

OFICIO DE INDUSTRIA
DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



(18) ES	(21) NUMERO 444.935	(19) A.1
(22) FECHA DE PRESENTACION 14 MAR. 1977		

PATENTE DE INVENCION

(30) PRIORIDADES:	(32) FECHA	(33) PAIS
(31) NUMERO P 25 04 982.5	6 de febrero de 1975	ALEMANIA
P 25 04 984.7	6 de febrero de 1975	ALEMANIA
P 25 28 917.2	28 de junio de 1975	ALEMANIA
P 25 37 413.4	22 de agosto de 1975	ALEMANIA

(47) FECHA DE PUBLICIDAD	(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL C07C, A01N	(52) PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
--------------------------	--	--

(4) TITULO DE LA INVENCION

PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR ESTERS BENZOILUREIDO-DIFENILICOS.

(71) SOLICITANTE (S)

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

DIRECCION DEL SOLICITANTE

Leverkusen-Bayerwerk, República Federal Alemana

(72) INVENTOR (ES)

(73) TITULAR (ES)

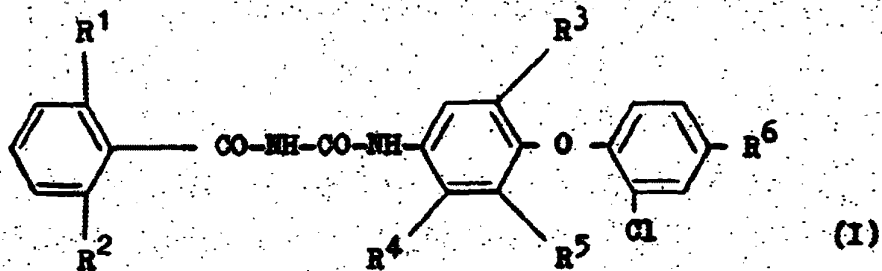
(74) REPRESENTANTE

D. JAIME GOMEZ-ACEBO Y MODET

1 La presente invención se refiere a un procedimiento para la obtención de nuevos éteres benzoyl-ureido-difenílicos insecticidas.

5 Ya es conocido que determinadas benzoylúreas, tales como por ejemplo N-(2,6-diclorobenzoyl)-N'-(4-clorofenil- ó -3,4-diclorofenil)-úrea, tienen propiedades insecticidas (compárese: Patente publicada no examinada de la República Federal Alemana No. 2.123.236).

10 Se ha encontrado que los nuevos éteres benzoylureido-difenílicos de la fórmula



en la cual representan:

18 R¹ fluor, cloro, bromo o metilo,

20 R² hidrógeno, fluor o cloro,

R³ hidrógeno o cloro,

R⁴ hidrógeno o cloro o metilo,

R⁵ hidrógeno o cloro y

22 R⁶ nitro o trifluorometilo,

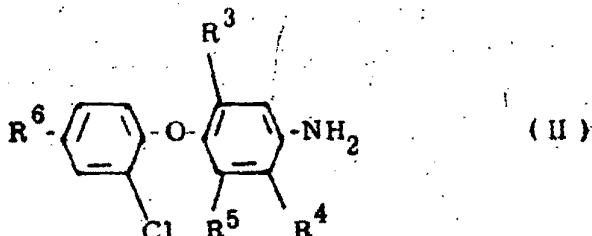
25 tienen fuertes propiedades insecticidas.

Además se ha encontrado que los nuevos éteres benzoylureido-difenílicos de fórmula (I) son obtenidos,

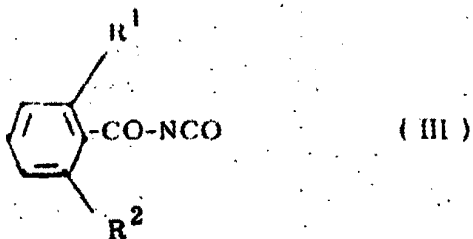


si

(a) fenoxianilinas de la fórmula (II)



se hacen reaccionar con isocianatos de benzoilo de la fórmula (III)

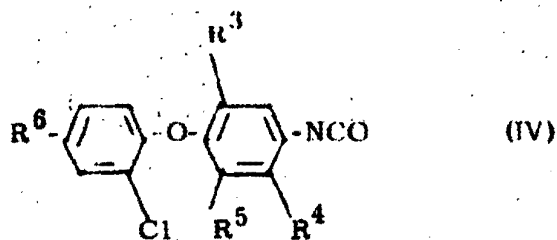


en cuyas fórmulas

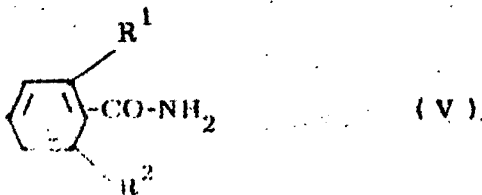
R¹ a R⁶ tienen los significados arriba definidos,

eventualmente en presencia de un disolvente, o

(b) éteres 4-isocianato-difenílicos de la fórmula



se hacen reaccionar con benzamidas de la fórmula





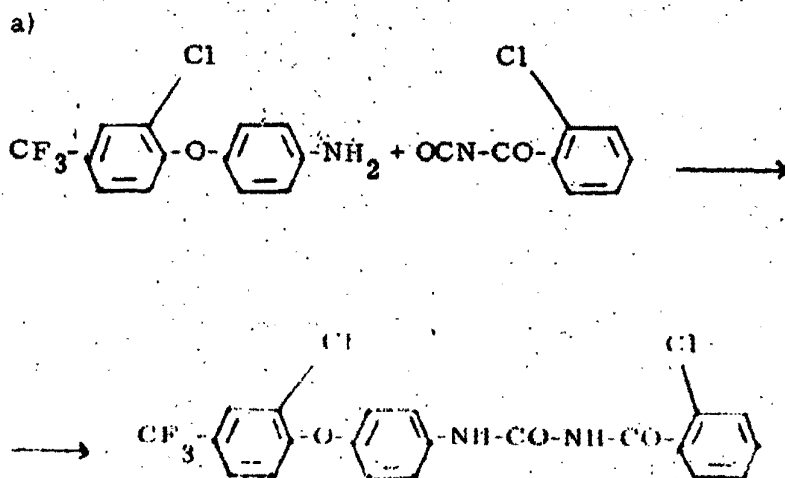
1 en cuyas últimas fórmulas

R¹ a R⁶ tienen los significados arriba definidos,

eventualmente en presencia de un disolvente.

