



PATENTE DE INVENCION

Ref. Le A 14 118-I.Sp.

438081

Int. Cl.:	AdIN

Memoria Descriptiva

sobre:

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE
1,2,4-TRIAZOL.

=====

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

=====

La presente invención se refiere a un proce-
dimiento para preparar nuevos derivados de 1,2,4-tria-
zol y sus sales.

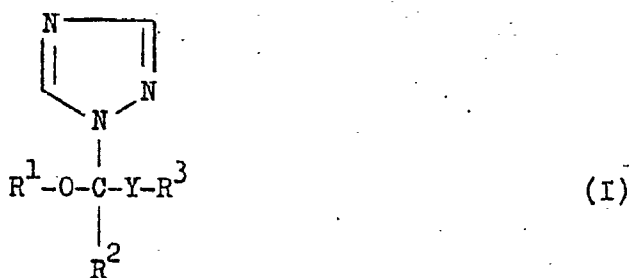
Ya se ha dado a conocer que el acetato de
n-dodecil-guanidina es bien eficaz como agente fungi-



cida y tiene propiedades protectivas y perceptiblemente curativas (compárese: Patente norte-americana No. 2.425.341). Dado que, sin embargo, la tolerabilidad de ese compuesto por ciertas clases de frutas es baja, puede ser aplicado tan sólo durante la pre-florescencia.

Además, se dió a conocer que el 1-tritil-1,2,4-triazol tiene eficacia fungicida (compárese: Patente suiza No. 488.713). Sin embargo, en bajas cantidades y a bajas concentraciones de aplicación, su efecto no siempre es enteramente satisfactorio.

Se ha encontrado que tienen excelentes propiedades fungitóxicas y sistemáticamente fungicidas los nuevos derivados de 1,2,4-triazol de la fórmula:



25

en la que R^1 es un radical fenilo que, en caso dado, puede estar sustituido por halógeno, nitro, trifluormetilo, alquilo con hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con hasta 4 átomos de carbono y fenilo; R^2 es hidrógeno, un radical alquilo con hasta 4 átomos de carbono ó fenilo; R^3 es un radical alquilo con hasta 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 5 a 6 átomos de carbono, fenilo ó 4-clorofenilo; e Y es el grupo CO, el

30

grupo $\overset{\text{C}}{\parallel} \text{N}-\text{OH}$ ó $\text{C}(\text{OH})_2$; así como sus sales.



El procedimiento para preparar los derivados de 1, 2,4-triazol de fórmula (I), respectivamente sus sales, se efectúa de tal manera que compuestos de fórmula

5



10

en la cual R^1 , R^2 , R^3 e Y tienen los significados arriba definidos, se hacen reaccionar con hidroccloruros de 1,2,4-triazol, eventualmente en presencia de un diluyente y eventualmente en presencia de un catalizador ácido, y que, en el caso deseado, de los compuestos obtenidos por este procedimiento, se preparan las sales.

15

Sorprendentemente, los derivados de 1,2,4-triazol y sus sales según el invento muestran un efecto fungicida considerablemente superior a aquél del acetato de n-dodecyl-guanidina y del 1-tritil-1,2,4-triazol conocidos del estado de la técnica que son las sustancias activas mas parecidas de igual tipo de acción. Por consiguiente las sustancias de acuerdo con el invento representan un enriquecimiento de la técnica.

20

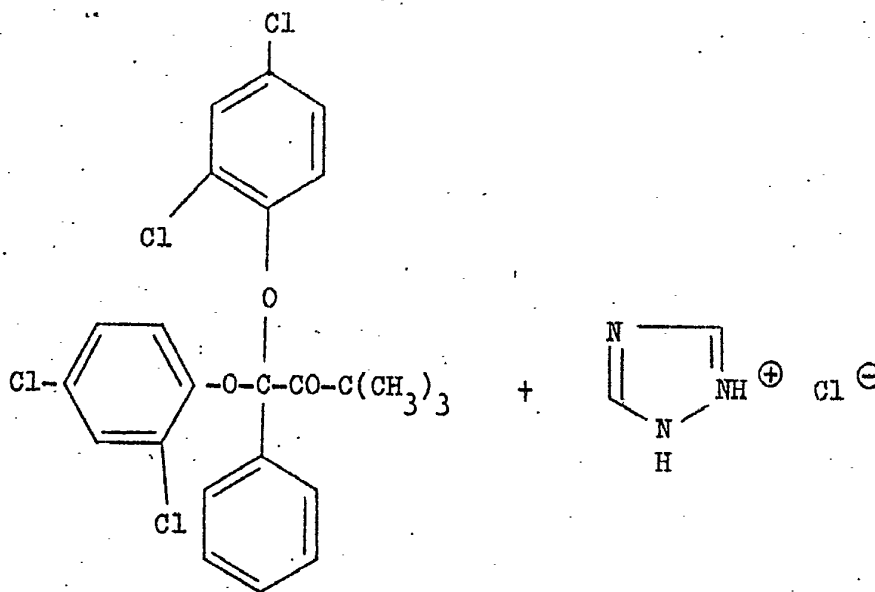
25

Si, como sustancias de partida, se aplica 1-bis-[2',4'-dicloro]-fenoxi-1-fenil-3-dimetil-butan-2-ona y el hidroccloruro de 1,2,4-triazol, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



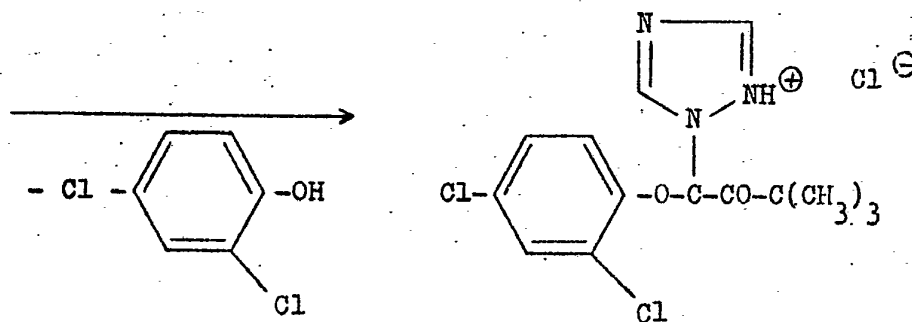
- 4 -

5



10

15



20

Como ejemplos de los compuestos de la fórmula (II) aplicables según la invención, en detalle sean mencionados:

25

- 1-fenil-1,1-bis-fenoxi-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-fenil-1,1-bis-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-fenil-1,1-bis-(3'-clorofenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-fenil-1,1-bis-(2',4'-diclorofenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-fenil-1,1-bis-(4'-metoxifenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-fenil-1,1-bis-(4'-metilfenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-(4-clorofenil)-1,1-bis-fenoxi-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-(4-clorofenil)-1,1-bis-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona,
- 1-(4-clorofenil)-1,1-bis-(2',4'-diclorofenoxi)-3,3-dimetil-

30



-butan-2-ona,

1-(4-clorofenil)-1,1-bis-(4'-metilfenoxi)-3,3-dimetil-butan-
-2-ona,

1-(4-clorofenil)-1,1-bis-(4'-nitrofenoxi)-3,3-dimetil-butan-
-2-ona,

ω -fenil- ω, ω -bis-fenoxi-acetofenona,

ω -fenil- ω, ω -bis-(4'-clorofenoxi)-acetofenona,

ω -metil- ω, ω -bis-fenoxi-acetofenona,

ω -metil- ω, ω -bis-(4'-clorofenoxi)-acetofenona,

ω -metil- ω, ω -bis-(2',4'-diclorofenoxi)-acetofenona,

ω -metil- ω, ω -bis-(2',6'-diclorofenoxi)-acetofenona,

ω -etil- ω, ω -bis-(4'-clorofenoxi)-acetofenona,

2-dimetoxi-butan-3-ona,

2-dietoxi-butan-3-ona,

2-bis-fenoxi-butan-3-ona,

2-dimetoxi-etan-3-ona,

α, α -bismetil-bencil-cetal,

α, α -bisetil-bencil-cetal,

1,1-dimetoxi-1,2-bis-ciclohexil-etan-2-ona,

1,1-dimetoxi-1,2-bis-ciclopentil-etan-2-ona,

2,5-dimetil-3,3-dimetoxi-hexan-4-ona,

2,5-dimetil-3,3-dietoxi-hexan-4-ona,

2,5-dimetil-3,3-bis-fenoxi-hexan-4-ona.

