de Madeira (*Leucophaea* o *Rhyparobia madeirae*),  
la cucaracha negra de las cocinas (*Blatta orientalis*), la cucaracha gi-  
gante (*Blaberus giganteus*) y la cucaracha gigante negra (*Blaberus fus-*  
*cus*), así como *Henschoutedenia flexivitta*; además, ortópteros, por - -  
ejemplo el grillo (*Acheta domesticus*); comejenes, tales como los come-  
jenes de tierra (*Reticulitermes flavipes*) e himenópteros, tales como las  
hormigas, la hormiga de la pradera (*Lasius niger*).

10  
Los dípteros comprenden esencialmente las mos--  
cas, tales como las drosófilas (*Drosophila melanogaster*), la mosca de  
frutas del Mediterraneo (*Ceratitis capitata*), la mosca doméstica (*Musca*  
doméstica), la pequeña mosca doméstica (*Fannia canicularis*), la mosca  
brillante (*Phormia aegina*) y el moscón azul de la carne (*Calliphora - -*  
*erythrocephala*), así como el tábano (*Stomoxys calcitrans*); además, mos-  
quitos, por ejemplo cénzalos, tales como el mosquito de la fiebre ama-  
15 rilla (*Aedes aegypti*), el mosquito doméstico (*Culex pipiens*) y el mosqui-  
to de la malaria (*Anopheles stephensi*).

20  
A los ácaros (*Acari*) pertenecen particularmente -  
los ácaros hiladores (*Tetranychidae*), tales como el ácaro hilador de ha-  
bichuelas (*Tetranychus telarius* = *Tetranychus althaeae* o *Tetranychus -*  
*urticae*) y el ácaro hilador de los frutales (*Paratetranychus pilosus* = -  
*Panonychus alumi*), ácaros de agallas, por ejemplo el ácaro de agalla -  
del grosellero (*Eriophyes ribis*) y tarsonemidos, por ejemplo el ácaro -  
amarillo o de la punta de brotes (*Hemitarsonemus latus*) y el ácaro del  
fresal o de ciclámenes (*Tarsonemus pallidus*); finalmente el arador del  
25 cuero (*Ornithodorus moubata*).

30  
Además, las sustancias activas según el invento  
muestran un fuerte efecto fungitóxico y bacteriotóxico. En las concentra-  
ciones necesarias para combatir hongos y bacterias no dañan las plantas  
cultivadas y tienen una baja toxicidad para animales de sangre caliente.  
Por esta razón, son apropiadas como agentes protectores de plantas - -



básicamente en consideración: hidrocarburos aromáticos tales como xileno, tolueno, benceno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos --  
5 clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano, parafinas por ejemplo fracciones de petróleo, alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, solventes polares fuertes tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua, bajo agentes diluyentes o portadores gaseosos licuados, se entienden aquellos líquidos que son gaseosos a temperatura normal y bajo presión normal, por ejemplo gases propulsores de aerosol, tales como hidrocarburos halogenados por ejemplo, freón; como portadores sólidos entran en consideración minerales naturales molidos tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos molidos, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como agentes emulsionantes entran en consideración: emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilénicos de --  
10 ácidos grasos, éteres polioxietilénicos de alcoholes grasos, por ejemplo éter alquilarilpoliglicólico, alquilsulfonatos, alquilsulfatos y arilsulfonatos; como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfito y metilcelulosa.

Las sustancias activas según el invento pueden estar presentes en las formulaciones en mezcla con otras sustancias --  
25 activas conocidas.

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

Las sustancias activas pueden estar aplicadas como tales, en forma de sus formulaciones o en las formas de aplicación  
30

de ellas preparadas, tales como soluciones listas para el uso, concentrados emulsionables, emulsiones, suspensiones, polvos rociables, pastas, polvos solubles, agentes de espolvoreo y granulados. La aplicación es efectuada en la forma usual, por ejemplo por rociada, pulverización nebulización, espolvoreo, esparcimiento, fumigación, gasificación, riego, desinfección o incrustación.

Las concentraciones de la sustancia activa en las preparaciones listas para aplicar, pueden variar dentro de límites amplios. Por lo general, están entre 0,0001 y 10 %, preferiblemente entre 0,01 y 1 %.

Las sustancias activas pueden ser aplicadas también con buen resultado en el procedimiento de volumen ultra-bajo, donde es posible aplicar formulaciones de hasta un 95 % o hasta de un 100 %.

