



19 ES	19 21 22	NUMERO 447185 FECHA DE PRESENTACION	10 A1
-------	----------------	--	-------

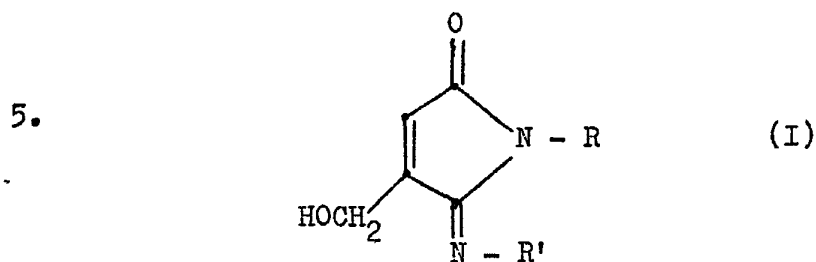
(Case 5-9865/t)

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
5143/75	22 Abril 1975	Suiza
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07D, A01N	
64 TITULO DE LA INVENCION		
"PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE IMINO-PIRROLINONAS"		
71 SOLICITANTE (S)		
CIBA-GEIGY AG		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
BASILEA (Suiza)		
72 INVENTOR (ES)		
Dr. Jean-Marie Adam		
73 TITULAR (ES)		
CIBA-GEIGY AG		
74 REPRESENTANTE		
D. JAIME ISERN CUYAS, Agente Oficial de la Propiedad Industrial		

DESCRIPCIÓN

Este invento se refiere a un procedimiento químicamente peculiar para la preparación de nuevas iminopirrolinonas de la fórmula I



en la que uno de los dos substituyentes

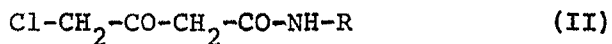
10. R y R' significa un anillo fenílico insustituído o que está substituído por alquilo de C₁-C₄, alcoxilo de C₁-C₄, hidroxialquilo de C₁-C₄, alquilamino de C₁-C₄, (alquilo de C₁-C₄)₂-amino, halógeno, nitro o ciano,

15. mientras el otro de los dos substituyentes

R y R' representa hidrógeno,

así como a los nuevos compuestos de la fórmula I.

20. De acuerdo con el invento, estas iminopirrolinonas se preparan haciendo reaccionar la respectiva cloroacetoacetanilida de la fórmula II

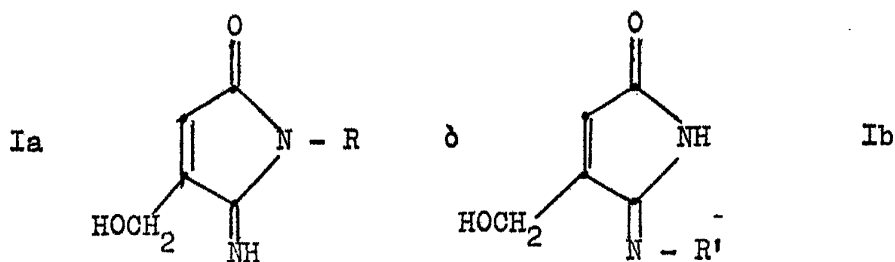


en la que

25. R denota el anillo fenílico definido en la fórmula I,

en presencia de iones de cianuro, preferentemente de cianuro alcalino (como NaCN), en un disolvente y obteniendo así con cierre del anillo uno de los dos productos de las fórmulas

5.



10.

según las condiciones de la reacción. Como se deduce de la secuencia de la reacción, el sustituyente R' es idéntico al sustituyente R de la fórmula II. La diferente designación de R y R' atiende únicamente a la diferente posición del sustituyente fenílico en la

15.

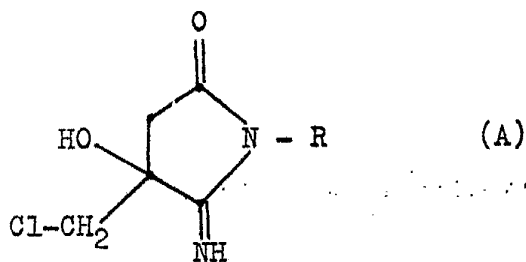
fórmula I.