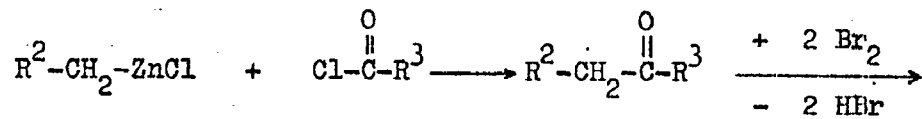
Los cetales aplicados como sustancias de partida
de la fórmula (II), son en parte conocidos. Los aún no cono-
cidos pueden ser preparados según procedimientos usuales (com-
párese: J. Chem. Soc. (London) (1.970) 3, páginas 462 a 464;
Liebigs Ann. Chem. 735 (1.970), páginas 145 a 157). Además,
estos cetales pueden ser preparados por la síntesis de Refor-
matzky ó la síntesis de Grignard que conduce a una aralquil-



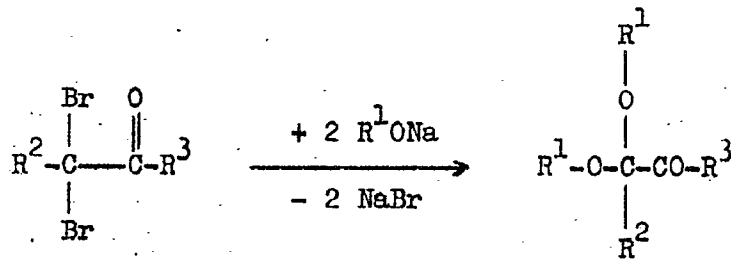
cetona; además, por bromación en el átomo de carbono vecino al grupo ceto y por reacción de la dibromocetona formada con un alcoholato ó fenolato, de acuerdo con los dos siguientes esquemas de fórmulas:

5

Esquema de fórmulas 1:

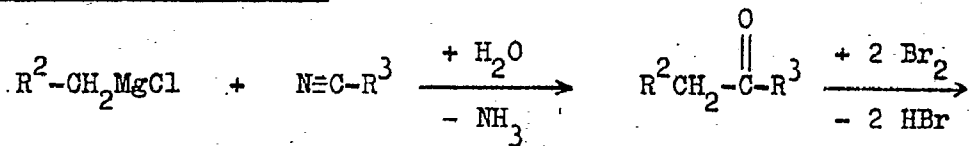


10

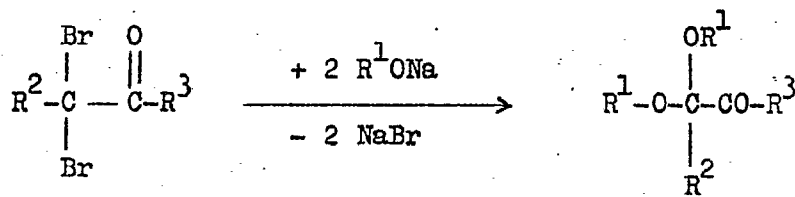


15

Esquema de fórmulas 2:



20



25

Como sales de los compuestos de 1,2,4-triazol de la fórmula (I), de preferencia, sean mencionadas tales con ácidos fisiológicamente tolerables. Ejemplos de tales ácidos son los ácidos halogenhídricos, como por ejemplo el ácido clorhídrico y el ácido bromhídrico, particularmente el ácido

30



5 clorhídrico; el ácido fósforico, ácidos carboxílicos mono- y bifuncionales y ácidos hidroxicarboxílicos, tales como por ejemplo los ácidos acético, maléico, succínico, fumárico, tartárico, cítrico, salicílico, sórbico, láctico, 1,5-nafteno-disulfónico.

10 Como diluyentes en la reacción de compuestos de la fórmula (II) con hidroclo^ruros de 1,2,4-triazol, pueden emplearse disolventes orgánicos polares de elevado punto de ebullición. A éstos pertenecen preferiblemente sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo; formamidas, tales como dimetilformamida; éteres, tales como dioxano ó éter dinutílico. La reacción según el procedimiento (d), sin embargo, de preferencia, se lleva a cabo sin disolventes, vale decir, en masa fundida.

15 En la ejecución del procedimiento, para facilitar el desdoblamiento de alcohol, respectivamente de fenol, puede ser conveniente agregar catalizadores ácidos, tales como por ejemplo ácido clorhídrico ó ácido p-toluensulfónico.

20 En el procedimiento, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un margen amplio. Por lo general, se trabaja entre aproximadamente 80° y aproximadamente 250° C., preferiblemente entre 120° y 200° C. y particularmente entre 140° y 190° C. En presencia de un disolvente, convenientemente se trabaja a la temperatura de ebullición del respectivo disolvente.

25 En la realización del procedimiento según la invención, por 1 mol del compuesto de la fórmula (II), preferiblemente se aplican aproximadamente 1 mol de hidroclo^ruro de 1,2,4-triazol y, en algunos casos, aproximadamente, 0,01 a 30 0,1 mol de catalizador.



5 Para aislar los compuestos de la fórmula (I), se recoge la mezola de reacción en agua, disolviéndose la misma parcialmente; se neutraliza la suspensión con álcali ó carbonato de álcali y se extrae la misma con disolventes orgánicos poco miscibles con agua, por ejemplo cloruro de metileno. Se seca la fase orgánica y se elimina el disolvente por destilación. El residuo sólido ó aceitoso obtenido es purificado por recristalización.

10 Los compuestos de la fórmula (I) obtenidos por el procedimiento de la invención, pueden ser transformados según los métodos usuales en derivados funcionales (de la agrupación ceto) y/ó en sus sales.

15 Como nuevas sustancias activas preparables según el procedimiento de la invención, en detalle sean mencionadas:

20 $\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - \text{fenoxi} \right] - \text{acetofenona}$,
 $\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 4'\text{-clorofenoxi} \right] - \text{acetofenona}$,
 $\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 3'\text{-clorofenoxi} \right] - \text{acetofenona}$,
 $\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 2',4'\text{-diclorofenoxi} \right] - \text{aceto}$
fenona,

25 $\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 2',4'\text{-diclorofenoxi} \right] - 4\text{-clo}$
ro-acetofenona,

$\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 2',6'\text{-diclorofenoxi} \right] - \text{aceto}$
fenona,

30 $\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 4'\text{-metoxifenil} \right] - \text{acetofenona}$,

$\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 4'\text{-metilfenoxi} \right] - \text{acetofenona}$,

$\left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 2'\text{-metilfenoxi} \right] - \text{acetofenona}$,

$\left[\omega - \text{metil} \right] - \left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 4'\text{-clorofenoxi} \right] -$
acetofenona,

$\left[\omega - \text{fenil} \right] - \left[\omega - (1,2,4\text{-triazolil-1}') \right] - \left[\omega - 2',4'\text{-diclorofe}$



- noxi]-acetofenona,
[ω-fenil]-[ω-(1,2,4-triazolil-1')]]-[ω-2',5'-dicloro
fenoxi]-acetofenona,
5 [2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi]-acetal
dehído,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',4'-diclorofenoxi)]-propan
-2-ona,
[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-fenoxi]-butan-3-ona,
[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(4'-clorofenoxi)]-butan-3-ona,
10 [2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(4'-fluorfenoxi)]-butan-3-ona,
[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi)]-butan-
-3-ona,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',4'-diclorofenoxi)]-3-me
til-butan-2-ona,
15 [2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(4'-clorofenoxi)]-4-metil-pen
tan-3-ona,
[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi)]-4-me
til-pentan-3-ona,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(4'-clorofenoxi)]-3,3-dimetil
20 -butan-2-ona,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',4'-diclorofenoxi)]-3,3-
-dimetil-butan-2-ona,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',5'-diclorofenoxi)]-3,3-
dimetil-butan-2-ona,
25 [1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',6'-diclorofenoxi)]-3,3-
-dimetil-butan-2-ona,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',4',6'-triclorofenoxi)]-
-3,3-dimetil-butan-2-ona,
[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2'-clorofenoxi)]-3,3-dimetil
30 -butan-2-ona,