Las múltiples posibilidades de aplicación de las sustancias activas surgen de los siguientes ejemplos.

#### Ejemplo A

Ensayo con larvas de *Phaedon*.

Disolvente : 3 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsivo: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólicos.

Para la producción de una preparación adecuada de sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada del disolvente que contiene la cantidad indicada del emulsivo, y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Se rocía la preparación de sustancia activa sobre

hojas de col (*Brassica oleracea*) hasta su mojadura al grado de formación de gotas y sobre las hojas se colocan larvas de la crisomela del rábano picante (*Paedon cochleariae*).

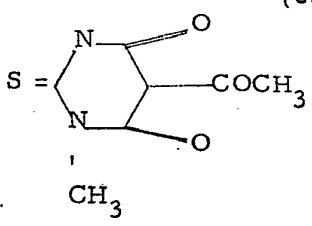
5 Al cabo de los tiempos indicados, se determina en % el grado de destrucción, significando 100 % que fueron matadas todas las larvas, mientras que 0 % significa que no fué matada ninguna larva.

10 Las sustancias activas, sus concentraciones, los tiempos de evaluación y los resultados se encuentran indicados en la siguiente tabla:

T A B L A A.

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con larvas de *Phaedon*

15	Substancias activas (Ejemplo Nº)	Concentración de la sustancia activa en %	Grado de des- trucción en % al cabo de 3 días.
	<p style="text-align: center;">(conocido)</p> 	0,1 0,001	100 0
20	(12)	0,1 0,01	100 100
	(21)	0,1 0,01	100 100

Continuación de la Tabla A.

	Substancias activas (ejemplo Nº)	Concentración de la subst. activa en %	Grado de destruc- ción en % al ca- bo de 3 días.
5	(5)	0,1	100
		0,01	100
	(31)	0,1	100
		0,01	95
10	(27)	0,1	100
		0,01	95
	(18)	0,1	100
		0,01	100
	(18) Sal de trietilamonio	0,1	100
		0,01	100
15	(41)	0,1	100
		0,01	100
	(38)	0,1	100
		0,01	100
20	(35)	0,1	100
		0,01	100

Continuación de la Tabla A

	Substancias activas (ejemplo Nº)	Concentración de la subst. activa en %	Grado de destruc- ción en % al cabo de 3 días.
5	(52)	0,1	100
		0,01	100
	(2)	0,1	100
		0,01	100
10	(22)	0,1	100
		0,01	90
	(33)	0,1	100
		0,01	100
	(30)	0,1	100
		0,01	100
15	(19)	0,1	100
		0,01	100
	(42)	0,1	100
		0,01	90
20	(39)	0,1	100
		0,01	80

Continuación de la Tabla A.

	Substancias activas (ejemplo Nº)	Concentración de la subst. activa en %	Grado de destruc- ción en % al cabo de 3 días.
5	(8)	0,1	100
		0,01	100
	(3)	0,1	100
		0,01	100
10	(23)	0,1	100
		0,01	100
	(51)	0,1	100
		0,01	100
	(6)	0,1	100
		0,01	100
15	(48)	0,1	100
		0,01	100
	(50)	0,1	100
		0,01	90

Ejemplo B.

Ensayo con *Tetranychus* (resistente).

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida

Emulsivo: 1 parte en peso de éter alquilarilpoli-  
glicólico.

Para la producción de una preparación de substan-  
cia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la -  
cantidad indicada del disolvente que contiene la cantidad indicada del -  
emulsivo, y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración de  
seada.

La preparación de sustancia activa es pulveriza-  
da sobre plantas de habichuela (*Phaseolus vulgaris*) de una altura de --  
10 a 30 cm, hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Estas  
plantas de habichuela estan fuertemente atacadas por ácaros hiladores -  
comunes (*Tetranychus urticae*) en todos sus estados de desarrollo.

Al cabo de los tiempos indicados, se determina la  
eficacia de la preparación de sustancia activa, contándose los ácaros -  
muertos. El grado de destrucción así obtenido es indicado en %, signi-  
ficando 100 % que fueron matados todos los ácaros hiladores, mientras  
que 0 % significa que no fué matado ningún ácaro hilador.