El nuevo procedimiento se desarrolla en un intervalo de temperatura de 0° a 80° C, pero preferentemente de 0° a 30° C. Según el disolvente que se elija el procedimiento puede orientarse de modo que se formen casi exclusivamente productos de la fórmula Ia o los productos batocrómicamente coloreados de la fórmula Ib. También es posible utilizar mezclas de disolventes y usar para la ciclización ácido cianhídrico libre.

20.

25.

En algunos casos se puede aislar también en cantidades limitadas el producto de la fórmula A



5.

formado intermediariamente.

10.

15.

20.

25.

Para la reacción entran en cuenta los disolventes indiferentes. Para mayor ventaja se emplean disolventes como el agua o los alcoholes (metanol, etanol, isopropanol, glicoles, cellosolve, glicerina, etc.), junto al fenol o el dioxano, así como representantes análogos. La reacción efectuada en agua, por ejemplo, da únicamente derivados de N-fenilimida de la fórmula Ia, los cuales se pueden volver a transponer en parte a derivados de N'-fenilimina Ib por calentamiento en etanol en presencia de iones de cianuro. La reacción en alcohol da directamente derivados de la fórmula Ib. Los iones de cianuro pueden añadirse en cantidades catalíticas o mayores. Las cantidades equimolares han demostrado ser ventajosas. Por grupo alquílico de C₁-C₄, como tal o como parte de otro substituyente, deben entenderse en la fórmula I metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, butilo secundario, isobutilo y butilo terciario. El concepto de "halógeno" comprende flúor, cloro, bromo y yodo.

El compuesto cloroacetoacetanilida, cuerpo fundamental insustituído de la fórmula II, es conocido y se obtiene por cloración de diceteno (por ejemplo, en tetracloruro de carbono) con formación intermediaria de cloruro de ácido cloroacetilacético (Cl-CH₂-CO-CH₂-COCl)

y reacción ulterior inmediata con anilina (J. Am. Chem. Soc. 62, 1147 -1940-). De manera análoga se preparan también los demás compuestos de la fórmula II, en cuyo caso pueden incluirse como agentes aceptores de ácido aminas terciarias. Por el procedimiento de este invento es también posible preparar grupos mayores de compuestos que no entran en el ámbito de la definición de R o R' en la fórmula I.

5.

10.

En los ejemplos de preparación que siguen las temperaturas están expresadas en grados centígrados.

Ejemplo 1

15.

Se agitan a 25° en 150 cc de agua 21,2 g de 4-cloroacetoacetanida y 5,4 g de NaCN, durante 3 horas. Se filtra la mezcla reaccional, se lava el residuo con agua y se le seca. Se obtienen 15,5 g de 2-oxo-4-hidroxi-metil-5-imino- Δ^3 -N-fenilpirrolina, en cristales incoloros. Punto de fusión: 86-88° (de etanol).

20.

$C_{11}H_{10}N_2O_2$	calc.	C	65,34	H	4,98	N	13,85 %
	hall.		65,23		4,93		13,86

Estructura confirmada por la N.M.R. y la espectroscopia roentgenológica.

25.

Ejemplo 2

a) Se agitan a 0-5° en 150 cc de alcohol 21,2 g de 4-cloroacetoacetanilida y 5,4 g de NaCN, durante 72

5. horas. Se filtra la mezcla reaccional, se lava el residuo con un poco de alcohol y agua y se le seca. Se obtienen 3 g de 2-oxo-4-clorometil-4-hidroxi-5-imino-N-fenilpirrolidina, un producto intermedio de la fórmula A, en forma de cristales amarillentos. Punto de fusión: 180° (descomposición).

$C_{11}H_{11}ClN_2O_2$	calc.	C	55,35	H	4,65	Cl	14,85	N	11,74 %
			55,44		4,64		15,13		11,62

10. b) Se concentra hasta la mitad el filtrado alcohólico del Ejemplo 2, se le vierte en 200 cc de agua y se extrae con éter. Después de separar el éter por destilación, se obtienen 13,3 g de 2-oxo-4-hidroximetil-5-fenilimino- Δ^3 -pirrolina (cristalizable de cloroformo; cristales amarillos, fácilmente solubles en alcohol). Punto de fusión: 117-119°.