- 5 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-bromofenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-fluorfenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
10 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-metilfenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-metoxifenoxi})\right]-3,3\text{-dime-til-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-ter-butilfenoxi})\right]-3,3\text{-di-metil-butan-2-ona,$
15 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-isopropilfenoxi})\right]-3,3\text{-di-metil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(2'\text{-metil-4'\text{-clorofenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
20 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-trifluormetilfenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-nitrofenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(2'\text{-nitrofenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
25 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-fluordicloromstilmercapto-fenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(4'\text{-clorometilsulfonil-feno-xi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(p\text{-difenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
 $\left[1-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[1-(o\text{-difenoxi})\right]-3,3\text{-dimetil-butan-2-ona,$
30 $\left[2-(1,2,4\text{-triazolil-1}')\right]-\left[2\text{-fenoxi}\right]-4\text{-dimetil-pentan-3-ona,$



[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(4-fluorfenoxi)]-4-dimetil-
-pentan-3-ona,

[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi)]-4-dime
til-pentan-3-ona,

5 [1-fenil]-[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-fenoxi]-3,3-dime
til-butan-2-ona,

[1-fenil]-[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(4'-fluorfenoxi)]-
-3,3-dimetil-butan-2-ona,

10 [1-fenil]-[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',4'-diclorofeno
xi)]-3,3-dimetil-butan-2-ona,

[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi)]-1-ciclo
hexil-etan-1-ona,

[2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi)]-1-ciclo
pentil-etan-1-ona,

15 [2-(1,2,4-triazolil-1')]]-[2-(2',4'-diclorofenoxi)]-3-ci
clohexil-propan-2-ona.

Como sustancias particularmente eficaces sean men-
cionadas:

20 [1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(4'-clorofenoxi)]-3,3-dimetil
-butan-2-ona y su hidrocioruro, así como

[1-(1,2,4-triazolil-1')]]-[1-(2',4'-diclorofenoxi)]-3,3-di
metil-butan-2-ona y su hidrocioruro.

25 Las sustancias activas según el invento muestran
un fuerte efecto fungitóxico. No perjudican las plantas cul-
tivadas en las concentraciones necesarias para combatir hon-
gos y tienen una baja toxicidad para animales de sangre ca-
liente. Por estas razones son apreciadas para su aplicación
como agentes protectores de plantas al objeto de combatir
hongos. Agentes fungitóxicos en la tarea de protección de
30 plantas son aplicados para combatir arquimicetos, ficomic-



tos, ascomicetos, basidiomicetos y hongos imperfectos.

Las sustancias activas según el invento tienen un espectro de acción muy amplio y pueden ser aplicadas contra hongos parasitarios que atacan las partes de planta crecientes encima del suelo ó que atacan las plantas desde el suelo, así como contra agentes patógenos transferibles por las semillas.

Desarrollan una eficacia particularmente buena contra hongos parasitarios sobre partes de planta crecientes encima del suelo, tales como especies de *Phytophthora*, de *Erysiphe*, de *Peronospora* y de *Venturia*; además, contra especies de *Piricularia* y de *Pellicularia*, por ejemplo contra el agente provocador del añublo de manzanos (*Podosphaera Leucotricha*), de la costra de manzanos (*Fusicladium dentriticum*) y del tizón del trigo (*Tilletia tritici*). Ha de hacerse resaltar particularmente el hecho de que las sustancias activas según el invento no sólo desarrollan un efecto protector, sino que son eficaces también curativamente, vale decir, en la aplicación después de la contaminación con los esporos del hongo. Además, ha de llamarse la atención sobre el efecto sistemático de las sustancias. Así se logra proteger las plantas contra el ataque por hongos, si se suministra la sustancia activa por vía del suelo y de las raíces a las partes de planta crecientes encima del suelo. Como agentes protectores de plantas, las sustancias según el invento pueden ser utilizadas para el tratamiento del suelo, para la desinfección de semillas y para el tratamiento de las partes de planta crecientes encima del suelo.

Las sustancias según el invento son bien tolerables por plantas. Tienen tan sólo una baja toxicidad para anima-



les de sangre caliente y en virtud de escaso olor y de su buena tolerabilidad por la piel humana no son desagradables de manejar.

5 Las sustancias activas según el invento pueden ser elaboradas en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. Estas formulaciones son producidas en forma conocida, por ejemplo por mezclamiento de las sustancias activas con diluyentes, vale decir, disolventes líquidos, gases licuados pue-
10 tos bajo presión y/ó sustancias sólidas de vehículo, eventualmente con el empleo de agentes tensioactivos, vale decir, emulsivos y/ó agentes dispersantes. En el caso de la utilización del agua como diluyente, pueden emplearse por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.
15 Entran en consideración esencialmente, como disolventes líquidos: hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno, benceno ó alquilnaftalinas, hidrocarburos aromáticos clorados ó hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetileno ó cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano; parafinas, por ejemplo frac-
20 ciones de aceite mineral; alcoholes, tales como butanol ó glicol, así como sus éteres y ésteres; cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona ó ciclohexanona; disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua; bajo diluyentes
25 ó agentes de vehículo gaseosos licuados se entienden tales líquidos que a la temperatura normal y bajo presión normal son líquidos, por ejemplo, gases impeledores de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, por ejemplo freón, en-
30 tran en consideración como sustancias sólidas de vehículo;



5 minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulguita, montmorrillonita ó tierra de diatomeas; polvos minerales sintéticos, tales como ácido silícico áltamente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como emulsivos: emulsivos no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácidos grasos, éteres de polioxietileno y ácidos grasos, por ejemplo éteres alquil arilpoliglicólicos, sulfonatos alquílicos, sulfatos alquílicos y sulfonatos arílicos; como agentes dispersantes: por 10 ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfito, metilcelulosa.

15 Las sustancias activas según el invento pueden estar presentes en las formulaciones en mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, agentes protectores contra la destrucción por aves y pájaros, agentes de crecimiento, productos nutritivos para plantas y agentes mejoradores de la estructura del suelo.

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

25 Las sustancias activas pueden ser aplicadas como tales, en forma de sus formulaciones ó de las formas de aplicación preparadas de las últimas por dilución ulterior, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados en estados listos para el uso. La aplicación es efectuada en forma usual, por ejemplo por riego, rociada, pulverización, espolvoreo, desinfección en seco, desinfección por humedecimiento, mojamiento ó suspensión, ó in 30 crustación.



En la aplicación como fungicidas para el tratamiento de las hojas de plantas, las concentraciones de las sustancias activas en las formas de aplicación pueden variar dentro de un margen amplio. Por lo general, están entre 0,1 y 0,00001 %, preferiblemente entre 0,05 y 0,00001 % en peso.

En la desinfección de semillas se requieren generalmente cantidades de sustancia activa de 0,01 a 50 g. preferiblemente 0,01 a 5 g. por kilogramo de semillas.

Para el tratamiento del suelo, son necesarias cantidades de sustancia activa de 1 a 1.000 g. por metro cúbico de tierra, preferiblemente de 10 a 200 g. por m³.

Las múltiples posibilidades de aplicación surgen de los siguientes ejemplos:

Ejemplo A

Ensayo con Erysiphe.

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona.

Emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilarilpoliglicólico.

Agua: 95 partes en peso.

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

La preparación líquida es rociada sobre plantas jóvenes de pepino con aproximadamente tres hojas desarrolladas, hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Para su secamiento, las plantas de pepino permanecen en un invernáculo durante 24 horas. Entonces, para su inoculación, sobre las plantas se espolvorean conidias del hongo Erysiphe cichorea-



cearum. Subsiguientemente se guardan las plantas en el invernáculo a 23 - 24° C. y a una humedad relativa del aire de aproximadamente 75 %.

5 Al cabo de 12 días, se determina en las plantas de pepino el ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas, 0 % significa ningún ataque, 100 % significa que el ataque es exactamente igual a aquél en las plantas testigos.