Las sustancias activas, sus concentraciones, los  
tiempos de evaluación y los resultados se encuentran indicados en la si-  
guiente tabla:

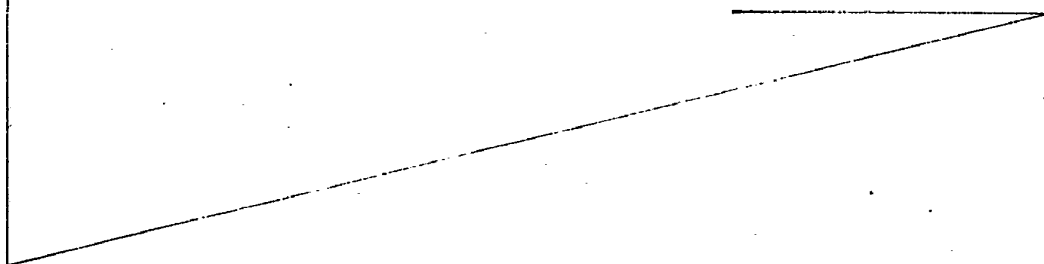


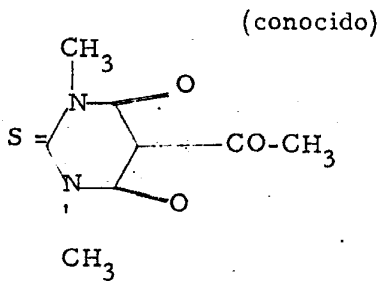
TABLA B

(Acaros nocivos para plantas)

(Ensayo con Tetranychus)

5

Substancias activas (Ejemplo Nº)	Concentración de la subst. activa en %	Grado de destruc- ción en % al cabo de 2 días.
-------------------------------------	---	--



0,1	40
0,01	0

(63)	0,1	100
------	-----	-----

10

(60)	0,1	90
------	-----	----

Ejemplo C.

Ensayo de crecimiento de micelios.

Medio de cultivo utilizado:

20 partes en peso de agar-agar

200 partes en peso de agua de cocimiento de papas

5 partes en peso de malta

15 partes en peso de dextrosa

5 partes en peso de peptona

2 partes en peso de  $\text{Na}_2\text{HPO}_4$

0,3 partes en peso de  $\text{Ca}(\text{NO}_3)_2$

Relación de mezcla de disolventes al medio de cultivo:

2 partes en peso de mezcla de disolventes

100 partes en peso del medio de cultivo

Composición de la mezcla de disolventes:

0,19 partes en peso de acetona

0,01 partes en peso de emulsivo éter alquilaril--  
poliglicólico

1,80 partes en peso de agua

2,00 partes en peso de mezcla de disolventes.

Se mezcla la cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de la sustancia activa en el medio de cultivo con la cantidad indicada del disolvente. Se mezcla bien el concentrado, en la relación cuantitativa indicada, con el medio de cultivo líquido enfriado hasta  $42 \text{ }^\circ \text{C}$ , y se vierte la mezcla en placas de Petri de un diámetro de 9 cm. Además, se preparan placas testigos sin la adición de la sustancia activa.

Una vez enfriado y sólido el medio de cultivo, las placas son inoculadas con las especies de hongos indicados en la tabla y son sometidas a la incubación a aproximadamente  $21 \text{ }^\circ \text{C}$ .