$C_{11}H_{10}N_2O_2$	calc.	C	65,34	H	4,98	N	13,85	O	15,82 %
	hall.		65,06		5,04		14,09		15,91 %

20. Estructura confirmada por la N.M.R. y la espectroscopia roentgenológica.

Ejemplo 3

25. Se agitan a 0-5° en 150 cc de alcohol 28 g de 3',4'-dicloroanilida de ácido 4-cloroacetoacético, de punto de fusión 86-88°, y 5,4 g de NaCN, durante 72 horas.

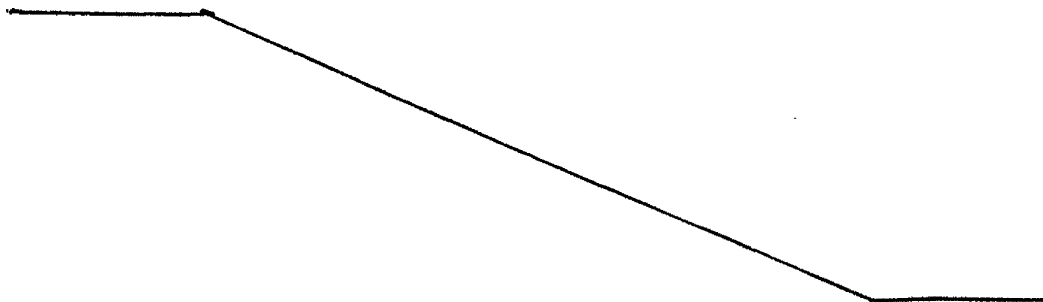
5. Se filtra la mezcla reaccional, se lava el residuo con alcohol y con agua y se le seca. Se obtienen 16 g de 2-oxo-4-hidroximetil-5-(3',4'-diclorofenilimino)- Δ^3 -pirrolina (cristales amarillos, cristalizables de alcohol). Punto de fusión: 182-184°.

$C_{11}H_8Cl_2N_2O_2$ calc. C 48,7 H 3,0 N 10,3 Cl 26,1
48,5 3,0 10,4 26,0

Ejemplo 4

10. Se agitan a 25° en 150 cc de agua 23 g de 4'-fluoroanilida de ácido 4-cloroacetoacético, de punto de fusión 119-121°, y 5,4 g de NaCN durante 3 horas. Se filtra por succión la suspensión, se la lava con agua hasta neutralidad y se la seca. Se obtienen 17,1 g de 2-oxo-4-hidroximetil-5-imino- Δ^3 -N-4'-fluorofenilpirrolina en cristales incoloros. Punto de fusión: 167-168° (de alcohol). Estructura confirmada por la N.M.R.

20. Si en lugar de la cantidad empleada de 4'-fluoroanilida de ácido 4-cloroacetoacético se usan 23 g de 2'-fluoroanilida de ácido 4-cloroacetoacético, de punto de fusión 103-104°, se obtienen 15,5 g de 2-oxo-4-hidroximetil-5-imino- Δ^3 -N-2'-fluorofenilpirrolina. Punto de fusión: 127-128° (de cloroformo).



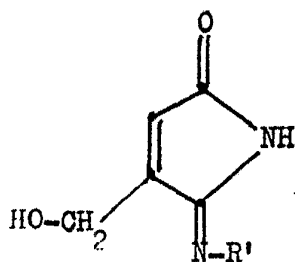
Ejemplo 5

- Se agitan a 0-5° en 150 cc de alcohol 34,8 g de 3',5'-bis-trifluorometilanilida de ácido 4-cloroacetoacético, de punto de fusión 128-129°, y 5,4 g de NaCN.
5. durante 72 horas. Se concentra hasta la mitad la mezcla reaccional, se la combina con 200 cc de agua y se la extrae con éter. Después de separar el éter por destilación, se obtienen 18,6 g de 2-oxo-4-hidroxi-metil-5-[3',5'-bis-trifluorometilfenilamino]- Δ^3 -pirrolina (cristales amarillos; de cloroformo). Punto de fusión: 138-139°.
10. Estructura confirmada por la N.M.R.