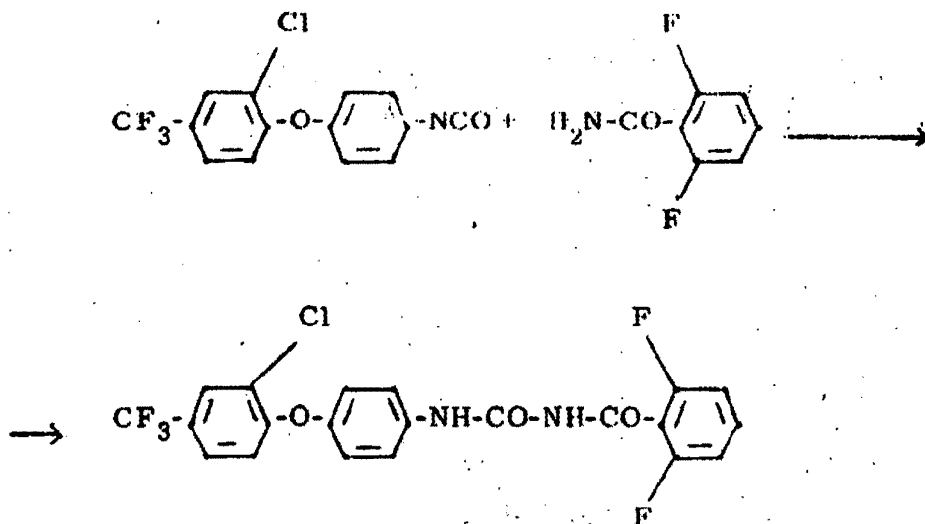
5 Sorprendentemente, los éteres benzoil-
ureido-difenílicos según la invención tienen un efecto insecticida
substancialmente mejor que los compuestos mas parecidos previamente
conocidos del estado de la técnica de una constitución análoga
y de igual orientación de actividad. Por consiguiente, las sustancias
según el invento constituyen un verdadero enriquecimiento de la
10 técnica.

Si, como materiales de partida, se
emplean según el procedimiento (a) 4-(2'-cloro-4'-trifluormetil-
fenoxi)-anilina e isocianato de 2-clorobenzilo y, según el procedi-
miento (b) isocianato de 4-(2'-cloro-4'-trifluormetil-fenoxi)-fenilo
15 y 2,6-difluorbenzamida, el desarrollo de las reacciones puede ser
representado por los siguientes respectivos esquemas de fórmulas:





b)



Las sustancias de partida a emplear están definidas por las fórmulas (II) a (V) en forma general. Los isocianatos de benzoilo (III) a emplear como materiales de partida, son conocidos de la literatura y pueden ser producidos según procedimientos generalmente conocidos [compárese: A. J. Speziale y otros, J. Org. Chem. 30 (12), páginas 4306-4307 (1965)].

La 2,6-difluorbenzamida y las otras benzamidas (V) son conocidas y pueden ser producidas según procedimientos generalmente usuales (compárese: Beilsteins Handbuch der organischen Chemie, Tomo 9, página 336). Las fenoxianilinas (II) pueden ser producidas según procedimientos generalmente usuales, por ejemplo a partir de aminofenolatos de álcali y de 1,2-dicloro-4-trifluormetilbenceno o nitro-compuestos aromáticos halogenados, tales como 1,2-dicloro-4-nitrobenceno, en un disolvente, por ejemplo sulfóxido de dimetilo (compárese también: Jürgen Schramm



1 y otros, Justus Liebigs Annalen der Chemie 1970, 740 169-179).

El grupo amino puede ser transformado según procedimientos general-
mente usuales en el grupo isocianato, por ejemplo por reacción con
fosgeno, con lo cual se obtienen los éteres 4-isocianato-difenílicos
5 de la fórmula general IV.

Como ejemplos de isocianatos de benzoilo
(III) y benzamidas (V) a reaccionar según el invento, en detalle, pueden
mencionarse:

los isocianatos de 2-cloro-, 2-fluor-, 2-bromo-, 2,6-dicloro- y
10 2,6-difluorbenzoilo; además,
las 2-cloro-, 2-fluor-, 2-bromo-, 2,6-dicloro- y 2,6-difluorbenzami-
das.

Como ejemplos de las fenoxianilinas (II)
y de los éteres 4-isocianato-difenílicos (IV) a reaccionar según la
15 invención, en detalle, pueden mencionarse:

3-cloro-4-(2'-cloro-4'-nitro-fenoxi)-anilina,
3,5-dicloro-4-(2'-cloro-4'-nitro-fenoxi)-anilina,
4-(2'-cloro-4'-nitro-fenoxi)-anilina,
además,
20 éter 2,6-dicloro-4-isocianato-2'-cloro-4'-nitro-fenílico,
éter 2-cloro-4-isocianato-2'-cloro-4'-nitro-fenílico,
éter 4-isocianato-2'-cloro-4'-nitro-difenílico.

Son preferidos los éteres benzoureaido-
difenílicos de la fórmula general I, en la cual representan
25 R¹ cloro o fluor,



1 tales como benceno, tolueno, xileno, bencina, cloruro de metileno,
cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno; éteres, por
ejemplo éter dietílico y éter dibutílico, dioxano; además, cetonas,
por ejemplo acetona, metiletil-, metilisopropil- y metilisobutil-
5 cetona; además, nitrilos, tales como acetonitrilo y benzonitrilo.

