



(Case 5-9883/E)

PATENTE DE INVENCION

10 ES	11 21	NUMERO 447646	10 AI
12	FECHA DE PRESENTACION		

60 PRIORIDADES: 61 NUMERO 5894/75		62 FECHA 7 Mayo 1975	63 PAIS Suiza
67 FECHA DE PUBLICIDAD	68 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D A61K	69 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA	
64 TITULO DE LA INVENCION "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVAS TIAZOLENAS"			
71 SOLICITANTE (S) CIBA-GEIGY AG		23 FEB. 1977	
DOMICILIO DEL SOLICITANTE BASILEA (Suiza)			
72 INVENTOR (ES) Dr. Dieter Dürr Dr. Walter Traber			
73 TITULAR (ES) CIBA-GEIGY AG			
74 REPRESENTANTE D. JAIME ISERN CUYAS, Agente Oficial de la Propiedad Industrial			

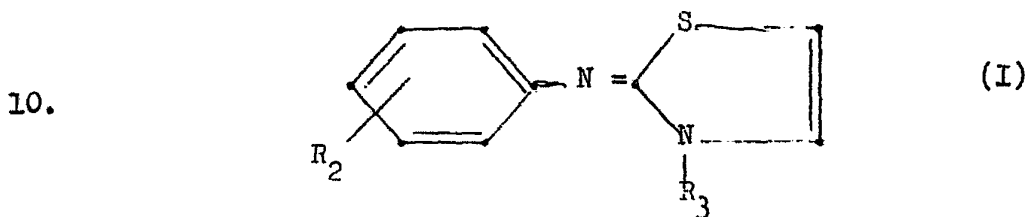
**POOR
QUALITY**

MEMORIA DESCRIPTIVA

Este invento se refiere a nuevos compuestos tiazolínicos de acción acaricida, a la preparación de estos compuestos, a agentes que contienen estos compuestos y al empleo de estos compuestos para combatir a los ácaros y en particular a las garrapatas.

5.

Los nuevos compuestos corresponden a la fórmula general



en la que

15. R_1 y R_2 , independientemente uno de otro, significan cloro, metilo o etilo, aunque R_2 puede asumir la posición 4 o la 6, con la excepción de que cuando R_1 y R_2 significan cloro R_2 no puede hallarse en posición 4, y

20. R_3 significa un grupo alquílico de 1 a 4 átomos de carbono, lineal o ramificado y eventualmente sustituido por alcoxilo de 1-2 átomos de carbono; o bien un grupo alquénico de 3 a 5 átomos de carbono, lineal o ramificado y eventualmente sustituido por halógeno,

25. e incluyen las sales de adición de ácido, en particular los clorhidratos.

Por grupos alquílicos según la fórmula I deben entenderse los grupos de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, butilo secundario o butilo terciario; y por grupos alquénílicos eventualmente substituídos por átomos de halógeno, según la fórmula I, los grupos de aliilo, crotonilo, metililo, 2,2-dimetilvinilo, 2-cloroaliilo, 3-cloroaliilo o 2,3-dicloroaliilo.

En calidad de sales de los compuestos de la fórmula I entran en cuenta, además de los clorhidratos, también los sulfatos, fosfatos, percloratos, acetatos, lactatos, succinatos, citratos o naftalindisulfonatos.

Se conocen ya compuestos tiazolínicos biológicamente activos. Así, los compuestos de la fórmula I pertenecen a un grupo de tiazolinas que han sido reveladas como agentes antiparasitarios en la patente suíza 439.858. Pero los compuestos de la fórmula I conformes a este invento no se describen en dicha patente en cuanto a su acción ni siquiera se mencionan en ella explícitamente.

Ahora se ha descubierto de manera sorprendente que los compuestos de la fórmula I conformes a este invento presentan excelente actividad contra los acáridos, especialmente para inhibir la puesta de los huevos en las garrapatas, y que en ello son muy superiores a los compuestos conocidos hasta ahora de la misma actuación.

Los compuestos siguientes se distinguen por grados de actividad muy altos:

2-(2-metil-4-cloro-fenilimino)-3-metil-tiazolina

2-(2,4-dimetil-fenilimino)-3-metil-tiazolina.