Ejemplo 6

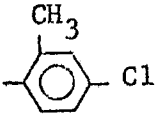
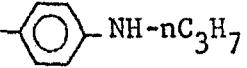
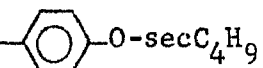
- Se agitan a 25° en 150 cc de agua 22,6 g de 4'-metilanilida de ácido 4-cloroacetoacético, de punto de fusión 145-146° (la cual se obtiene por cloración de diceteno y reacción del cloruro de ácido cloroacetilacético con 4-metilanilina en presencia de trietilamina), con 5,4 g de NaCN, durante 3 horas. Se filtra por succión la suspensión, se la lava con agua y se la seca.
- 15.
20. Se obtienen 17 g de 2-oxo-4-hidroximetil-5-imino- Δ^3 -N-4'-metilfenilpirrolina. Punto de fusión: 102-105° (de etanol).

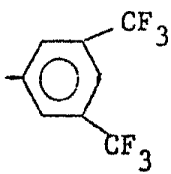
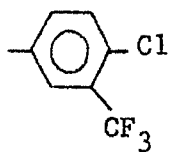
- De esta manera o por una de las variantes de preparación que han sido indicadas antes se preparan los
25. compuestos siguientes, de la fórmula Ib



(Ib)

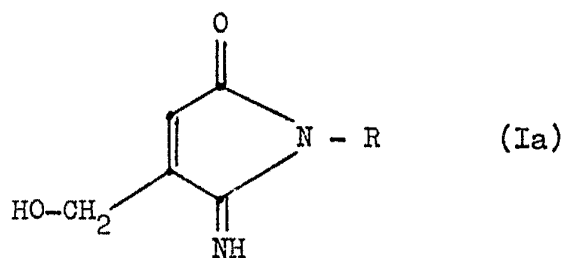
5.

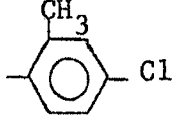
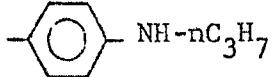
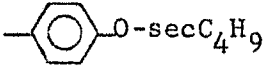
Comp. №	R	P.f. (°C)
1.1	-C ₆ H ₅	117 - 119°
1.2	-C ₆ H ₄ Cl(4)	166 - 168°
10. 1.3	-C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,4)	182 - 184°
1.4	-C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,5)	167 - 168°
1.5	-C ₆ H ₄ Cl(3)	
1.6	-C ₆ H ₄ Br(3)	
15. 1.7	-C ₆ H ₂ Cl ₃ (3,4,5)	
1.8		
1.9	-C ₆ H ₃ (CH ₃) ₂ (2,4)	
1.10	-C ₆ H ₄ (isoC ₃ H ₇)(3)	
20. 1.11	-C ₆ H ₄ (isoC ₃ H ₇)(4)	
1.12	-C ₆ H ₄ -C ₂ H ₅ (4)	
1.13	-C ₆ H ₄ -N(CH ₃) ₂ (4)	
1.14		
25. 1.15	-C ₆ H ₄ CN(4)	
1.16		
1.17	-C ₆ H ₃ Br ₂ (3,5)	
1.18	-C ₆ H ₃ Br ₂ (3,4)	

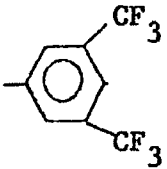
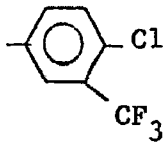
	Compues to I ^a	R'	P.F. (°C)
	1.19	-C ₆ H ₄ F(4)	122-123 ^o
	1.20	-C ₆ H ₄ F(3)	147-148 ^o
	1.21	-C ₆ H ₄ F(2)	
5.	1.22		138-139 ^o
10.	1.23		161-162 ^o
	1.24	-C ₆ H ₄ -CH ₃ (4)	
	1.25	-C ₆ H ₄ -OCH ₃ (4)	
15.	1.26	-C ₆ H ₄ -NO ₂ (3)	

Según los ejemplos respectivos o según una de las variantes de preparación que se han indicado antes se sintetizan también los compuestos siguientes, de la fórmula Ia:

20.