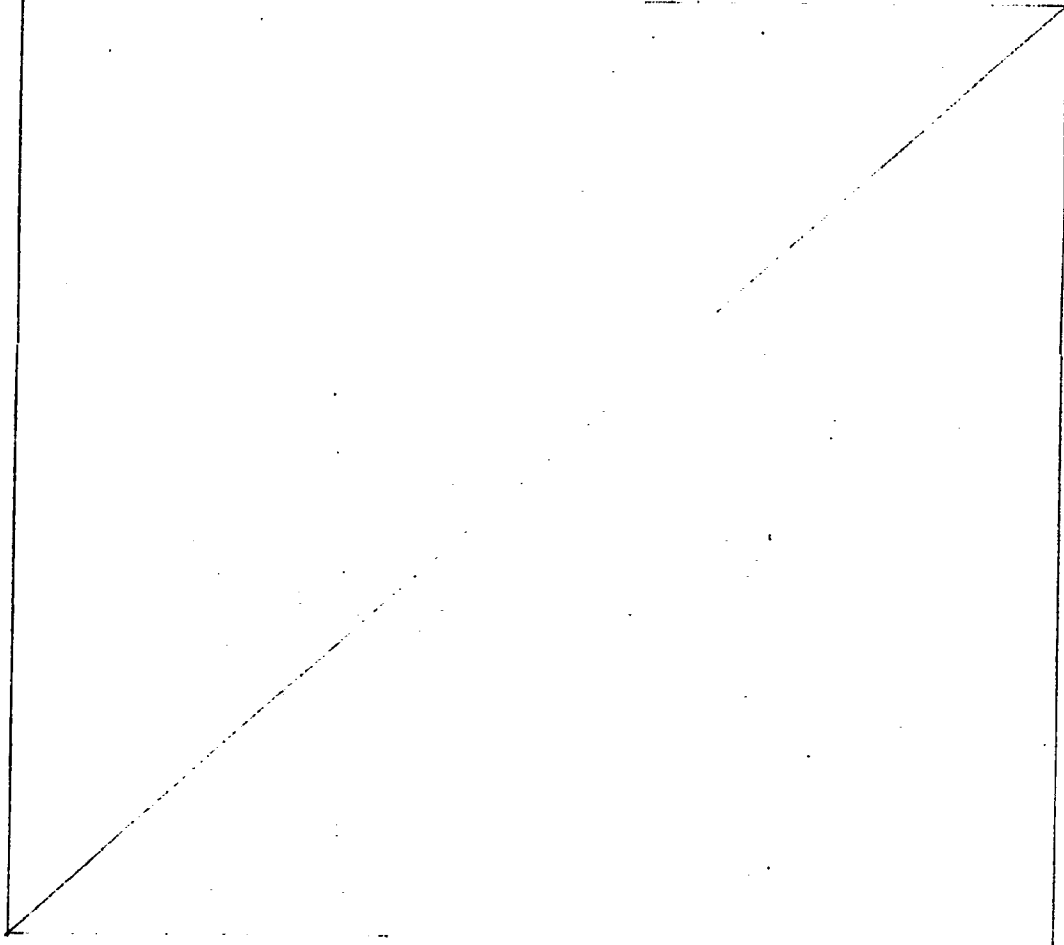
5

La evaluación es efectuada, según la velocidad del crecimiento de los hongos, al cabo de 4 a 10 días. En la evaluación se compara el crecimiento radial de los micelios sobre el medio de cultivo tratado con aquel sobre el medio de cultivo testigo. La clasificación del crecimiento de los hongos procede conforme a las siguiente escala:

10

- 1 = ningún crecimiento de los hongos
- hasta 3 = inhibición muy fuerte del crecimiento
- hasta 5 = inhibición medio fuerte del crecimiento
- hasta 7 = inhibición débil del crecimiento
- 9 = crecimiento igual a aquel del testigo no tratado.

Las sustancias activas, sus concentraciones y -- los resultados se encuentran indicados en la siguiente tabla.



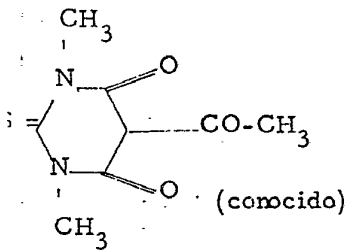
T A B L A C.

Ensayo de crecimiento de micelios a una concentración de sustancia activa de

H o n g o s   y   B a c t e r i a s

Substancias activas  
(Ejemplo Nº)

Fusarium  
culmorum  
Sclerotina  
sclerotiorum  
Fusarium  
nivale  
Colletotrichum  
coffeanum  
Rhizoctonia  
solani  
Pythium  
ultimum  
Cochliobolus  
miyabeanus



	9	5	9	9	9	9	9
(22)	-	5	-	-	3	1	5
(1)	3	3	3	-	1	1	-
(9)	-	5	-	5	-	5	5
(18)	5	3	5	1	-	5	5
(38)	-	-	-	-	3	1	-
(35)	-	-	-	-	5	5	-
(59)	-	1	5	1	-	1	5



T A B L A C (Continuación)

Ensayo de crecimiento de micelios a una concentración de sustancia activa en

H o n g o s y B a c t e r i a s

Substancias activas (Ejemplo Nº)	Fusarium culmorum	Sclerotina sclerotiorum	Fusarium nivale	Colletotrichum coffeaeum	Rhizoctonia solani	Pythium ultimum	Cochliobolus miyabeanus
(3)	-	-	-	5	5	-	-
(23)	-	-	-	-	-	5	-
(15)	1	1	5	-	-	3	-
(17)	5	1	5	5	-	3	5
(63)	3	1	3	1	2	2	3
(27)	1	1	3	1	3	3	5
(31)	1	1	3	2	5	3	5
(19)	1	1	3	2	3	5	3
(10)	-	-	-	-	-	-	-
(42)	3	5	3	5	-	5	5