La temperatura de reacción puede ser
variada dentro de un margen amplio. Por lo general, se trabaja
entre 0 y 120°C, preferiblemente a 70-85°C.

10 La reacción se deja desarrollarse general-
ralmente a la presión normal.

Para la realización del procedimiento, se
aplican los componentes de reacción preferiblemente en relaciones
equimolares. Un exceso de uno u otro de los componentes no aporta
ningunas ventajas esenciales.

15 Los éteres 4-isocianato-difenílicos (IV)
a emplear en la variante de procedimiento (b) arriba mencionada,
pueden ser aplicadas como tales o sin aislamiento intermedio, en
forma de sus mezclas de reacción que son obtenidas de la reacción de
amina y fosgeno. En esta mezcla de reacción en uno de los precita-
20 dos disolventes, se distribuye una benzamida, por ejemplo 2,6-
difluorbenzamida. Se lleva a cabo la reacción bajo las condiciones
deseadas y se aísla el producto precipitante en forma usual por fil-
tración lavado y eventual recristalización.

25 Los compuestos se presentan en forma
cristalina con un punto de fusión agudo.



1 como *Euscelis bilobatus* y *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*),
5 la lagarta peluda (*Lymantria dispar*), la esfinge ano de oro (*Euproctis chrysorrhoea*), 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*),
10 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*).

15 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 =*
20 *Acanthoscelides obtectus*), el dermesto (*dermestes friachi*), el escarabajo de Khapra (*Trogoderma granarium*), el gorgojo pardo rojizo de la harina de arroz o bribollo castaño (*Tribolium castaneum*), el gorgojo del maíz (*Calandra* o *Sitophilus zeamais*), el anobio de pan (*Stegobium*
25



1 paniceum), el tenebrio común (*Tenebrio molitor*) y la carcoma den-
tada 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*);
5 cucarachas, tales como la cucaracha alemana (*Blattella germanica*),
la cucaracha americana (*Periplaneta americana*), la cucaracha de
Madeira (*Leucophaea* o *Rhyparobia madeirae*), la cucaracha negra
de las cocinas (*Blatta orientalis*), la cucaracha gigante (*Blaberus*
giganteus) y la cucaracha gigante negra (*Blaberus fuscus*), así como
10 *Henschoutedenia flexivitta*; además, ortópteros, por ejemplo el grillo
(*Acheta domesticus*); comejenes, tales como los comejenes de tierra
(*Reticulitermes flavipes*) e himenópteros, tales como las hormigas,
la hormiga de la pradera (*Lasius niger*).

Los dípteros comprenden esencialmente
15 las moscas, 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*
20 *calcitrans*); además, mosquitos, por ejemplo cénzalos, tales como el
mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), el mosquito domésti-
co (*Culex pipiens*) y el mosquito de la malaria (*Anopheles stephensi*).

A los ácaros (*Acar*) pertenecen particular-
mente los ácaros hiladores (*Tetranychidae*), tales como el ácaro hi-
25 lador de habichuelas (*Tetranychus telarius* = *Tetranychus althaeae* o



1 tetranychus urticae) y el ácaro hilador de los frutales (Paratetrany-
chus pilosus = Panonychus ulmi), 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 (Hemitarsonem-
5 mus latus) y el ácaro del fresal o de ciclámenes (Tarsonemus palli-
dus); finalmente el arador del cuero (Ornithodoros moubata).

En la aplicación contra insectos nocivos
para la higiene y provisiones, particularmente moscas y mosquitos,
los productos del procedimiento se distinguen, además, por un
10 excelente efecto residual sobre madera y arcilla, así como por una
buena resistencia a álcalis sobre bases encaladas.

Las sustancias activas pueden ser
elaboradas en las formulaciones usuales, tales como soluciones,
emulsiones, polvos arrojables, suspensiones, polvos, preparados
15 de espolvorear, espumas, pastas, polvos solubles, granulados,
aerosoles, concentrados de suspensión-emulsión, polvos desinfect-
tantes de semillas, sustancias naturales y sintéticas impregnadas
con sustancias activas, encapsulaciones finísimas en sustancias
polímeras y en envolturas para semillas; además en formulaciones
20 para dispositivos de fumigación, tales como cartuchos, latas,
espirales y similares de fumigación, así como formulaciones de
nebulización en frío y en caliente de volumen ultrabajo.

Estas formulaciones son producidas en
forma conocida, por ejemplo por mezclamiento de las sustancias
25 activas con diluyentes, vale decir, disolventes líquidos, gases



1 cos, sulfatos alquílicos y sulfonatos arílicos, así como hidrolizados
de albúmina; como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías
de desecho de sulfito y metilcelulosa.

5 Las sustancias activas pueden estar
presentes en las formulaciones en mezcla con otras sustancias
activas conocidas.

 Por lo general, las formulaciones con-
tienen entre 0,1 y 95%, preferiblemente entre 0,5 y 90% en peso de
sustancias activas.

10 Las sustancias activas pueden ser apli-
cadas como tales, en forma de sus formulaciones o como formas de
aplicación preparadas de las últimas. La aplicación es efectuada
en forma usual, por ejemplo rociada, pulverización, nebulización,
espolvoreo, esparcimiento, fumigación, gasificación, riego,
15 desinfección o incrustación.

 En las preparaciones listas para el uso,
las concentraciones de la sustancia activa pueden variar dentro de
límites amplios. Por lo general, están entre 0,0001 y 10%, preferible-
mente entre 0,01 y 1%.

20 Las sustancias activas pueden ser emplea-
das con buen resultado también en el llamado procedimiento de aplica-
ción de volumen ultrabajo, donde es posible aplicar formulaciones de
hasta un 95% de sustancia activa o la sustancia activa sola al 100%.

Ejemplo A

25 Ensayo con Plutella



1 Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida

Emulsivo: 1 parte en peso de éter alquilaril-poliglicólico.