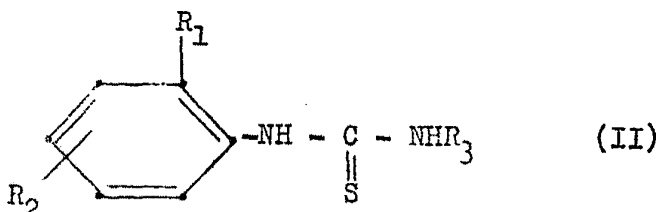
5.

Para la preparación de las tiazolinas se dispone de métodos de síntesis conocidos, según los cuales se hacen reaccionar a temperatura alta tioureas con compuestos de alfa-halogencarbonilo en presencia de disolventes polares. Así, los compuestos de la

10.

fórmula I pueden prepararse de manera ya de sí conocida haciendo reaccionar a temperatura alta un compuesto de la fórmula

15.



en la que los radicales

R₁ a R₃ tienen el mismo significado que se les atribuye en la fórmula I,

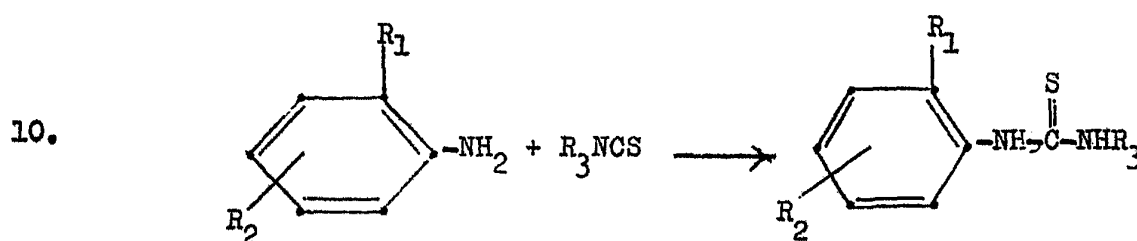
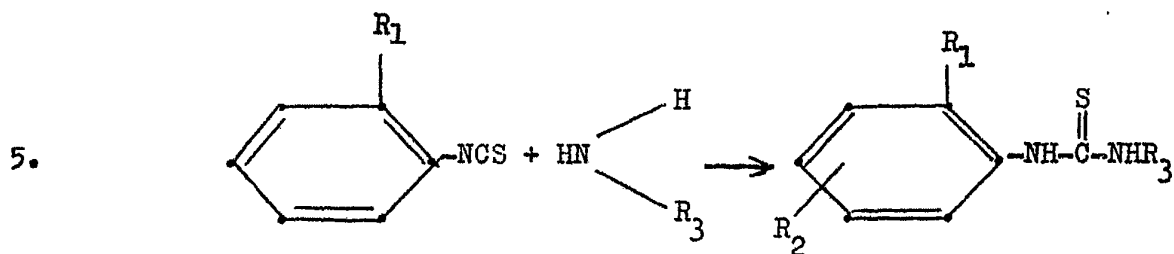
20.

con aldehído cloroacético, en un disolvente polar, como agua o alcohol, y empleando como medio de reacción, en el caso de que el aldehído cloroacético se halle en forma del dietilacetal, ácido mineral diluído.

25.

Las tioureas de la fórmula II empleadas como compuestos de partida son conocidas y preparables por métodos ya descritos. Se las puede obtener, por ejemplo, mediante reacción de fenilisotiocianatos con aminas o de

fenilaminas con isotiocianatos según los esquemas de síntesis siguientes:



Ejemplo 1

15. 2-(2,4-xililimino)-3-metil-tiazolina

20. Se calientan durante una hora en ebullición en reflujo 19,4 g (0,1 mol) de N-2,4-xilil-N'-metil-tio-urea y 15,2 g (0,1 mol) de dietilacetal de cloroacetaldehído en 150 cc de ácido clorhídrico acuoso 2 N. A continuación se enfría hasta la temperatura del ambiente la solución límpida, de color amarillo claro, se la alcaliniza ligeramente con lejía acuosa de sosa cáustica al 30 % y se extrae con éter. El extracto etéreo se lava con agua, se seca con sulfato sódico y se filtra; luego se le separa el éter por destilación y se destila el residuo oleoso.