T A B L A C (Continuación)

Ensayo de crecimiento de micelios a una concentración de sustancia activa en 100

H o n g o s   y   B a c t e r i a s

Substancias activas (Ejemplo Nº)	Fusarium culmorum	Sclerotina sclerotiorum	Fusarium nivale	Colletotrichum coffeanum	Rhizoctonia solani	Pythium ultimum	Cochliobolus miyabeanus
(50)	-	-	-	-	5	5	5
(60)	3	-	5	5	1	5	5
(5)	5	5	5	5	3	5	5
(11)	-	5	-	5	3	5	3
(6)	5	5	5	5	1	5	3
(12)	-	5	-	3	3	5	5
(21)	-	-	-	-	-	-	-

100 ppm.

Botrytis cinerea  
 Verticillium alboatrum  
 Pyricularia oryzae  
 Phialophora cinerescens  
 Helminthosporium gramineum  
 Mycosphaerella musicola  
 Phytophthora cactorum  
 Venturia inaequalis  
 Pellicularia sasakii  
 Xanthomonas oryzae

---

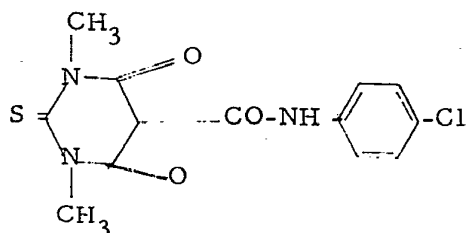
5	-	3	-	5	-	5	5	-	-
-	-	-	-	1	-	1	1	1	-
3	-	1	-	1	-	1	1	-	-
3	-	1	-	1	-	-	1	-	-
1	5	2	-	1	1	1	1	1	-
3	5	1	-	3	-	-	1	1	5
3	5	1	-	3	-	3	1	3	-
3	-	3	-	3	-	-	1	1	-
5	-	1	-	3	-	5	-	-	-
5	5	1	-	1	-	5	-	5	-

ppm.

	<i>Botrytis cinerea</i>	<i>Verticillium alboatrum</i>	<i>Pyricularia oryzae</i>	<i>Phialophora cinerescens</i>	<i>Helminthosporium gramineum</i>	<i>Mycosphaerella musicola</i>	<i>Phytophthora cactorum</i>	<i>Venturia inaequalis</i>	<i>Pellicularia sasakii</i>	<i>Xanthomonas oryzae</i>
5	-	5	-	3	-	1	-	-	-	
5	5	3	-	3	-	1	-	-	-	
5	5	5	-	1	-	1	-	5	-	
5	-	-	-	3	-	1	-	-	-	
2	-	3	-	3	-	1	-	-	-	
5	5	5	-	1	-	1	-	5	-	
-	5	1	5	1	-	1	1	1	-	

Ejemplos de Preparación

(1)



Se disuelven 8,6 g (0,05 moles) de ácido 1,3-dimetil-2-tio-barbitúrico en 200 ml de benceno y a la solución se agregan a la temperatura ambiente 5,0 g (0,05 moles) de trietilamina. Se calienta la solución a 35 - 40 ° C y lentamente bajo agitación y refrigeración por reflujo se instilan 7,7 g (0,05 moles) de isocianato de 4-clorofenilo. Después de un calentamiento durante 15 horas con reflujo, se enfría y se acidifica con 10 ml de ácido clorhídrico concentrado. Se elimina el disolvente por destilación en vacío. Se recoge el residuo en 200 ml de agua, disolviéndose cloruro de trietilamonio. Se separa por filtración lo no disuelto, se lo lava dos veces, cada vez con 50 ml de metanol y se lo seca.

Se obtienen 13,5 g ( 83 % de la teoría ) de ácido 5-(4'-cloro-1'-anilido)-carbonil-1,3-dimetil-2-tiobarbitúrico del P.f. = 243 - 245 ° C.

En forma análoga se obtienen los compuestos según los ejemplos enumerados en la siguiente tabla:

T A B L A 1.