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

Tabla A

Ensayo con Erysiphe

Sustancia activa	ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de sustancia activa de	
15	0,00019 %	0,00009 %

conocido:

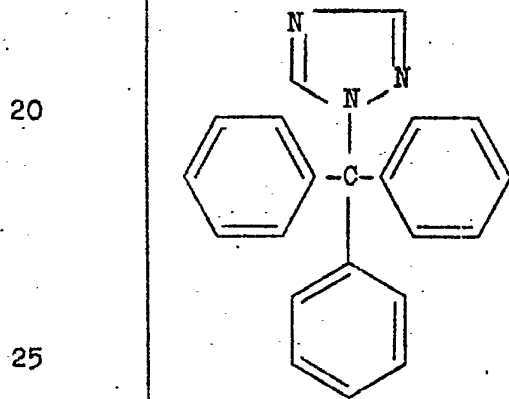




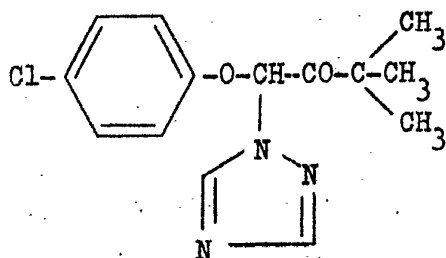
Tabla A (continuación)

Sustancia activa	ataque en % de aquél en las plantas testigos no tratadas a una concentración de sustancia activa de	
	0,00019 %	0,00009 %

5

según la invención:

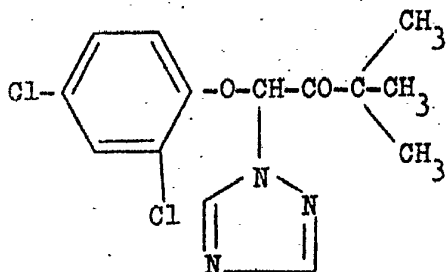
10



19

25

15



16

37

20

Ejemplo B

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

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,

25

emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilarilpoliglicólico,

agua: 95 partes en peso.

Se mezcla la cantidad de sustancia activa necesaria para la deseada concentración de la sustancia activa en el líquido de rociada, con la cantidad indicada del disolvente y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de

30



agua que contiene el aditivo mencionado.

5

La preparación líquida es rociada sobre manzanos jóvenes nacidos de semillas que se encuentran en el estado de desarrollo de 4 a 6 hojas, hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Las plantas permanecen en un invernáculo durante 24 horas a 20° C. y a una humedad relativa del aire de 70 %. Subsiguientemente son inoculadas por espolvoreo con conidias del agente provocador del añublo del manzano (Podospaera leucotricha Salm.) y son colocadas en un invernáculo de una temperatura de 21 a 23° C. y de una humedad relativa del aire de aproximadamente 70 %.

10

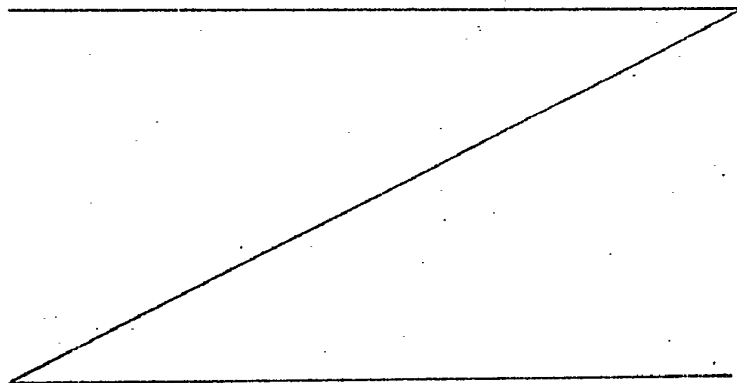
15

Al cabo de 10 días a contar de la inoculación, se determina el ataque en los manzanos nacidos de semillas, en % del ataque en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas.

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

20

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





Ejemplo C

Ensayo con *Fusicladium* (costra de manzanos) / efecto protectivo.

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,
5 emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilarilpoliglicólico,
agua: 95 partes en peso.

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

La preparación líquida es rociada sobre manzanos jóvenes nacidos de semillas que se encuentran en su estado de desarrollo de 4 a 6 hojas, hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Las plantas permanecen durante 14 horas en un invernáculo a 20° C. y a una humedad relativa del aire de 70 %. Subsiguientemente son inoculadas con una suspensión acuosa de conidias del hongo provocador de la costra de manzano (*Fusicladium dentriticum* Fuck.) y son sometidas a la incubación durante 18 horas en una cámara húmeda a 18 - 20° C. y a una humedad relativa de aire de 100 %.

Las plantas vuelven a ser colocadas en el invernáculo por 14 días.

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

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



Las sustancias activas, sus concentraciones y los resultados se encuentran indicados en la siguiente Tabla

Tabla C

5

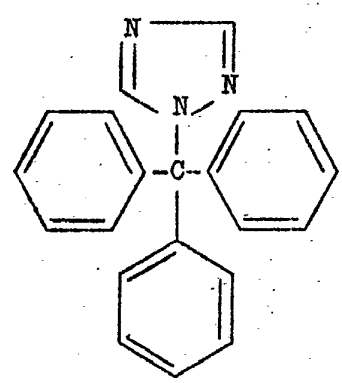
Ensayo con *Fusicladium* / efecto protectorio

Sustancia activa	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas a una concentración de sustancia activa de	
	0,025 %	0,00156 %

10

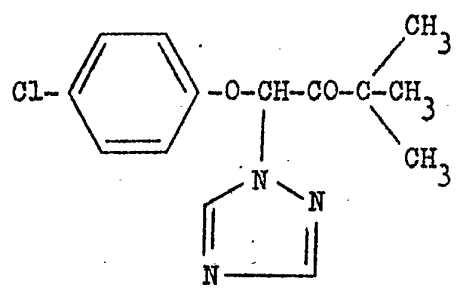
conocido:

15



97

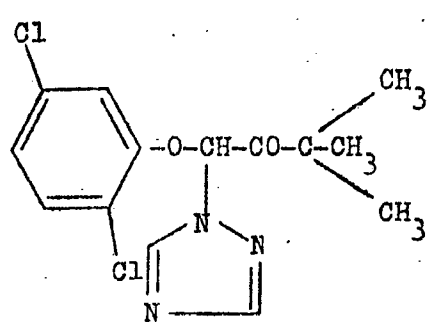
20



2

26

25



43

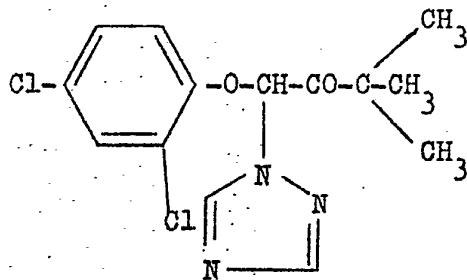
30



Tabla C (continuación)

Sustancia activa	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas a una concentración de sustancia activa de	
	0,025 %	0,00156 %

5



0

11

10

Ejemplo D

15

Ensayo con *Fusicladium* (costra de manzanos) / efecto curativo
Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,
emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilarilpoliglicólico,
agua: 95 partes en peso.

20

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

25

Manzanos jóvenes nacidos de semillas que se encuentran en el estado de desarrollo de 4 a 6 hojas, son inoculados con una suspensión acuosa de conidias del hongo provocador de la costra de manzano (*Fusicladium dendriticum* Fuck.) y son sometidos a la incubación 18 horas en una cámara húmeda a 18 - 20° C. y a una humedad relativa del aire de 100 %.

30

Subsiguientemente se colocan las plantas en un invernáculo y



se las dejan secar.

Al cabo de un tiempo adecuado de espera, sobre las plantas se rocía el líquido de rociada que fue preparado en la forma arriba indicada, hasta su mojadura al grado de formación de gotas. Subsiguientemente vuelven a colocarse las plantas en el invernáculo.

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

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

Las sustancias activas, sus concentraciones, el tiempo de espera entre inoculación y rociada y los resultados se encuentran indicados en la siguiente tabla.