	Comp. no	R	P.f. (°C)
	2.1	-C ₆ H ₅	86 - 88°
	2.2	-C ₆ H ₄ Cl(4)	131 - 132°
5.	2.3	-C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,4)	146 - 148°
	2.4	-C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,5)	133 - 134°
	2.5	-C ₆ H ₄ Cl(3)	
	2.6	-C ₆ H ₄ Br(3)	
	2.7	-C ₆ H ₂ Cl ₃ (3,4,5)	
10.	2.8		
	2.9	-C ₆ H ₃ (CH ₃) ₂ (2,4)	
	2.10	-C ₆ H ₄ (isoC ₃ H ₇)(3)	
15.	2.11	-C ₆ H ₄ (isoC ₃ H ₇)(4)	
	2.12	-C ₆ H ₄ -C ₂ H ₅ (4)	
	2.13	-C ₆ H ₄ -N(CH ₃) ₂ (4)	
	2.14		
20.	2.15	-C ₆ H ₄ CN(4)	
	2.16		
	2.17	-C ₆ H ₃ Br ₂ (3,5)	
	2.18	-C ₆ H ₃ Br ₂ (3,4)	
25.	2.19	-C ₆ H ₄ F(4)	167 - 168°
	2.20	-C ₆ H ₄ F(3)	
	2.21	-C ₆ H ₄ F(2)	127 - 128°

	Comp. No	R	P.f. (°C)
5.	2.22		
	2.23		
10.	2.24	-C ₆ H ₄ -CH ₃ (4)	102 - 105°
	2.25	-C ₆ H ₄ -OCH ₃ (4)	125 - 127°
	2.26	-C ₆ H ₄ -NO ₂ (3)	

15. Con estas materias activas es posible reprimir o exterminar los hongos que aparecen en las plantas o las partes de los vegetales (frutos, flores, hojas, tallos, bulbos y raíces) y que también las partes de los vegetales que crezcan más tarde sean respetadas

20. por tales hongos. Cabe señalar por ejemplo el ataque de los Cercospora a los cacahuetes, la remolacha azucarera, la soja, etc., o el de los Rhizoctonia a las diversas especies de col, ataques que se pueden combatir duraderamente con materias activas de la fórmula I, tanto más

25. cuanto que estos compuestos manifiestan también acción sistémica.

Las materias activas de la fórmula I pueden utilizarse además como desinsectantes para el tratamiento de las semillas (frutos, tubérculos y granos) y de los esquejes o plantones para protegerlos de las infecciones micóticas, como Tilletia caries, así como contra los hongos fitopatógenos que aparecen en el suelo.

5.

El nuevo procedimiento atañe en particular a la preparación de los compuestos de la fórmula I en los que uno de los dos substituyentes R y R' significa

10.

un anillo fenílico insubstituído o que está substituído por alquilo de C₁-C₄, por alcoxilo de C₁-C₄, por hidroxialquilo de C₁-C₄, por alquilamino de C₁-C₄, por (alquilo de C₁-C₄)₂-amino, por halógeno o por ciano, mientras el otro de los dos substituyentes R y R' representa hidrógeno.

15.

De éstos se prefieren aquellos en los que el anillo fenílico está insubstituído o bien lo substituyen metilo, etilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, cloro o bromo.

20.

Compuestos individuales de importancia microbicida son, entre otros:

la 2-oxo-4-hidroximetil-5-imino- Δ^3 -N-(4-clorofenil)-pirrolina,

la 2-oxo-4-hidroximetil-5- \int $\bar{3}$ ' \int 4'-diclorofenilimino \int - Δ^3 -pirrolina,

25.

la 2-oxo-4-hidroximetil-5- \int $\bar{3}$ ' \int 5'-diclorofenilimino \int - Δ^3 -pirrolina

y en particular el compuesto

2-oxo-4-hidroximetil-5-imino- Δ^3 -N-(4-fluorofenil)-
-pirrolina.