25.

Punto de ebullición: 132-134°/0,3 Torr.

Rendimiento: 20,2 g = 92 % del teórico.

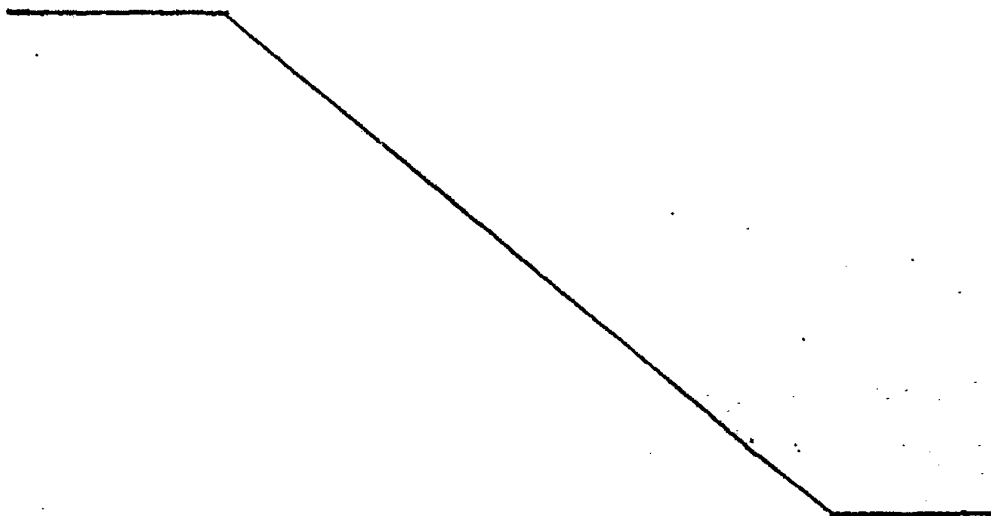
Ejemplo 2

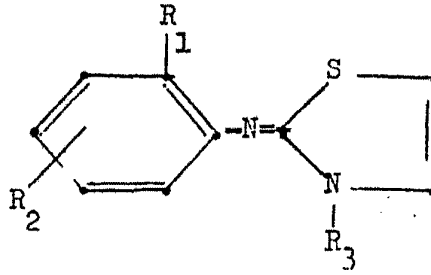
2-(2,6-dicloro-fenil)-3-metil-tiazolina

5. Se calientan durante 3 horas en ebullición en reflujo y con agitación mecánica 28 g (0,12 moles) de N-(2,4-dicloro-fenil)-N'-metil-tiourea y 32 g (0,12 moles) de solución acuosa de aldehído cloroacético al 30 %, en 100 cc de agua. Se enfría hasta la temperatura del ambiente la solución límpida y se la alcaliniza ligeramente con lejía acuosa de sosa cáustica al 30 %. Luego
10. se extrae con éter, se lava con agua la fase etérea, se la seca con sulfato sódico y se separa el éter por destilación. El residuo oleoso se destila en el tubo de bolas.

15. Punto de ebullición: 140° C / 0,005 Torr.
21,7 g de cristales blancos con punto de fusión de 88-90° C (70 % de la teoría).

De manera análoga se obtienen las tiazolinas de la fórmula I siguientes:





5.

10.

15.

20.

25.