Tabla D

Ensayo con Fusicladium / efecto curativo

Sustancia activa	tiempo de espera en horas	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, a una concentración de sustancia activa de 0,025 %
------------------	---------------------------	--

conocido:

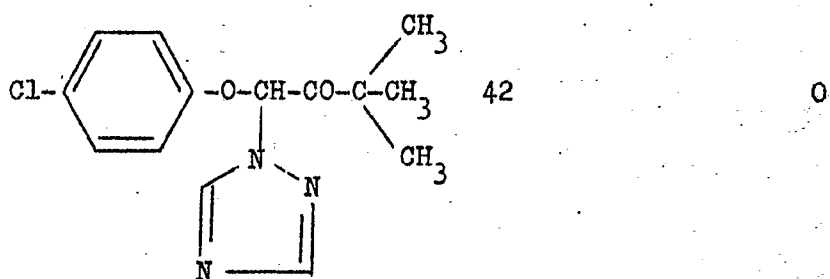
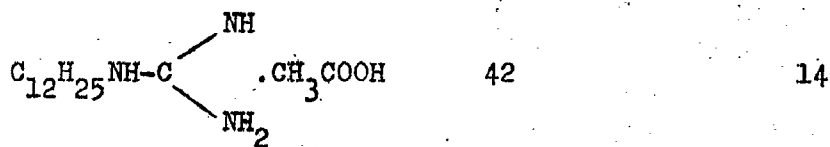
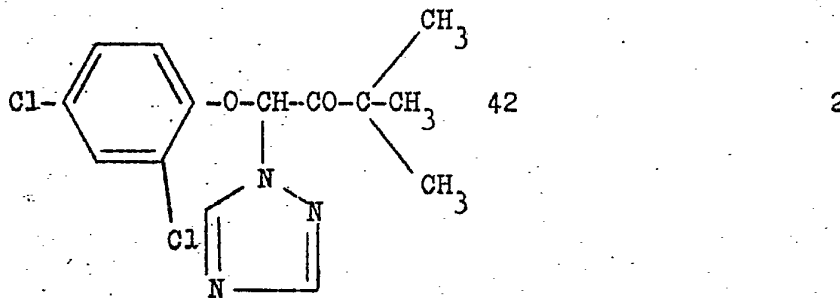




Tabla D (continuación)

Sustancia activa	tiempo de espera en horas	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, a una concentración de sustancia activa de 0,025 %
------------------	---------------------------	--

5



10

Ejemplo E

15

Ensayo con Erysiphe / efecto sistemático

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilarilpoliglicólico,

agua: 95 partes en peso.

20

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

25

Plantas de pepino cultivadas en tierra normalizada, en su estado de desarrollo de una a dos hojas, dentro de una semana, son regadas con 20 cm³ del líquido de riego de la concentración de sustancia activa indicada, calculada sobre 100 cm³ de tierra.

30

Las plantas así tratadas, después del tratamiento, son inoculadas con conidias del hongo Erysiphe cichoracearum.



Subsiguientemente, las plantas son guardadas en un invernáculo a 23 - 24° C. y a una humedad relativa del aire de 70 %.

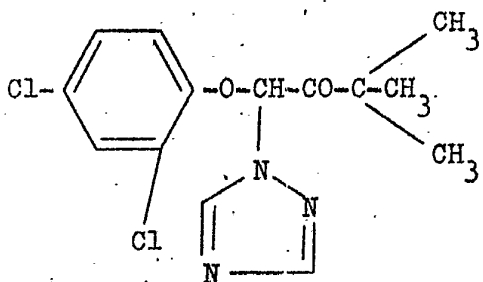
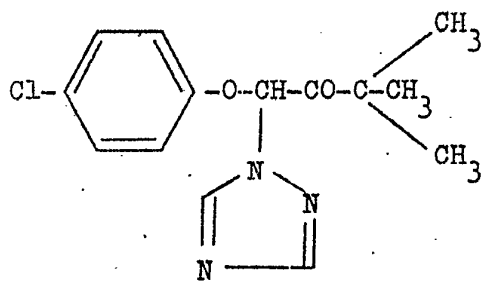
Al cabo de 12 días, se determina el ataque en las plantas de pepino en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas. 0 % significa ningún ataque; 100 % significa que el ataque es exactamente igual a aquel en las plantas testigos.

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

Tabla E

Ensayo con Erysiphe / efecto sistemático

Sustancia activa	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, a una concentración de sustancia activa de	
	30 ppm	15 ppm





Ejemplo F

Ensayo con Fusicladium / efecto sistemático.

Disolvente: 4,7 partes en peso de acetona,

emulsivo: 0,3 partes en peso de éter alquilarilpoliglicólico,

5 agua: 95 partes en peso.

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

10

Manzanos nacidos de semillas del estado de desarrollo de 3 a 4 hojas, cultivados en tierra normalizada, son regados dentro de una semana una vez con 20 cm³ del líquido de riego de la indicada concentración de sustancia activa, calculada sobre 100 cm³ de tierra.

15

Las plantas así tratadas, después del tratamiento, son inoculadas con una suspensión acuosa de conidias de Fusicladium dentriticum Fuck. y son sometidas a la incubación durante 18 horas en una cámara húmeda a 18 - 20° C. y a una humedad relativa del aire de 100 %. Entonces las plantas vuelven a ser colocadas en el invernáculo por 14 días.

20

Al cabo de 15 días a contar de la inoculación, se determina el ataque en los manzanos nacidos de semillas en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, pero también inoculadas. 0 % significa ningún ataque; 100 % significa que el ataque es exactamente igual a aquel en las plantas testigos.

25

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



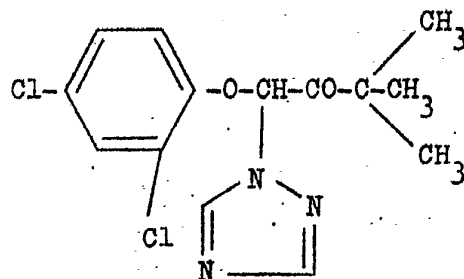
Tabla F

Ensayo con Fusicladium / efecto sistemático

ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, a una concentración de sustancia activa de 30 ppm

Sustancia activa

5



10

4

Ejemplo G

15

Ensayo con Pellicularia.

Disolvente: 1,9 partes en peso de dimetilformamida,

agente dispersante: 0,1 partes en peso de éter alquilarilpo
liglicólico,

agua: 98 partes en peso.

20

Se mezcla la cantidad de sustancia activa necesaria para la concentración deseada de la sustancia activa en el líquido de rociada, con la cantidad indicada del disolvente y del agente dispersante y se diluye el concentrado con la cantidad indicada de agua.

25

Se rocía el líquido de rociada sobre 30 plantas de arroz de una edad de aproximadamente 3 semanas hasta su moja dura al grado de formación de gotas. Para su secamiento, las plantas permanecen en un invernáculo a una temperatura de 22 - 24° C. y a una humedad relativa del aire de aproximadamente 70 %. Luego se infectan las plantas con un cultivo de Pe-

30



llicularia sasakii, cultivado sobre malta y agar-agar y se las guardan a una temperatura de 28 - 30° C. y a una humedad relativa del aire de 100 %.

5 En las plantas infectadas con Pellicularia sasakii, al cabo de 5 a 8 días, se determina el ataque en la vaina de las hojas en relación con las plantas testigos no tratadas, pero también infectadas. 0 % significa ningún ataque; 100 % significa que el ataque es exactamente igual a aquel en las plantas testigos.

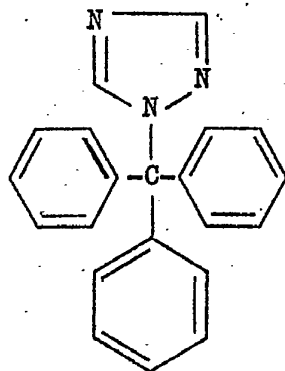
10 Las sustancias activas, sus concentraciones y los resultados se hallan indicados en la siguiente tabla.

Tabla G

Ensayo con Pellicularia

Sustancia activa	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, a una concentración de sustancia activa de
	0,05 %
	0,025 %

conocido:



100

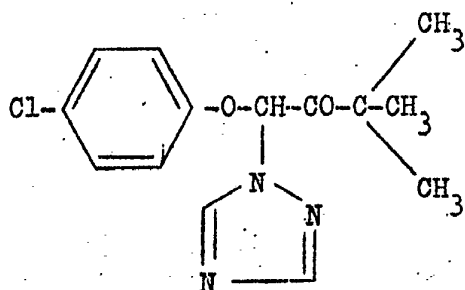
25



Tabla G (continuación)

Sustancia activa	ataque en % de aquel en las plantas testigos no tratadas, a una concentración de sustancia activa de	
	0,05 %	0,025 %

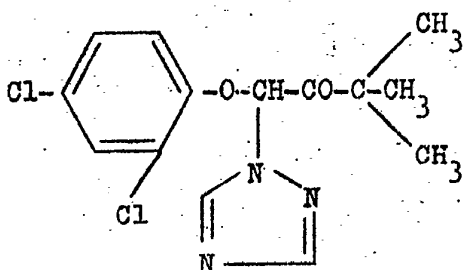
5



0

25

10



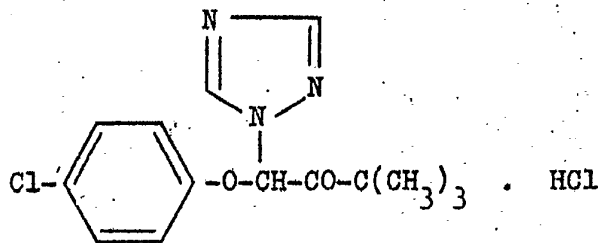
0

50

15

20

Ejemplo 1.