5. En la memoria de patente alemana n° 1.949.435 se indica la débil acción fungicida del compuesto estructuralmente semejante N-fenil-2-metil-maleinimida, que es claramente inferior en la acción a los compuestos de la fórmula I aquí expuesta.

10. Sorprendentemente, los compuestos de la fórmula I tienen también favorable acción reguladora del crecimiento de las plantas. Cabe citar, por ejemplo, sus propiedades para la abscisión, como en la abscisión de los frutos o el enralecimiento de las flores, que es especialmente marcado con el compuesto de la fórmula 2-oxo-4-hidroximetil-5-fenilimino- Δ^3 -pirrolina.

15. Para ensanchar o modificar el espectro de acción las materias activas de la fórmula I pueden ser mezcladas con otros fungicidas, bactericidas, fungistáticos y bacteriostáticos ya conocidos, pero también con insecticidas, acaricidas, herbicidas y, en virtud de su acción sistémica, que permite la aplicación al terreno, asimismo con nematocidas, molusquicidas o rodenticidas, lo que depara en parte acciones incrementadas por sinergia.

20. Los compuestos de la fórmula I pueden usarse solos o junto con vehículos apropiados y/o otras materias suplementarias. Los vehículos apropiados y las materias

25.

suplementarias apropiadas pueden ser sólidos o líquidos, como, por ejemplo, materias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, humectantes, fijadores, espesantes, aglomerantes o abonos.

5. El contenido de materia activa en los agentes aptos para el comercio se halla entre 0,1 y 90 %.

Para la aplicación, los compuestos de la fórmula I pueden hallarse en las formas de presentación siguientes (los porcentajes indicados entre paréntesis expresan las cantidades ventajosas de materia activa):

10.

Formas de presentación

sólidas:

Agentes de espolvoreo y agentes de esparcimiento (hasta 10 %), granulados, granulados de envoltura, granulados de impregnación y granulados homogéneos (1 a 80 %).

15.

Formas de presentación

líquidas:

a) Concentrados de materia activa dispersables en agua:

Polvos para aspersiones (wetable powders) y pastas (25 a 90 % en envase comercial, 0,01 a 15 % en solución lista para el uso), concentrados de emulsión y de solución (10 a

25.

50 %; 0,01 a 15 % en solución
lista para el uso),

b) Soluciones (0,1 a 20 %).

5. Las materias activas de la fórmula I pertenecientes a este invento pueden formularse así, por ejemplo:

Agentes de espolvoreo

Para preparar

a) un agente de espolvoreo al 5 % y

b) un agente de espolvoreo al 2 %

10. se emplean las materias siguientes:

a) 5 partes de materia activa y

95 partes de talco;

b) 2 partes de materia activa,

1 parte de ácido silícico ultradisperso y

15. 97 partes de talco.

Se mezclan y muelen las materias activas con las materias de vehículo y en esta forma pueden utilizarse para el espolvoreo.

Granulado

20. Para preparar un granulado al 5 % se emplean las materias siguientes:

5 partes de materia activa,

0,25 partes de epíclorohidrina,

0,25 partes de éter cetilpoliglicólico,

25. 3,50 partes de polietilenglicol y

91 partes de caolín (de tamaño granular 0,3 a 0,8 mm).

- Se mezcla la substancia activa con la epí-clorohidrina y se disuelve con 6 partes de acetona; luego se añaden el polietilenglicol y el éter cetilpoliglicólico. La solución así obtenida se rocía sobre el caolín y a
5. continuación se evapora la acetona en vacío. Tal microgranulado se emplea con ventaja para combatir los hongos del terreno.