Compues to nº	R ₁	R ₂	R ₃	Datos físicos
1	Cl	6-Cl	CH ₃	88-90°C 140°C/0,005 Torr
2	Cl	6-CH ₃	CH ₃	86-88°C
3	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	83-85°C
4	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	CH ₃	58-59°C
5	CH ₃	4-Cl	CH ₃	66°C
6	CH ₃	4-CH ₃	CH ₃	132-134°C/0,3 Torr
7	CH ₃	4-CH ₃	C ₄ H ₉	156-15°C/0,4 Torr
8	CH ₃	4-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH	n _D ²⁰ 1,5919 49-51°C
9	CH ₃	4-CH ₃	(CH ₃) ₃ -C	53°C
10	CH ₃	4-CH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂	n _D ²⁰ 1,6149
11	CH ₃	4-CH ₃	C ₃ H ₇	n _D ²⁰ 1,6023
12	CH ₃	4-CH ₃	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
13	CH ₃	4-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	n _D ²⁰ 1,5913
14	CH ₃	4-CH ₃	C ₂ H ₅	65°C
15	Cl	4-CH ₃	CH ₃	92-94°C
16	CH ₃	6-C ₂ H ₅	CH ₃	160°C/0,3 Torr
17	CH ₃	4-Cl	CH ₃	85-88°C
18	CH ₃	4-CH ₃	CH ₂ =C(CH ₃)-CH ₃	120-127 /0,001 Torr
19	CH ₃	4-CH ₃	CH ₂ =CCl-CH ₂	
20	CH ₃	4-CH ₃	ClCH=CH-CH ₂	
21	CH ₃	4-CH ₃	ClCH=CCl-CH ₂	
22	Cl	6-Cl	C ₂ H ₅	149-152°/0,001 Torr
23	CH ₃	4-Cl	CH(CH ₃)-CH ₂ -OCH ₃	138-140° /0,03

Compues to No	R ₁	R ₂	R ₂	Datos físicos	
5.	24	Cl	6-Cl	C ₃ H ₇	150°/0,001 Torr
	25	Cl	6-Cl	C ₄ H ₉	140°/0,001 Torr
	26	Cl	6-Cl	(CH ₃) ₂ CH	130-135°/0,001 Torr
	27	Cl	6-Cl	(CH ₃) ₃ C	
	28	Cl	6-Cl	CH ₂ =CH-CH ₂	150-155°/0,001 Torr
	29	Cl	6-Cl	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	147-152°/0,001 Torr
	30	Cl	6-Cl	CH ₂ =CCl-CH ₂	
	31	Cl	6-Cl	ClCH=CH-CH ₂	
	32	Cl	6-Cl	ClCH=CCl-CH ₂	
	10.	33	Cl	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
34	Cl	6-Cl	CH ₂ =C-CH ₂ CH ₃		
15.	35	CH ₃	6-C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	130°/ 0,03 Torr
	36	CH ₃	6-C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	119°/0,001 Torr
	37	CH ₃	6-C ₂ H ₅	C ₄ H ₉	129-135°/0,001 Torr
	38	CH ₃	6-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH	130°/0,01 Torr
	39	CH ₃	6-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C	134°/0,005 Torr
	40	CH ₃	6-C ₂ H ₅	CH ₂ =CH-CH ₂	140°/0,01 Torr
	41	CH ₃	6-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ -CH-CH ₂	128°/0,005 Torr
	42	CH ₃	6-C ₂ H ₅	CH ₂ =CCl-CH ₂	
	43	CH ₃	6-C ₂ H ₅	ClCH=CH-CH ₂	
	44	CH ₃	6-C ₂ H ₅	ClCH=CCl-CH ₂	
20.	45	CH ₃	6-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
46	CH ₃	6-C ₂ H ₅	CH ₂ =C-CH ₂ CH ₃	120-127°/0,001 Torr	
25.	47	Cl	4-CH ₃	C ₂ H ₅	145-150°/0,0025 Torr
	48	Cl	4-CH ₃	C ₃ H ₇	150°/0,005 Torr
	49	Cl	4-CH ₃	C ₄ H ₉	155°/0,005 Torr
	50	Cl	4-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH	135°/0,005 Torr
	51	Cl	4-CH ₃	(CH ₃) ₃ C	155-160°/0,0001 Torr
	52	Cl	4-CH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂	165°/0,0001 Torr
	53	Cl	4-CH ₃	(CH ₃) ₂ -CH-CH ₂	