25

17,7 g. (0,05 moles) de 1,1-bis-(4'-clorofenoxi)-
 -3,3-dimetil-butan-2-ona se mezclan íntimamente con 5,9 g.
 (0,055 moles) de hidrocloreuro de 1,2,4-triazol, se calienta

30

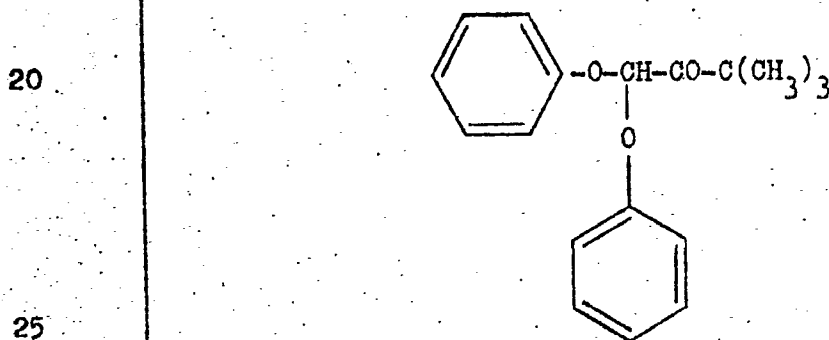


la mezcla durante una hora a 220° C. y se la mantiene a esta temperatura durante 30 minutos, llegando a la ebullición el 4-clorofenol desdoblado.

5 Después del enfriamiento, se agregan 100 ml. de lejía de sosa al 10 % que se cubrieron con una capa de 200 ml. de éter. Se separa la fase etérea, se la lava tres veces cada vez con 30 ml. de lejía de sosa al 5 % y dos veces cada vez con 50 ml. de agua. Después del secamiento sobre sulfato de sodio, se elimina el disolvente por destilación en vacío.
10 Se recoge el residuo aceitoso con 100 ml. de éter anhidro y en esta solución se introducen 0,055 moles de ácido clorhídrico, formándose un precipitado que, después del reposo durante la noche, se aísla por filtración y se lava con éter.

15 Se obtienen 7,3 g. (46 % de la teoría) de hidrocloreuro de 1-[1,2,4-triazolil-(1')] -1-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona, del P.f. = 103 - 105° C.

El producto de partida es preparado de la siguiente manera:



30 6,5 g. (0,2 moles) de hidruro de sodio al 80 % se suspenden en 100 ml. de acetonitrilo anhidro y, a la temperatura ambiente bajo agitación y enfriamiento, se agregan gota



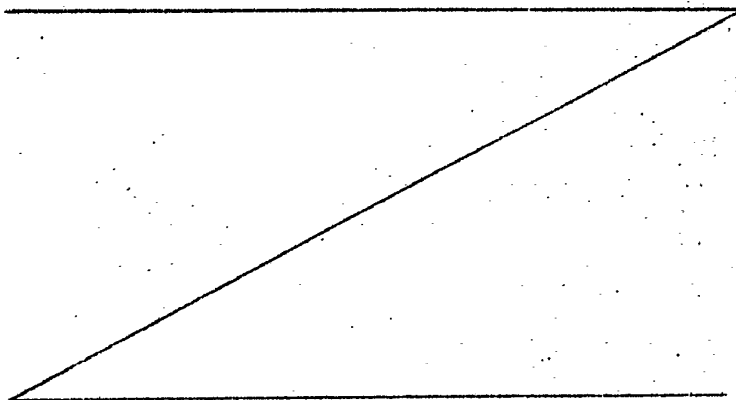
a gota 27 g. (0,21 moles) de 4-clorofenol en 50 ml. de aceto
nitrilo.

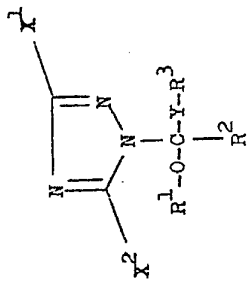
5 Una vez terminado el desarrollo de hidrógeno, se
agregan otros 27 g. (0,105 moles) de 1,1-dibromo-3,3-dimetil
-butan-2-ona (su preparación procedió según Organic Synthe-
sis 10, página 12) bajo agitación y enfriamiento. Subsiguie-
ntemente se calienta lentamente hasta la ebullición y enton-
ces se calentó durante 12 horas a la temperatura de ebulli-
ción con reflujo.

10 Después del enfriamiento, se elimina el disolvente
por destilación en vacío, se somete el residuo a la ebulli-
ción con éster acético caliente, se agrega carbón activo, se
filtra, otra vez se lleva brevemente a la ebullición y se
15 destila la solución primeramente en vacío y, después de la
destilación del disolvente, en alto vacío.

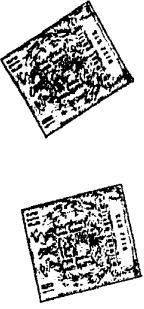
Se obtienen 54 g. (76,5 % de la teoría) de 1,1-bis
-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ona de P.e._{0,1} = 150°
C. El aceite viscoso se solidifica al cabo de cierto tiempo.

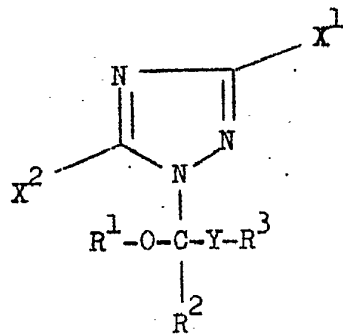
20 Análogamente se preparan los compuestos detallados
en la siguiente Tabla.





Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.f. °C.
2		H		CO	H	H	65 - 70
3		H		CO	H	H	
4		H		CO	H	H	101 - 104
5		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	110



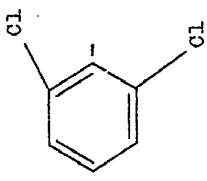
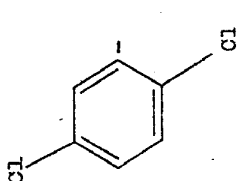
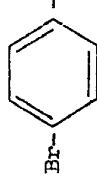
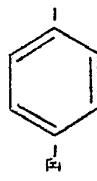
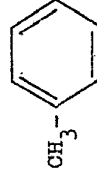


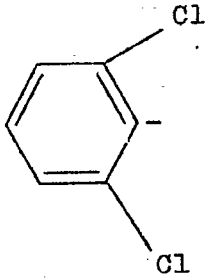
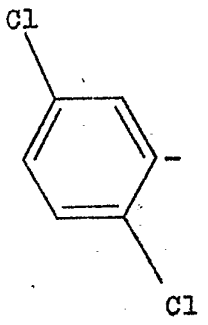
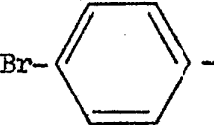
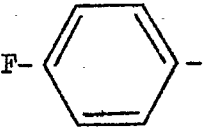
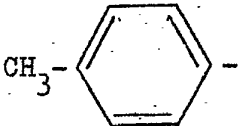
Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X
2		H		CO	H
3		H		CO	H
4		H		CO	H
5		H	C(CH ₃) ₃	CO	H

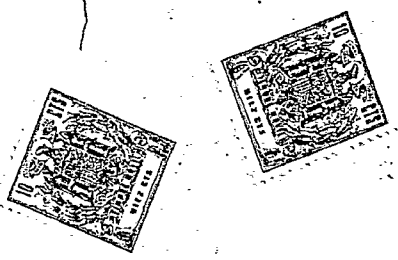


Y	X ¹	X ²	P.f. o C.
CO	H	H	65 - 70
CO	H	H	
CO	H	H	101 - 104
CO	H	H	110



Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.f. °C.
6		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	186
7		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	110
8		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	89 - 92
9		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	P.e. O ₃ = 160°C
10		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	80

Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y
6		H	C(CH ₃) ₃	CO
7		H	C(CH ₃) ₃	CO
8		H	C(CH ₃) ₃	CO
9		H	C(CH ₃) ₃	CO
10		H	C(CH ₃) ₃	CO



Y X¹ X² P.f. 20.