5 Para obtener una preparación adecuada de sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada del disolvente y con la cantidad indi- cada del emulsivo, y se diluye el concentrado con agua hasta la con- centración deseada.

10 La preparación de sustancia activa es rociada sobre hojas de col (*Brassica oleracea*) hasta su mojadura al grado de formación de rocío, y sobre las mismas se colocan orugas del arañuelo de las coles (*Plutella maculipennis*).

15 Al cabo de los tiempos indicados, se determina la destrucción en %, significando 100% que fueron matadas todas las orugas, mientras que 0% significa que no fue matada nin- guna oruga.

Las sustancias activas, sus concentra- ciones, los tiempos de evaluación y los resultados constan en la siguiente tabla:

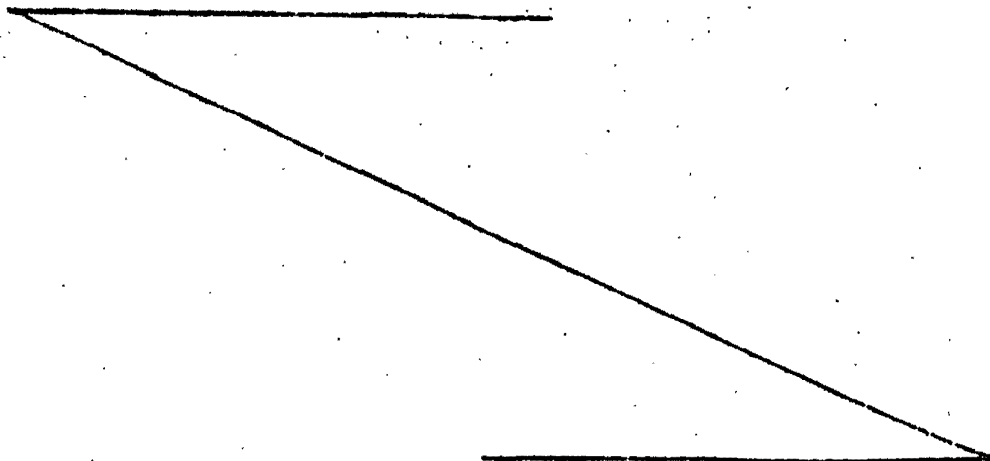
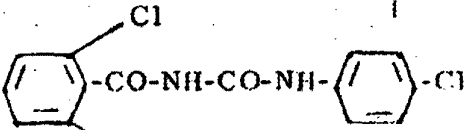
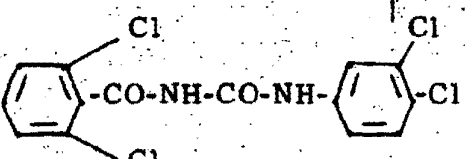
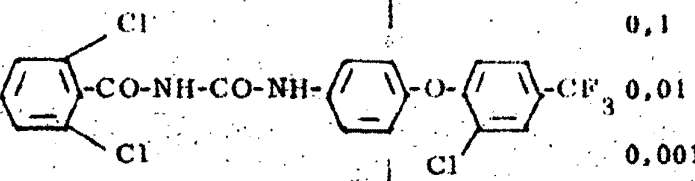
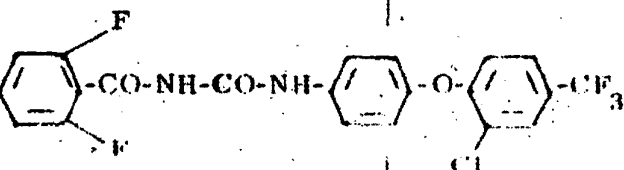
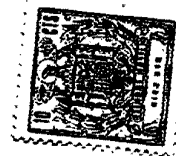




TABLA I
(Insectos nocivos para plantas)

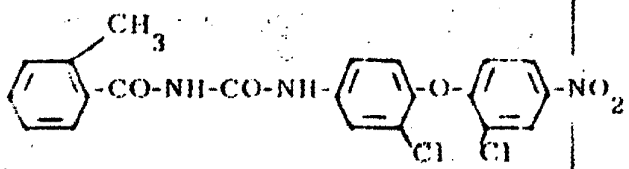
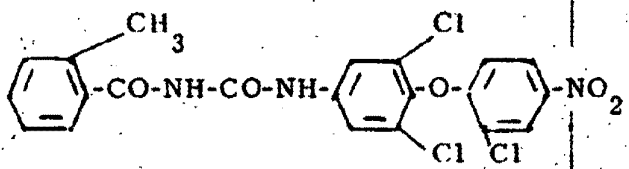
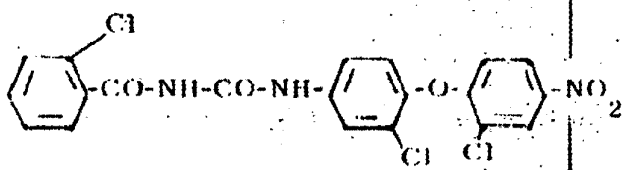
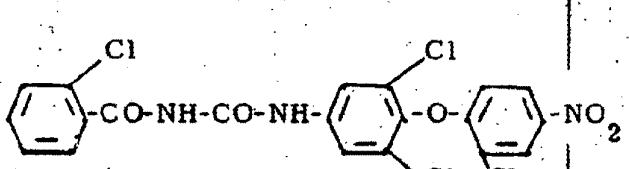
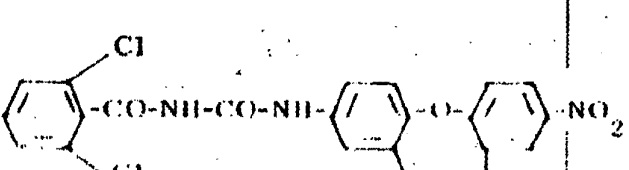
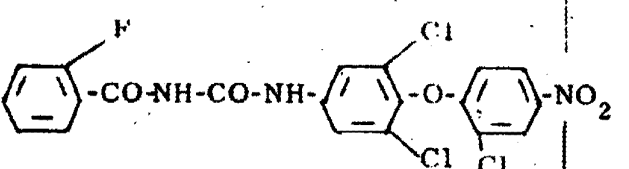
Ensayo con Plutella

Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 8 días
 (conocida)	0,1 0,01	65 0
 (conocida)	0,1 0,01 0,001	100 100 15
	0,1 0,01 0,001	100 100 90
	0,1 0,01 0,001	100 100 95



T A B L A (Continuación)
(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con Plutella

Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 8 días
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>

T A B L A (Continuación)

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Plutella*



Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 8 días
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>



T A B L A (Continuación)
(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Plutella*

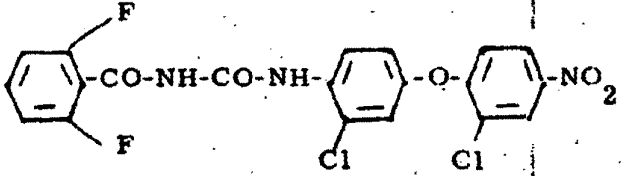
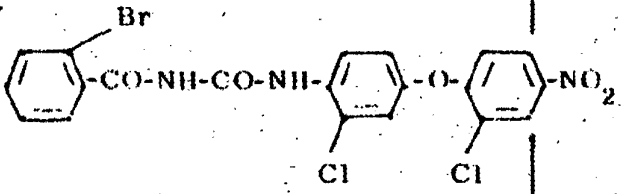
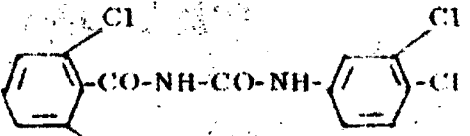
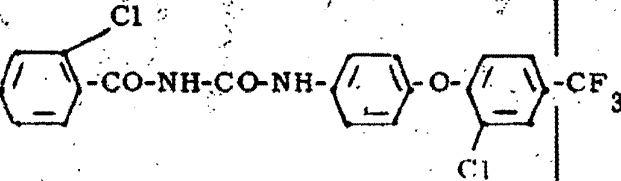
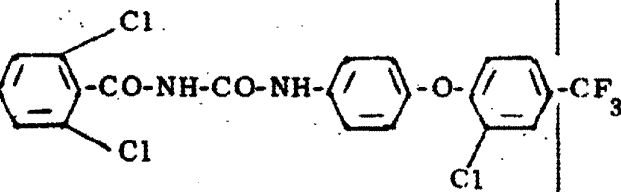
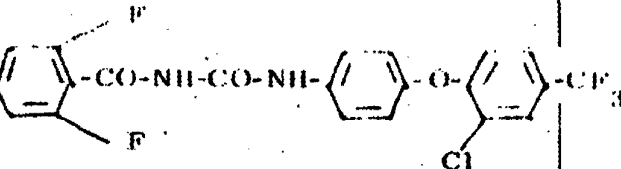
Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 8 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,001	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,001	100



TABLA 2
 (Insectos nocivos para plantas)
 Ensayo con *Laphygma*

Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 8 días
 (conocida)	0,1 0,01 0,001 0,0001 0,00001	100 100 100 50 0
	0,1 0,01 0,001 0,0001 0,00001	100 100 100 100 100
	0,1 0,01 0,001 0,0001 0,00001	100 100 100 80 60
	0,1 0,01 0,001 0,0001 0,00001	100 100 100 100 95



T A B L A 2 (Continuación)

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Laphygma*

Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 8 días
	<p>0,001</p> <p>100</p> <p>0,0001</p> <p>100</p> <p>0,00001</p> <p>70</p>	
	<p>0,001</p> <p>100</p> <p>0,0001</p> <p>100</p> <p>0,00001</p> <p>50</p>	



1 Ejemplo C

Ensayo con larvas de *Phaedon*

Disolvente: 3 parte en peso de dimetilformamida

Emulsivo: 1 parte en peso de éter alquilaril-políglucólico.

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

10 La preparación de sustancia activa es rociada sobre hojas de col (*Brassica oleracea*) hasta su mojadura al grado de formación de gotas y sobre estas hojas se colocan larvas de la crisomela del rábano picante (*Phaedon Cochleariae*).

15 Al cabo de los tiempos indicados, se determina la destrucción en %, significando 100% que fueron matadas todas las larvas de crisomela, mientras que 0% significa que no fue matada ninguna larva de crisomela.

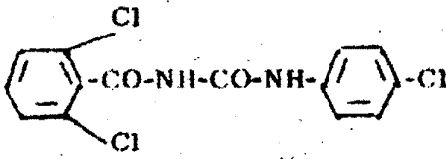
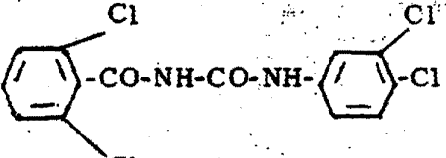
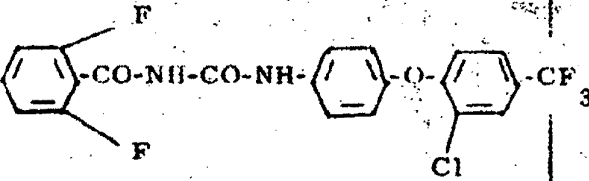
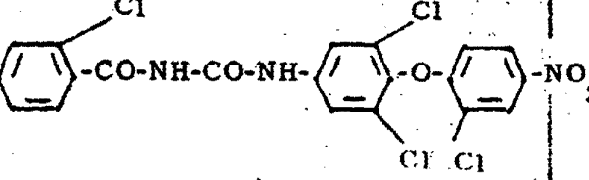
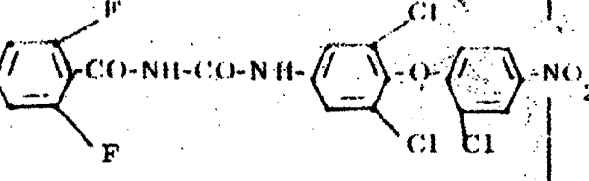
20 Las sustancias activas, sus concentraciones, los tiempos de evaluación y los resultados constan en la siguiente tabla:



TABLA 3

(Insectos nocivos para plantas)

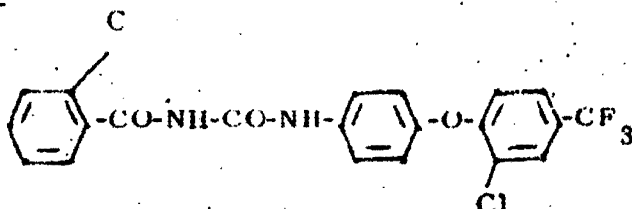
Ensayo con larvas de Phaedon

Substancia activa	Concentración de la substancia activa en %	Grado de destrucción en % al cabo de 3 días
 <p>(conocida)</p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>55</p> <p>0</p>
 <p>(conocida)</p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>15</p> <p>0</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>80</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>50</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p> <p>0,001</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>80</p>



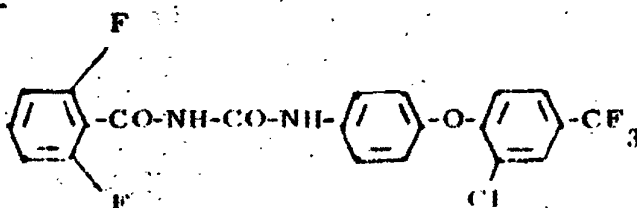
Ejemplos de Preparación

Ejemplo 1



A 5,8 g (0,02 moles) de 4-(2'-cloro-4'-trifluormetilfenoxi)-anilina en 100 cm³ de tolueno se agrega a 80°C gota a gota una solución de 3,7 g (0,02 moles) de isocianato de 2-clorobenzóilo en 20 cm³ de tolueno. Se agita la mezcla durante una hora a 80°C. Después del enfriamiento, se recoge por succión el producto precipitado, se lo lava primeramente con tolueno y luego con éter de petróleo. Después del secamiento, se obtienen 6,6 g (70% de la teoría) de éter 2-cloro-4-trifluormetil-4'-[N-(N'-(o-clorobenzóil))-ureído]-difenílico analíticamente puro del punto de fusión de 182°C.

Ejemplo 2

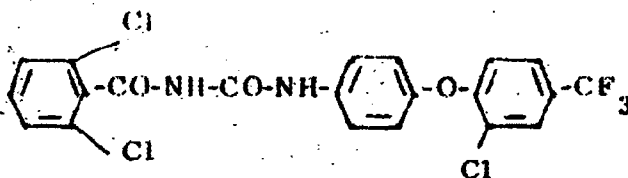


En una solución de 5,8 g (0,02 moles) de 4-(2'-cloro-4'-trifluormetilfenoxi)-anilina en 100 cm³ de tolueno se instala a 80°C una solución de 3,7 g (0,02 moles) de isocianato de 2,6-difluorobenzóilo en 20 cm³ de tolueno. Se agita la mezcla durante una hora a 80°C. Después del enfriamiento de la mezcla de reacción



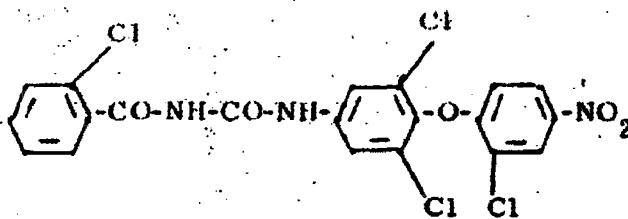
1 hasta 20°C, se recoge por succión la substancia que se precipita,
y se lo lava con tolueno y éter de petróleo. Después del secamiento,
se obtienen 8 g (95 % de la teoría) de éter 2-cloro-4-trifluormetil-
4'-[N-(N'-(2,6-difluorbenzoil))-ureido]-difenílico con el punto de
5 fusión de 187°C.

Ejemplo 3:



10 En la forma de trabajo análoga a la descrip-
ta en los Ejemplos 1 y 2, se obtiene el éter 2-cloro-4-trifluormetil-
4'-[N-(N'-(2,6-diclorobenzoyl))-ureido]-difenílico del punto de
fusión de 177°C con un rendimiento de 86% de la teoría.

Ejemplo 4:

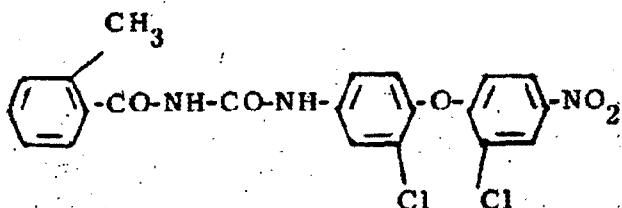


15 En 5 g (0,015 moles) de 3,5-dicloro-4-
(2'-cloro-4'-nitrofenoxi)-anilina en 50 cm³ de tolueno se im-
20 80°C una solución de 2,8 g (0,015 moles) de isocianato de 2-cloro-
benzoilo en 10 cm³ de tolueno. Se agita la mezcla durante una hora
a 80°C. Después del enfriamiento, se recoge por succión el producto
precipitado que se lava primeramente con tolueno y luego con éter
de petróleo. Después del secamiento, se obtienen 6,5 g (84% de la
25



teoría) de éter 2-cloro-4-nitro-2',6'-dicloro-4'-[N-(N'-(o-cloro-
benzoil))-ureido]-difenílico analíticamente puro con el punto de
fusión de 221°C.