	Compues to Nº =	R ₁	R ₂	R ₃	Datos físicos
5.	54	Cl	4-CH ₃	CH ₂ =CCl-CH ₂	
	55	Cl	4-CH ₃	ClCH=CH-CH ₂	
	56	Cl	4-CH ₃	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
	57	Cl	4-CH ₃	CH ₂ =C-CH ₂ CH ₃	
10.	58	CH ₃	4-Cl	C ₂ H ₅	148°/0,01 Torr
	59	CH ₃	4-Cl	C ₃ H ₇	122-130°/0,008 Torr
	60	CH ₃	4-Cl	C ₄ H ₉	145°/0,005 Torr
	61	CH ₃	4-Cl	(CH ₃) ₂ CH	139-145°/0,01 Torr
	62	CH ₃	4-Cl	(CH ₃) ₃ C	135-140°/0,007 Torr
	63	CH ₃	4-Cl	CH ₂ =CH-CH ₂	135-140°/0,01 Torr
	64	CH ₃	4-Cl	(CH ₃) ₂ -CH-CH ₂	147°/0,01 Torr
	65	CH ₃	4-Cl	CH ₂ =CCl-CH ₂	
	66	CH ₃	4-Cl	ClCH=CH-CH ₂	
	67	CH ₃	4-Cl	ClCH=CCl-CH ₂	
15.	68	CH ₃	4-Cl	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
	69	CH ₃	4-Cl	CH ₂ =C-CH ₂ CH ₃	135-139°/0,001 Torr
	70	Cl	6-CH ₃	C ₂ H ₅	153°/0,01 Torr
20.	71	Cl	6-CH ₃	C ₃ H ₇	141°/0,01 Torr
	72	Cl	6-CH ₃	C ₄ H ₉	140°/0,001 Torr
	73	Cl	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ -CH	155°/0,01 Torr
	74	Cl	6-CH ₃	(CH ₃) ₃ C	
	75	Cl	6-CH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂	146°/0,01 Torr
	76	Cl	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	140°/0,005 Torr
	77	Cl	6-CH ₃	CH ₂ =CCl-CH ₂	
	78	Cl	6-CH ₃	ClCH-CH-CH ₂	
25.	79	Cl	6-CH ₃	ClCH-CCl-CH ₂	
	80	Cl	6-CH ₃	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
	81	Cl	6-CH ₃	CH ₂ =C-CH ₂ CH ₃	130-135°/0,001 Torr

	Compues to Nº	R ₁	R ₂	R ₃	Datos físicos
5.	82	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	119-123°/0,001 Torr
	83	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	
	84	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	C ₄ H ₅	
	85	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH	
	86	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C	
	87	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	CH ₂ =CH-CH ₂	112-118°/0,001 Torr
	88	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	129-132°/0,001 Torr
	89	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	CH ₂ =CCl-CH ₂	
	90	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	ClCH=CH-CH ₂	
	10.	91	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	ClCH-CCl-CH ₂
	92	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH=CH-CH ₂	
	93	C ₂ H ₅	6-C ₂ H ₅	CH ₂ =C-CH ₂ CH ₃	
15.	94	CH ₃	6-CH ₃	C ₂ H ₅	135 - 140°/0,001 Torr
	95	CH ₃	6-CH ₃	C ₃ H ₇	140°/0,001 Torr
	96	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH	145°/0,001 Torr
	97	CH ₃	6-CH ₃	C ₄ H ₉	148°/0,001 Torr
	98	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	128°/0,001 Torr
20.	99	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₃) ₃ -C	135°/0,001 Torr
	100	CH ₃	6-CH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂	146°/0,001 Torr
	101	CH ₃	6-CH ₃	CH ₂ =C-CH ₃ CH ₃	122 - 127°/0,001 Torr

- Las tiazolinas de la fórmula I tienen propiedades excelentes para combatir a los acáridos, especialmente a las garrapatas (ixódidos), como, por ejemplo, Amblyomma, Rhipicephalus y Boophilus. Esto atañe particularmente a la inhibición de la puesta de huevos fértiles.
5. Por otra parte, estos compuestos muestran intenso efecto "detaching", que es de especial importancia para el tratamiento de los animales huéspedes ya atacados (por ejemplo, bueyes o conejos). El efecto "detaching" empieza a instaurarse inmediatamente después de la aplicación de la
10. substancia activa, con lo que las garrapatas se ven impedidas de proseguir su toma de alimento (o sea la extracción de sangre) del huésped. Durante el curso del
15. tratamiento se desprenden de éste, por lo que como efecto final el animal parasitado queda completamente libre de los parásitos.