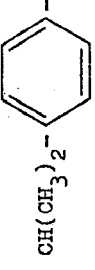
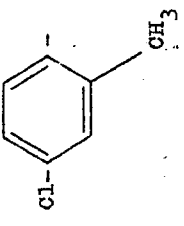
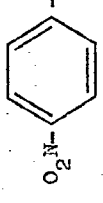
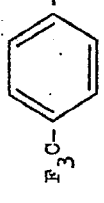
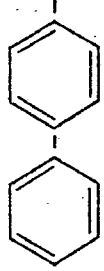
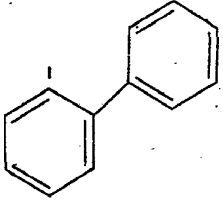
CO H H 186

CO H H 110

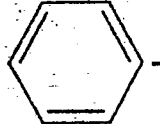
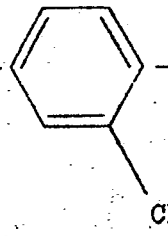
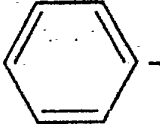

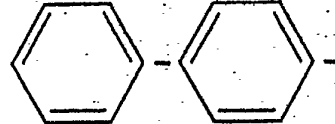
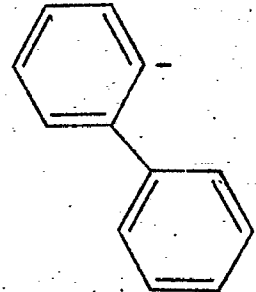
CO H H . 89 - 92

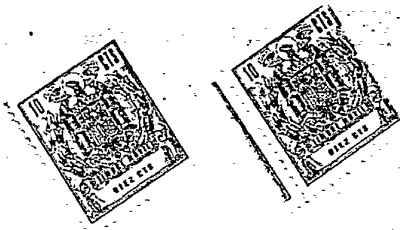
CO H H P.e. 0,3 = 160°C

CO H H 80

Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.F. 90.
11	 CH(CH ₃) ₂	H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	76
12	 Cl	H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	94 - 96
13	 O ₂ N	H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	129
14	 F ₃ C	H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	106
15		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	105 - 106
16		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	70 - 73



Ejemplo No.	R^1	R^2	R^3	Y
11	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ - 	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CO
12		H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CO
13	O_2N - 	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CO
14	F_3C - 	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CO
15		H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CO
16		H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CO



Y X¹ X² P.f. 2C.

CO H H 76

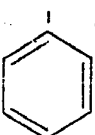
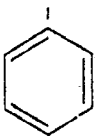
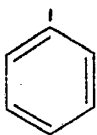
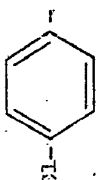
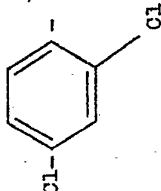
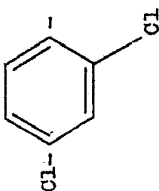
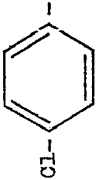
CO H H 94 - 96

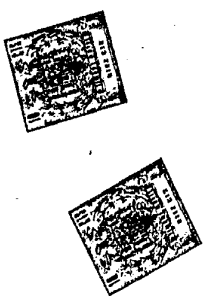
CO H H 129


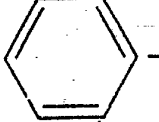
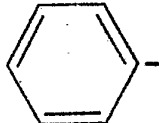
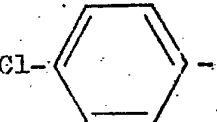
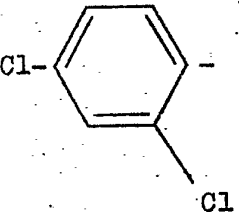
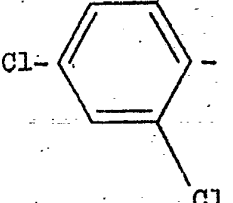
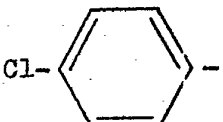
CO H H 106

CO H H 105 - 106

CO H H 70 - 73

Exemplar No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.f. gC.
17			C(CH ₃) ₃	CO	H	H	hidrocloruro 120
18		CH ₃	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	
19		CH ₃	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	
20		H	CH ₃	CO	H	H	125 - 131
21		CH ₃	CH ₃	CO	H	H	
22		CH ₃	CH ₃	CO	H	H	



Examp. No.	R ¹	R ²	R ³	Y
17			$C(CH_3)_3$	CO
18		CH_3	$C(CH_3)_3$	CO
19		CH_3	$C(CH_3)_3$	CO
20		H	CH_3	CO
21		CH_3	CH_3	CO
22		CH_3	CH_3	CO

Y K¹ K² P.f. 2C.



CO H H hidrocioruro
120

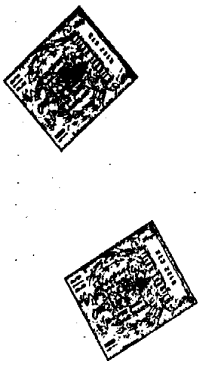
CO H H

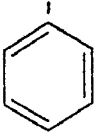
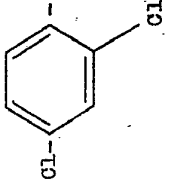
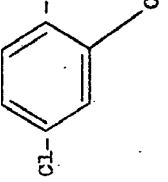

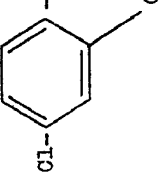
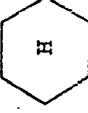
CO H H


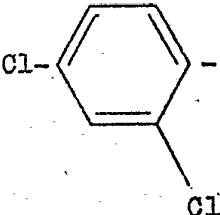
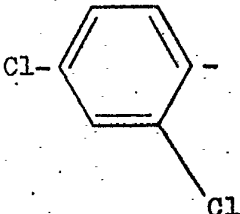
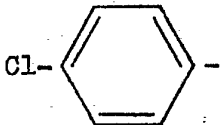
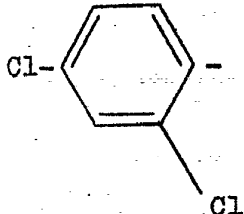

CO H H 125 - 131

CO H H

CO H H



Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.f. °C.
23		CH ₃	CH ₃	CO	H	H	
24		H	CH(CH ₃) ₂	CO	H	H	115
25		CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CO	H	H	
26		CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CO	H	H	
27		H		CO	H	H	98

Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y
23		CH ₃	CH ₃	CO
24		H	CH(CH ₃) ₂	CO
25		CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CO
26		CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CO
27		H		CO



Y X^1 X^2 P.f. 2C.

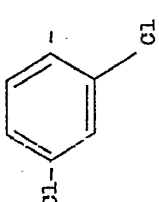

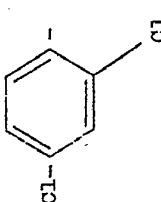
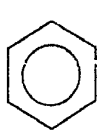

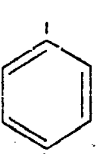
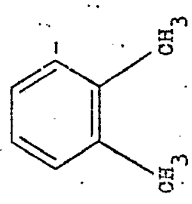
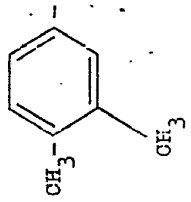
CO H H

CO H H 115

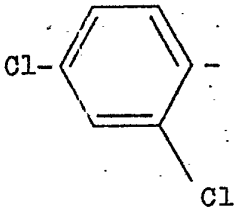
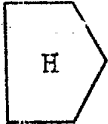
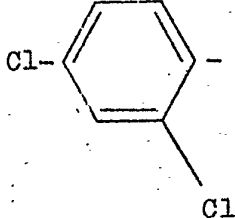



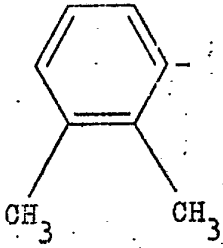
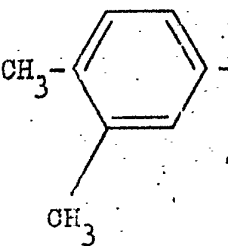
CO H H