Ejemplo 5:



En una solución de 6,0 g (0,02 moles) de
3-cloro-4-(2'-cloro-4'-nitro-fenoxi)-anilina en 80 cm³ de tolueno se
instila a 80°C una solución de 3,25 g (0,02 moles) de isocianato de 2-
metil-benzoilo en 20 cm³ de tolueno. La mezcla es agitada durante 1
hora a 80°C. Después del enfriamiento de la mezcla de reacción hasta
20°C, la substancia que se precipita, es recogida por succión y lavada
con tolueno y éter de petróleo. Después del secamiento, se obtienen
8 g (87% de la teoría) de éter 2-cloro-4-nitro-2'-cloro-4'-[N-(N'-(o-
metilbenzoil))-ureido]-difenílico del punto de fusión de 220°C.

En forma análoga fueron obtenidos los

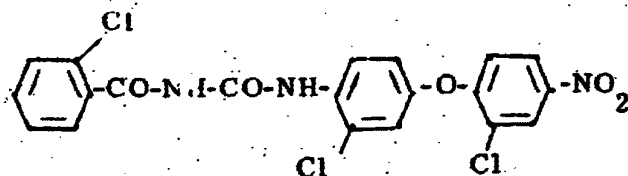
siguientes compuestos:

Ejemplo No. plo No.	Constitución	Rendimiento (% de la teoría)	Datos físicos (punto de fusión °C)
6		94	223

Ejem- plo No.	Constitución	Rendimiento (% de la teoría)	Datos físicos (punto de fusión °C)
7		82	208
8		87	227
9		83	201
10		87	206
11		96	235
12		70	220

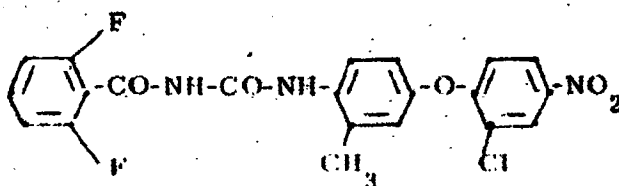


Ejemplo 13



En 6,0 g (0,02 moles) de 4-(2'-cloro-4'-nitro-fenoxi)-2-cloro-anilina en 100 cm³ de tolueno se instila a 30°C una solución de 3,7 g (0,02 moles) de isocianato de 2-clorobenzoilo en 20 cm³ de tolueno. La mezcla es agitada durante 1 hora a 50°C. Después del enfriamiento, el producto precipitado es recogido por succión y lavado primeramente con tolueno y luego con éter de petróleo. Después del secamiento, se obtienen 6,0 g (62% de la teoría) de éter 2,3-dicloro-4-nitro-4'-[N-(N'-(o-cloro-benzoil))-ureido]-difenilico con el punto de fusión de 193°C.

Ejemplo 14



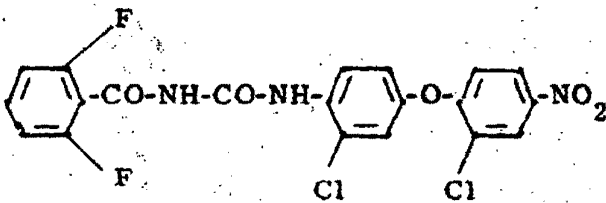
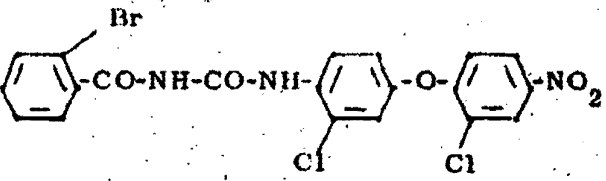
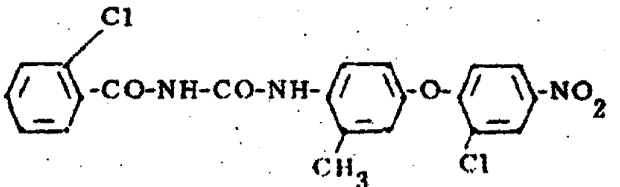
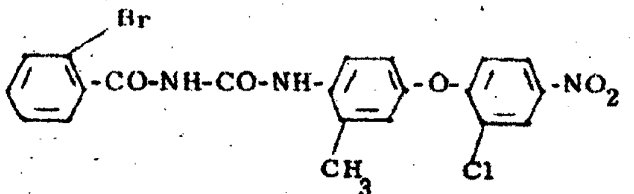
En una solución de 5,6 g (0,02 moles) de 4-(2'-cloro-4'-nitro-fenoxi)-2-metil-anilina en 100 cm³ de tolueno se instila a 50°C una solución de 3,7 g (0,02 moles) de isocianato de 2,6-difluorbenzoilo en 20 cm³ de tolueno. La mezcla es agitada durante 1 hora a 60°C. Después del enfriamiento, hasta 20°C, la substancia que se precipita, es recogida por succión y lavada con tolueno y éter de petróleo. Después del secamiento, se obtienen 7 g (75% de la teoría) de éter 2-cloro-4-nitro-3'-metil-4'-[N-(N'-2,6-difluor-



1 benzoil))-ureído 7-difenílico con el punto de fusión de 190°C.