Ejemplo 3

Ensayo de la acción sobre las garrapatas: Inhibición de la puesta de los huevos

20. Se emplean como animales de ensayo hembras completamente desarrolladas de la garrapata bovina Boophilus microplus. Por concentración se tratan cada vez 10 garrapatas de una raza resistente y 10 garrapatas de una raza de sensibilidad normal. Se sumergen las
25. garrapatas por breve tiempo en emulsiones acuosas, o respectivamente soluciones acuosas, de las sales de los

5. compuestos investigados, se las fija sobre placas provistas de cinta adhesiva doble y se las mantiene en condiciones constantes en una cámara climatizada. La evaluación se efectúa al cabo de tres semanas. Se averigua la inhibición total de la puesta de huevos fértiles.

La acción inhibidora de las sustancias se expresa como concentración de la sustancia en ppm para 100 % de acción contra las garrapatas hembras adultas, de sensibilidad normal y resistentes.

10. Resultado

15.	Compuesto	Concentración mínima en ppm para 100 % de acción inhibidora	
		♀ sensbl.	♀ resist.
	1) 2-(2,6-diclorofenilimino)-3-metil-tiazolina	10	10
	2) 2-(2-cloro-5-metilfenilimino)-3-metil-tiazolina	≤ 50	≤ 50
20.	3) 2-(2,6-dietilfenilimino)-3-metil-tiazolina	≤ 50	≤ 50
	4) 2-(2-metil-4-clorofenilimino)-3-metil-tiazolina	10	5
	5) 2-(2,4-dimetilfenilimino)-3-metil-tiazolina	10	10
25.	6) 2-(2-metil-6-etilfenilimino)-3-metil-tiazolina	≤ 50	≤ 50

d) Prueba de la toxicidad:

Compuesto nº 4

DL₅₀ en la rata p.o.

2500 mg/kg

Resultados comparativos de compuestos conocidos

Compuesto	Concentración mínima en ppm para 100 % de acción	
	sensbl.	resist.
5. 2-(3,4-diclorofenilimino)-N-n-butyl-pirrolidona (Bimarit)	1000	1000
2-(3,4-diclorofenilimino)-3-metil-tiazolina (patente suiza 439.858)	> 1000	> 1000
10. 2-(3,4-diclorofenilimino)-3-metil-tiazolina-HCl (patente suiza 439.858)	> 1000	> 1000
2-(4-clorofenilimino)-3-metil-tiazolina-HCl (patente suiza 439.858)	> 1000	> 1000

Ejemplo 4

Ensayo de la acción sobre las garrapatas: efecto

15.

"detaching"

Se aplican garrapatas adultas y ninfas de garrapata a las orejas de unos conejos y se envuelven las orejas con género textil, a modo de bolsa, para que los pársitos no escapen. Antes del tratamiento se retira la envoltura y se toma nota del ataque. Se sumergen durante unos 2 minutos en una solución al 0,05 % de la substancia en ensayo las orejas infestadas (la solución de ensayo es una dilución acuosa de un concentrado de emulsión de la substancia respectiva) y a continuación se vuelve a fijar la envoltura.

20. La evaluación se realiza al cabo de 24 horas. La actividad de la substancia ensayada se expresa en % de las garrapatas desprendidas respecto al número de las garrapatas fijadas antes del tratamiento de la oreja del conejo.

25.

Resultado

Compuesto	Efecto "detaching" en % de las garrapatas		
	Amblyomma hebraeum		Rhipicephalus bursa
5. 2-(2-metil-4-clorofenil imino)-3-metil-tiazoliña	adultas	ninfas	
	100	100	100
10. 2-(2,4-dimetilfenilimi- no)-3-metil-tiazolina	100	100	100

Ensayo comparativo con un compuesto conocido

15. Se infesta con hembras de Amblyomma un buey y al cabo de 1 a 2 días, cuando las garrapatas se han fijado firmemente, se le rocía con una solución de concentrado de emulsión diluido en agua, en la cual la concentración de sustancia activa es de 0,05 %.