CO H H

CO H H 98

Ejempl.o No.	R ¹	R ²	R	CO	H	H	102
28		H		CO	H	H	102
29				CO	H	H	
30		H	$C(CH_3)_3$	CO	H	H	62
31		H	$C(CH_3)_3$	CO	H	H	P.e.o.,1 = 1510C (P.f. 76)
32		H	$C(CH_3)_3$	CO	H	H	P.e.o.,1 = 1450C (P.f. 71)



Ejemplo No.	R^1	R^2	R'	CO
28		H		CO
29				CO
30		H	$C(CH_3)_3$	CO
31		H	$C(CH_3)_3$	CO
32		H	$C(CH_3)_3$	CO



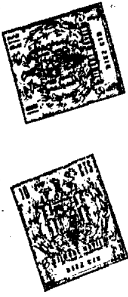
CO H H 102

CO H H

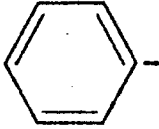
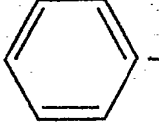
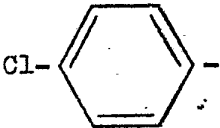
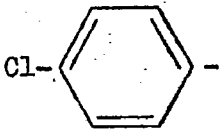
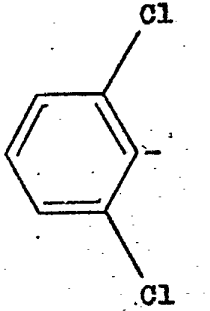
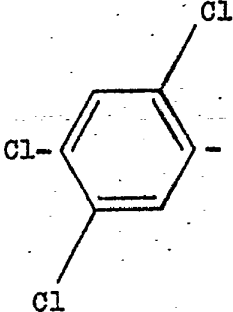
CO H H 62

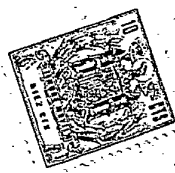
CO H H P.e. 0,1 = 151⁹C
(P.f. 76)

CO H H P.e. 0,1 = 145⁹C
(P.f. 71)



Ejemp.º No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.f. gC.
33			C(CH ₃) ₃	CO	H	H	hidrocloruro 138
34		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	75
35		H	CH ₃	CO	H	H	hidrocloruro 78 - 81
36		H	-	CO	H	H	hidrocloruro 126
37		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	H	142 - 145

Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y
33			$C(CH_3)_3$	CO
34		H	$C(CH_3)_3$	CO
35		H	CH_3	CO
36		H	-	CO
37		H	$C(CH_3)_3$	CO



Y X¹ I² P.f. 9C.

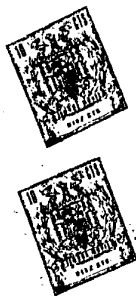
CO H H hidrocioruro
138

CO H H 75

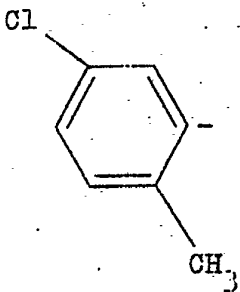
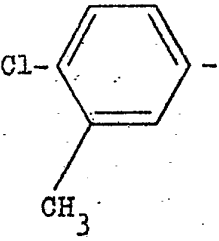
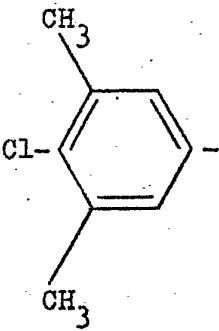
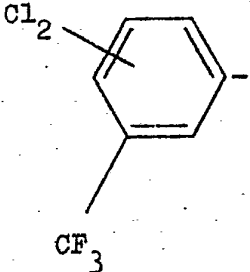
CO H H hidrocioruro
78 - 81

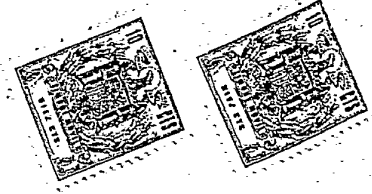
CO H H hidrocioruro
126

CO H H 142 - 145



Examp. No.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	P.f. no.
38		H	C(CH ₃) ₃	H	H	114
39		H	C(CH ₃) ₃	H	H	88 - 89
40		H	C(CH ₃) ₃	H	H	101
41		H	C(CH ₃) ₃	H	H	135 - 138

Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	
38		H	C(CH ₃) ₃	CO
39		H	C(CH ₃) ₃	CO
40		H	C(CH ₃) ₃	CO
41		H	C(CH ₃) ₃	CO



X¹ X² P.f. 20.

CO H H 114

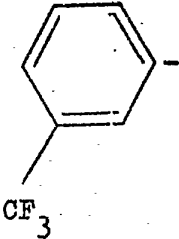
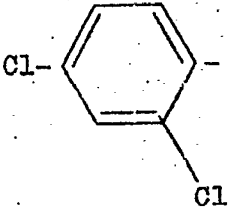
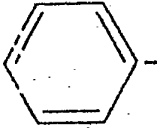
CO H H 88 - 89

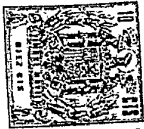
CO H H 101

CO H H 135 - 138



Ejemplo No.	R ¹	R ²	R ³	Y	X ¹	X ²	P.F. °C.
42		H	C(CH ₃) ₃	CO	H	F	74 - 75
43			C(CH ₃) ₃	CO	H	H	hidrocloruro 133 - 138

Ejemplo No.	R^1	R^2	R^3	Y
42		H	$C(CH_3)_3$	CO
43			$C(CH_3)_3$	CO



Y K¹ K² P.F. 90.

CO H E 74 - 75

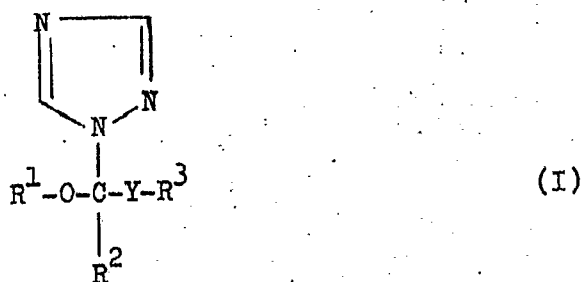
CO H H hidrocloruro
133 - 138



N O T A

5 Descrita suficientemente la naturaleza del invento así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También debe hacerse constar que el invento corresponde a una Solicitud de Patente, presentada en Alemania, con fecha 11 de Enero de 1.972, bajo el número P 22 01 063.5, acogiéndose por lo tanto a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España, sobre: PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE 1,2,4-TRIAZOL; caracterizándose por lo siguiente:

15 1ª.- Procedimiento para la obtención de derivados de 1,2,4-triazol, de fórmula:



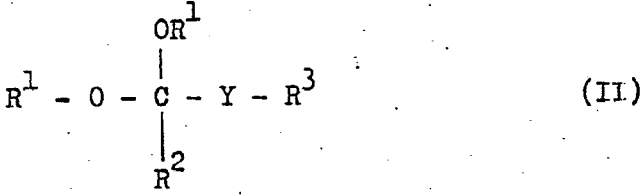
25 en la que R¹ es un radical fenilo que, en caso dado, puede estar sustituido por halógeno, nitro, trifluormetilo, alquilo con hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con hasta 4 átomos de carbono y fenilo; R² es hidrógeno, un radical alquilo con hasta 4 átomos de carbono ó fenilo; R³ es un radical alquilo con hasta 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 5 a 6 átomos

30



de carbono, fenilo ó 4-clorofenilo; e Y es el grupo CO, el grupo $\overset{\text{C}}{\parallel}$ N-OH ó C(OH)₂; así como sus sales; caracterizado por que compuestos de fórmula:

5



10

donde R¹, R², R³ e Y tienen los significados arriba indicados, se hacen reaccionar con hidrocloreuro de 1,2,4-triazol, en caso dado, en presencia de un diluyente y en caso dado en presencia de un catalizador ácido, en la zona de temperaturas entre 80 y 250° C.

15

2ª.- Procedimiento para la obtención de derivados de 1,2,4-triazol, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

20

Esta Memoria consta de 42 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid 30 MAYO 1975

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

L. GÓMEZ ACEDO Y MUÑOZ
 S. Alameda L. García Fernández