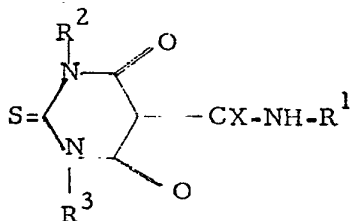


Tabla 1 (Continuación)

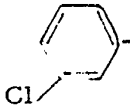
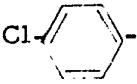
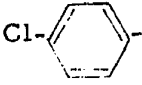
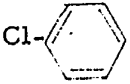
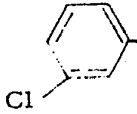
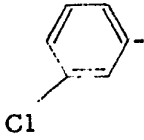
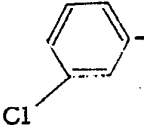
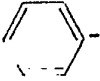
Ejemplo Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P.f. (° C)
2		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	165-167
3		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	183-184
4		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	179-180
5		CH <sub>3</sub>	H	O	274-275
6		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	136-137
7		CH <sub>3</sub>	H	O	278
8		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	148
9		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	203-204

Tabla 1 (Continuación)



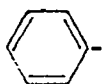
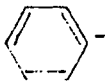

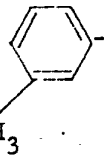
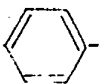
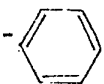
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
10		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	174-176
11		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	192
12		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	274
13	NO <sub>2</sub> - 	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	224-225
14	NO <sub>2</sub> - 	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	179-180
15		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	160-162
16	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C - 	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	175-178
17	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O - 	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	180

Tabla 1 (Continuación)





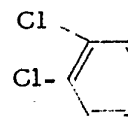
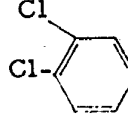
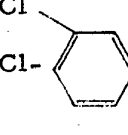
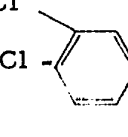
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
18	CF <sub>3</sub> - 	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	162-165 Sal de trietil amonio 140-143
19	CF <sub>3</sub> - 	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	155
20	CF <sub>3</sub> - 	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	128-130
21	CF <sub>3</sub> - 	CH <sub>3</sub>	H	O	256-257
22	Cl- 	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	218-220
23	Cl- 	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	O	150-154
24	Cl- 	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	194-195
25	Cl- 	CH <sub>3</sub>	H	O	272

Tabla 1 (Continuación)

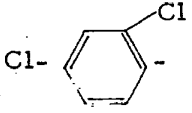
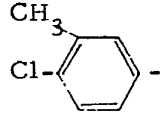
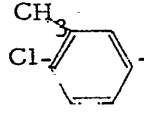
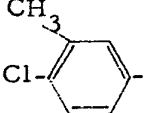
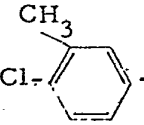
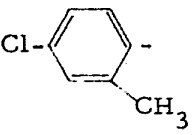
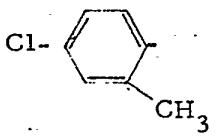
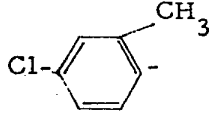
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
26		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	214-215
27		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	190-194
28		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	170-172
29		CH <sub>3</sub>	H	O	290
30		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	140-141
31		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	206-207
32		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	194-196
33		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	151-152

Tabla 1 (Continuación)

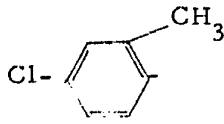
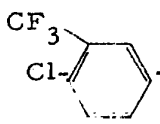
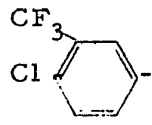
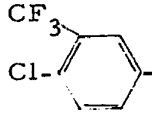
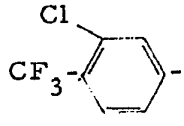
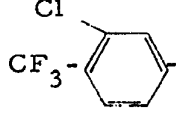
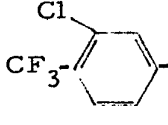
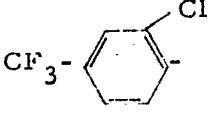
Ejemplo Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
34		CH <sub>3</sub>	H	O	247-248
35		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	196-197
36		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	150-152
37		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	164-165
38		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	185
39		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	150
40		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	134-137
41		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	168-169

Tabla 1 (Continuación)