En una forma de trabajo análoga a la descrita en los Ejemplos 13 y 14, se obtienen los siguientes compuestos:

5

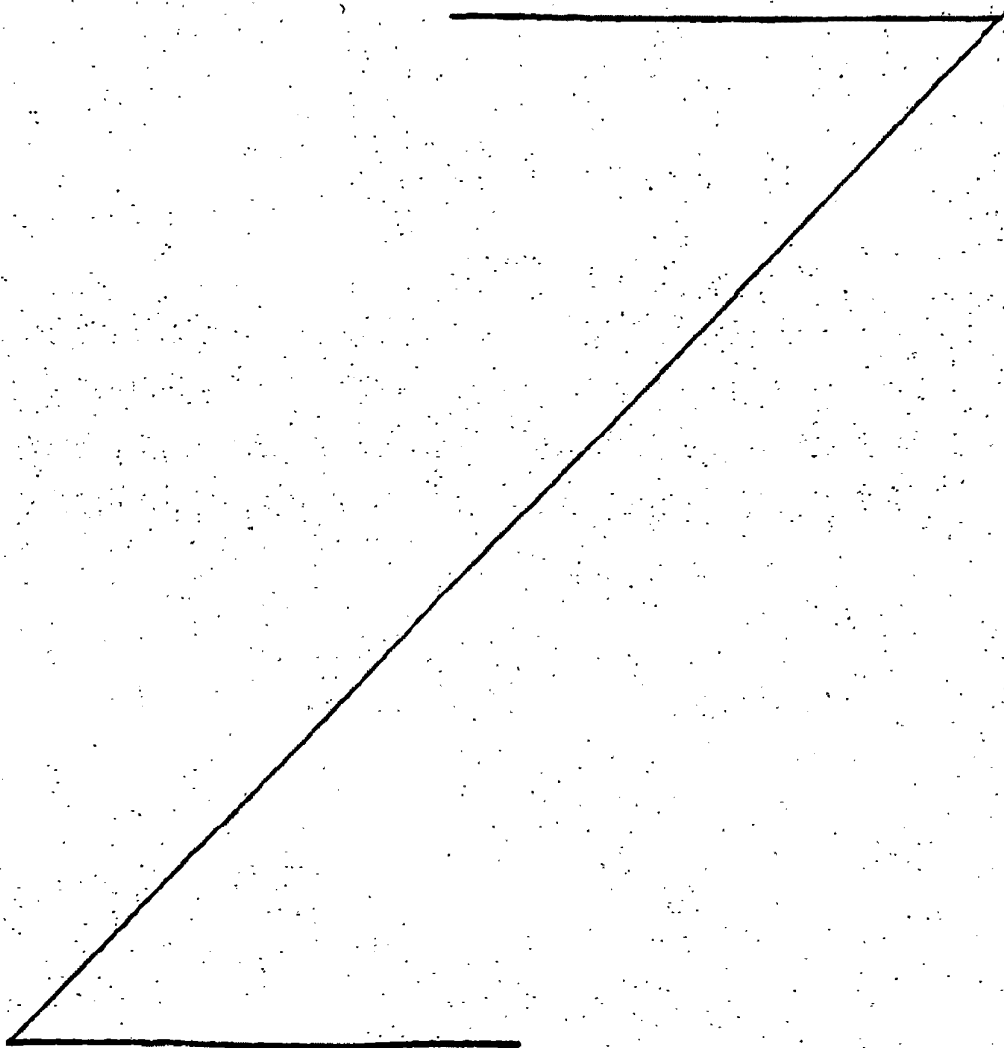
Ejemplo No.	Constitución	Datos físicos (punto de fusión °C)	Rendimiento (% de la teoría)
15		200	83
16		193	82
17		197	65
18		200	86

25

1

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.

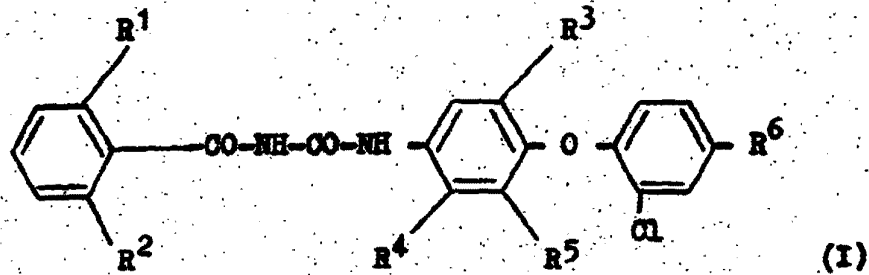
5



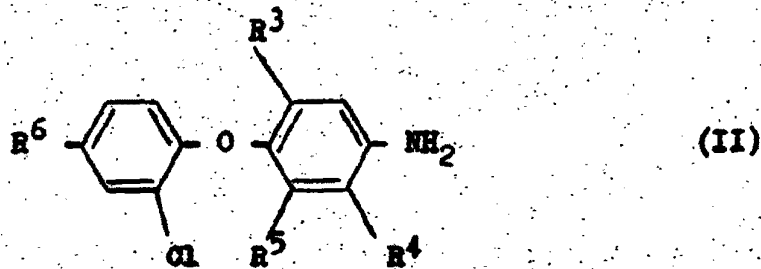
REIVINDICACIONES

1
5
10
15
20
25

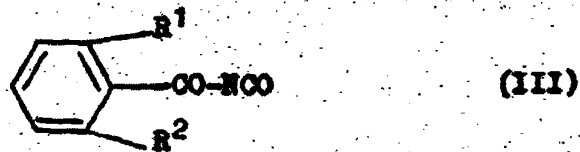
1.- Procedimiento para preparar éteres benzoylureido-difenílicos, de fórmula



en la que R¹ es fluor, cloro, bromo o metilo; R² es hidrógeno, fluor o cloro; R³ es hidrógeno o cloro; R⁴ es hidrógeno o cloro o metilo; R⁵ es hidrógeno o cloro y R⁶ es nitró o trifluormetilo; caracterizado porque se hacen reaccionar fenoxianilinas de fórmula (II)



en la que R³, R⁴, R⁵ y R⁶ se definen como anteriormente, con isocianatos de benzoylo de fórmula (III)



1 en la que R^1 y R^2 tienen los significados arriba defini-
dos, eventualmente en presencia de un disolvente, a tem-
peraturas entre 0 y 120°C, con preferencia entre 70 y 85°C.

5 2º.- Procedimiento para preparar
ésteres benzoilureido-difenílicos, tal y como queda sustan-
cialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 33 hojas,
escritas a máquina por una sola cara.

Madrid 14 MAR. 1977

10 BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

SOMER ACEBO Y MOUET

c. p. Firmado: L. García Fernández



pey