Polvos para aspersiones

Para preparar

10. a) un polvo para aspersiones al 70 % ,
b) un polvo para aspersiones al 40 % ,
c y d) un polvo para aspersiones al 25 % y
e) un polvo para aspersiones al 10 %
se emplean los ingredientes siguientes:
15. a) 70 partes de materia activa,
5 partes de dibutilnaftilsulfonato sódico,
3 partes de condensado de ácidos naftalinsulfónicos, ácidos fenolsulfónicos y formaldehído 3:2:1,
20. 10 partes de caolín y
12 partes de creta de Champagne;
- b) 40 partes de materia activa,
5 partes de ácido ligninsulfónico, sal sódica,
25. 1 parte de ácido dibutilnaftalinsulfónico, sal sódica, y
54 partes de ácido silícico;

5. c) 25 partes de materia activa,
4,5 partes de ligninsulfonato cálcico,
1,9 partes de mezcla 1:1 de creta de Champagne
e hidroxietilcelulosa,
1,5 partes de dibutil-naftalinsulfonato sódico,
19,5 partes de ácido silícico,
19,5 partes de creta de Champagne y
28,1 partes de caolín;
10. d) 25 partes de materia activa,
2,5 partes de isooctilfenoxi-polioxietilen-etanol,
1,7 partes de mezcla 1:1 de creta de Champagne e
hidroxietilcelulosa,
8,3 partes de silicato sódico de aluminio,
16,5 partes de kieselgur y
15. 46 partes de caolín;
20. e) 10 partes de materia activa,
3 partes de mezcla de las sales sódicas de
sulfatos de alcohol graso saturados,
5 partes de condensado de ácido naftalinsulfónico
y formaldehído y
82 partes de caolín.

25. Se mezclan íntimamente las materias activas con las materias suplementarias en mezcladoras apropiadas y se muele en molinos y calandrias convenientes. Se obtienen polvos para aspersiones de excelente humectabilidad y cernibilidad, que pueden diluirse con agua para formar suspensiones de cualquier concentración que se desee y emplearse especialmente para aplicación a las hojas.

Concentrados emulgibles

Para preparar un concentrado emulgible al 25 % se emplean las materias siguientes:

5. 25 partes de la materia activa,
2,5 partes de aceite vegetal epoxidado,
10 partes de una mezcla de sulfonato de alquilarilo y éter poliglicólico de alcohol graso,
5 partes de dimetilformamida y
10. 57,5 partes de xileno.

De tales concentrados pueden prepararse por dilución con agua emulsiones de cualquier concentración que se desee, las cuales son aptas especialmente para la aplicación a las hojas.

15. Ejemplo biológico

Acción contra Cercospora personata (= C. arachidicola) sobre plantas de cacahuete

20. Se rociaron con un caldo de aspersiones (0,02 % de substancia activa) hecho de un polvo para aspersiones de la materia activa unas plantas de cacahuete de 3 semanas de edad. Al cabo de unas 12 horas se espolvorearon con una suspensión del conidios del hongo las plantas tratadas. Luego se incubaron éstas por unas 24 horas a >90 % de humedad relativa del aire y a continuación se mantuvieron
25. en el invernadero a unos 22° C. A los 12 días se evaluó el ataque de los hongos.

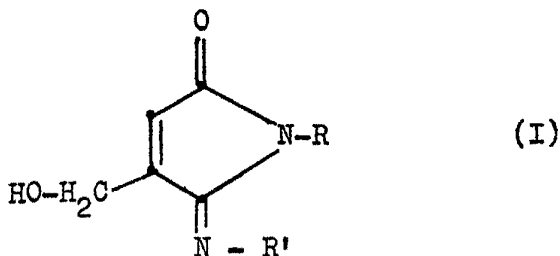
Comparadas con los testigos no tratados, las plantas tratadas con las materias activas de la fórmula I manifestaron por lo regular escaso o casi ningún ataque de los hongos.

..-

N O T A

5. Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la solicitud de patente suiza nº 5143/75 del 22 de Abril de 1975.