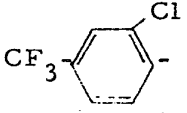
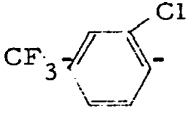
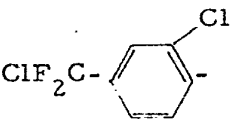
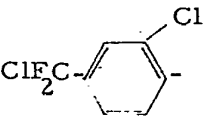
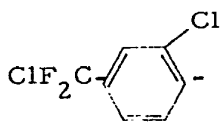
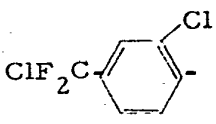
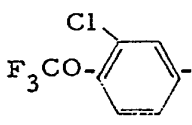
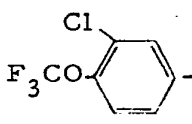
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. L. (°C)
42		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	145-146
43		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	134-135
44		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	148-152
45		CH <sub>3</sub>	H	O	212
46		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	120-121
47		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	144-145
48		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	157-158
49		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	114-115

Tabla 1 (Continuación)

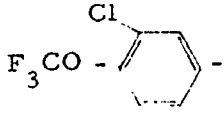
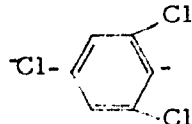
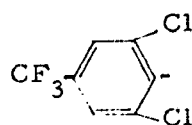
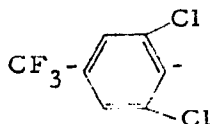
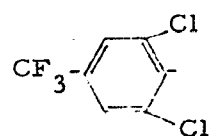
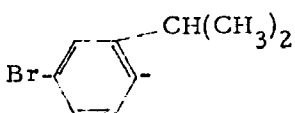
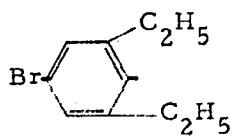
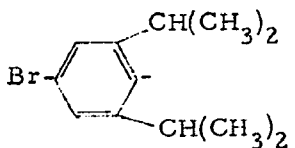
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
50		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	136-137
51		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	138-140
52		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	165-166
53		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	128-130
54		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	140-142
55		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	173-174
56		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	200
57		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	225

Tabla I (Continuación)

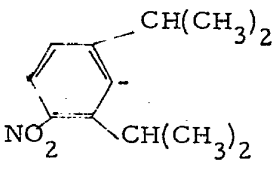
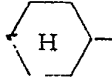
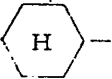
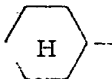
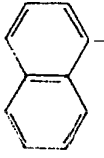
Ejemplo Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
58		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	259-261
59		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	174-175
60		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	113-114
61		CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	118-119
62		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	259-260
63	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	162
64	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	168-169
65	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	122
66	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	114-115

Tabla 1 (Continuación)

Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (° C)
67	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	O	277
68	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	91-94
69	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	75-78
70	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	80-81
71	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	O	204-205
72	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	80-82
73	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	69-72
74	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	O	167
75	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	115
76	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	72
77	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	62-64

Tabla 1 (Continuación)

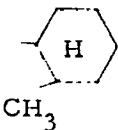
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
78	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	154-155
79	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	87-92
80	CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	125-126
81	CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	121-123
82	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	80-81
83	-COSC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	94-96
84	-COSC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	94-97
85	C <sub>5</sub> H <sub>10</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	55-56
86	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	S	103-105
87	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	O	208-210
88		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	121

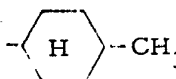
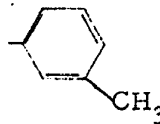
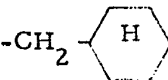
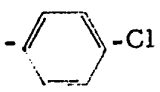
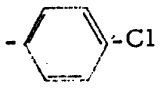
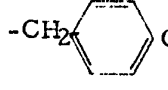
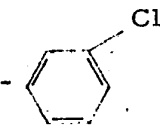
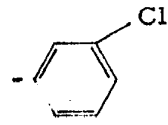
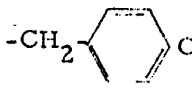
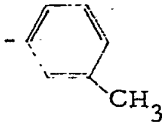
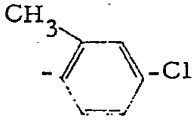
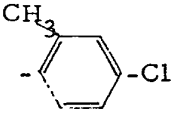
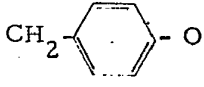
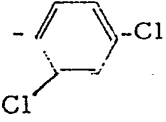
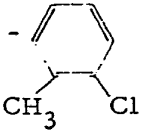
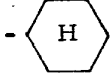
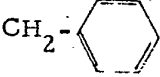
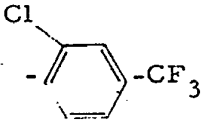
Tabla 1 (Continuación)					
Ejemplo Nº.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
89		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	123
90		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	114-115
91		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	100-102
92	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	48
93		CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	O	158
94		CH <sub>3</sub>		O	174
95		CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	O	148
96		CH <sub>3</sub>		O	158-160