10. 1. Procedimiento para la preparación de iminopirrolinonas, de la fórmula I



15.

en la que uno de los dos substituyentes

R y R' significa un anillo fenílico insubstituido o que está substituido por alquílico de C₁-C₄, por alcóxido de C₁-C₄, por hidroxialquilo de C₁-C₄, por alquilamino de C₁-C₄, por (alquilo de C₁-C₄)₂-amino, por halógeno, por nitro o por ciano,

20.

mientras el otro de los dos substituyentes

R y R' representa hidrógeno,

caracterizado por ciclizarse en el intervalo de temperatura de 0° a 80° C una cloroacetoacetanilida de la fórmula



en la que

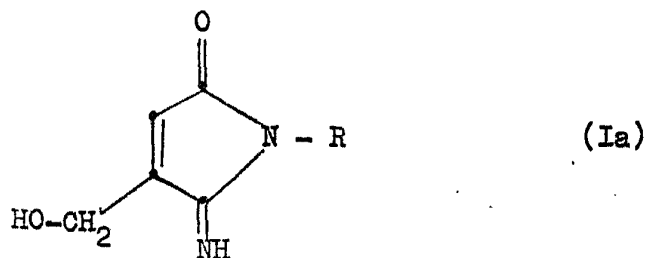
5. R tiene el mismo significado que antes, en presencia de iones de cianuro y en un disolvente indiferente.

10. 2. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque en una forma selectiva de su realización se constituyen compuestos de la fórmula I en los que uno de los dos substituyentes R y R' significa un anillo fenílico insubstituido o que está substituido por alquilo de C₁-C₄, por alcoxilo de C₁-C₄, por hidroxialquilo de C₁-C₄, por alquilamino de C₁-C₄, por (alquilo de C₁-C₄)₂-amino, por halógeno o por ciano, mientras el otro de los dos substituyentes R y R' representa hidrógeno.

20. 3. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque, más particularmente, se constituyen compuestos de la fórmula I en los que el anillo fenílico R o R' está insubstituido o lo substituyen metilo, etilo, isopropilo, metoxilo, etoxilo, cloro o bromo.

25. 4. Procedimiento según las reivindicaciones 1, 2 ó 3, caracterizado por emplearse como disolventes el agua o alcoholes.

5. Procedimiento según las reivindicaciones 1, 2, 3 ó 4, caracterizado en que para la formación de los compuestos de la fórmula I con la estructura Ia

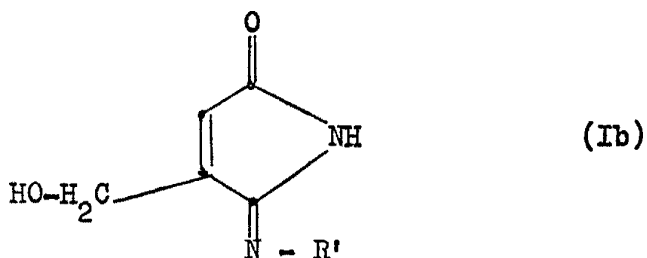


5. en la que

R tiene el mismo significado que se le ha atribuido en la reivindicación 2, se emplea el agua como disolvente.

10. 6. Procedimiento según las reivindicaciones 1, 2, 3 o 4, caracterizado en que para la formación de los compuestos de la fórmula I con la estructura IB

15.



en la que

20. R' tiene el mismo significado que se le ha atribuido en la reivindicación 2, se emplea un alcohol como disolvente.

7. Procedimiento según la reivindicación 6, caracterizado en que el alcohol es el etanol.

25. 8. Procedimiento según una de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado por seleccionarse para el aporte de iones cianuro, cianuro alcalino.

9. Procedimiento según una de las reivindicaciones

1 a 6, caracterizado por emplearse preferentemente cianuro sódico en cantidades equimolares.

5. 10. Procedimiento según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado en que la reacción transcurre entre 0° y 30° C.

11. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado en su realización por seleccionarse en calidad de compuesto de fórmula I 2-oxo-4-hidroximetil-5-imino- Δ^3 -N-(4-fluorofenil)-pirrolina conforme a la fórmula I.

10. 12. Procedimiento según la reivindicación 2, caracterizado en su realización por seleccionarse asimismo en calidad de compuesto de fórmula I, 2-oxo-4-hidroximetil-5-fenilimino- Δ^3 -pirrolina conforme a la fórmula I.

15. 13. Procedimiento para la preparación de iminopirrolinas.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 23 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 21 Abril 1976

p.p. AIME ISERN

Firmado: JOSE F. NIETO