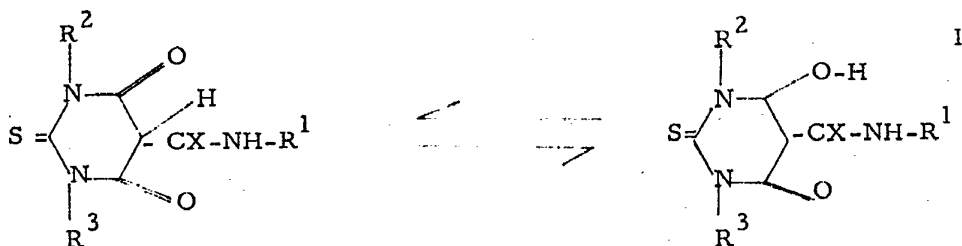
Tabla 1 (Continuación)

Ejemplo No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	P. f. (°C)
97		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	114-115
98		CH <sub>3</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	O	160-163
99		CH <sub>3</sub>		O	213-214
100		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	177-178
101		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	238-239
102		CH <sub>3</sub>		O	110
103		C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	O	

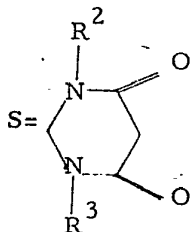
N O T A .

Descrita suficientemente la naturaleza del inven-  
to, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse --  
constar, que las disposiciones anteriormente indicadas son suscepti- -  
bles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fun-  
damental; también se hace constar que el invento se refiere a una So-  
licitud de Patente presentada en la República Federal Alemana, con fe-  
cha 7 de febrero de 1.974, nº. P 24 05 733.8; acogiéndose por lo tan-  
to a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vi-  
gor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo  
que se solicita Patente de Invención por 20 años en España, sobre: -  
Procedimiento para preparar derivados de ácido amidocarboniltiobarbitú-  
rico; caracterizándose por lo siguiente:

1. - Procedimiento para preparar derivados de -  
ácido amidocarboniltiobarbitúrico, de fórmula

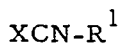


en la que R<sup>1</sup> es arilo eventualmente sustituido, aralquilo eventualmen-  
te sustituido, cicloalquilo eventualmente sustituido, cicloalquilalquilo,  
alquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, halogenoalquilo, alquenilo, ci-  
cloalquenilo, halogenoalqueno, alquiltiocarbonilo, alcoxicarbonilo, R<sup>2</sup>  
y R<sup>3</sup>, individualmente e independientemente uno de otro, son alquilo,  
alquenilo, cicloalquilo, arilo, aralquilo y/o hidrógeno bajo la condición  
de que el otro radical no sea hidrógeno, y X es oxígeno o azufre, y -  
sus sales con bases fisiológicamente tolerables; caracterizado porque  
ácidos tiobarbitúricos, de fórmula



II

en la cual R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> tienen los significados arriba definidos, se hacen --  
reaccionar con isocianatos e isotiocianatos de fórmula



III

5 en la cual X y R<sup>3</sup> tienen los significados arriba especificados, even-  
tualmente en presencia de aceptores de ácidos y de disolventes o dilu-  
yentes, a temperaturas entre 10 y 150 ° C.

2.- Procedimiento según la reivindicación 1, ca-  
racterizado porque como agente aceptor de ácido, se emplea preferi-  
blemente carbonato o hidróxido de sodio o potasio.

10 3.- Procedimiento según la reivindicación 1, ca-  
racterizado porque como disolvente o diluyente, se emplea preferible-  
mente benceno, tolueno o xileno.

4.- Procedimiento para preparar derivados de --  
ácido amidocarboniltiobarbitúrido tal y como queda sustancialmente des-  
crito en la presente Memoria.

15 5.- Esta Memoria consta de cuarenta hojas es-  
critas a máquina por una sola cara.

Madrid, - 6 FEB. 1975

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT,

J. GÓMEZ ACEBO Y MONET  
E. Elmado, L. Gasta Fernández