20. Resultado:

Compuesto	Efecto "detaching" Número de garrapatas fijadas	
	antes del tra- tamiento	después del tratamiento
25. 2-(2-metil-4-clorofe- nilimino)-3-metil-tia- zolína	60	0
2-(2,4-dimetilfenil- imino)-3-metil)-3-me- til-tiazolina	60	0
BIMARIT	75	73

- Los compuestos de la fórmula I pueden utilizarse por sí solos o junto con vehículos apropiados y/o materias suplementarias apropiadas. Los vehículos apropiados y las materias suplementarias apropiadas pueden
5. ser sólidos o líquidos y corresponden a las materias usuales en la técnica de las formulaciones, como, por ejemplo, materias naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, humectantes, fijadores, espesantes y/o aglomerantes.
10. Para la aplicación, los compuestos de la fórmula I pueden elaborarse en forma de agentes de espolvoreo, concentrados de emulsión, granulados, dispersiones, sprays, soluciones o suspensiones en la formulación corriente, que pertenece al conocimiento común de la técnica de las aplicaciones. Cabe señalar
15. además los "cattle dips" o baños de ganado y los "spray races" o pasos de llovizna, así como los métodos "pour-on" en que se emplean preparaciones acuosas o concentrados acuosos.
20. La preparación de los agentes conformes a este invento se efectúa de manera ya de sí conocida, por mixturación y/o molturación íntimas de materias activas de la fórmula I con materias de vehículo apropiadas. eventualmente con adición de dispersantes o disolventes
25. inertes para las materias activas. Estas pueden hallarse y aplicarse en las formas de presentación siguientes:

Formas de presentación sólidas: Agentes de espolvoreo, agentes de esparcimiento, granulados.

5. Formas de presentación líquidas:

a) Concentrados de materia activa dispersables en agua:

polvos para aspersiones (polvos humectables), pastas, emulsiones

10.

b) Soluciones

El contenido de materia activa en las formas de aplicación antes descritas se halla entre 1 y 80 %.

15.

Ejemplo 4

Concentrado de emulsión

Se disuelven en

70 partes en peso de xileno

20 partes en peso de la materia activa citada antes

20.

y se mezcla con

10 partes en peso de un emulgente constituido por una

mezcla de un éter arilfenilpoliglicólico y

la sal cálcica del ácido dodecibencensulfónico.

25.

Este concentrado de emulsión puede mezclarse con agua en cualquier proporción y forma entonces una emulsión lechosa.

Ejemplo 5

Concentrado de emulsión

Agitando y a la temperatura del ambiente se disuelven

- | | |
|-----|--|
| 5. | 5 a 30 (máx.) partes en peso de la materia activa en |
| | 30 partes en peso de ftalato de dibutilo, |
| | 10 partes en peso de Solvent 200 (destilado |
| | altoaromático de aceite mineral, poco |
| | viscoso) y |
| 10. | 15 a 35 partes en peso de Dutrex 238 FC (destilado |
| | altoaromático de aceite mineral, viscoso) |
| | y se mezcla con |
| | 10 partes en peso de una mezcla emulgente |
| | constituída por éter poliglicólico de |
| 15. | aceite de ricino y la sal cálcica del |
| | ácido dodecibencensulfónico. |

El concentrado de emulsión así obtenido da en agua emulsiones lechosas.

20.

Ejemplo 6

Polvo para aspersiones

En un aparato mezclador se mezclan intensamente

- | | |
|-----|--|
| | 5 a 30 partes en peso de la materia activa con |
| | 5 partes en peso de un material de soporte |
| 25. | absorbente (ácido silícico K 320 o Wessalon S) |

y

- 55 a 80 partes en peso de un material de soporte
(Bolus alba o caolín B 24) y una
mezcla dispersante constituida por
- 5 partes en peso de un sulfonato sódico de laurilo
y
5 partes en peso de un éter alquil-aril-poliglicólico.

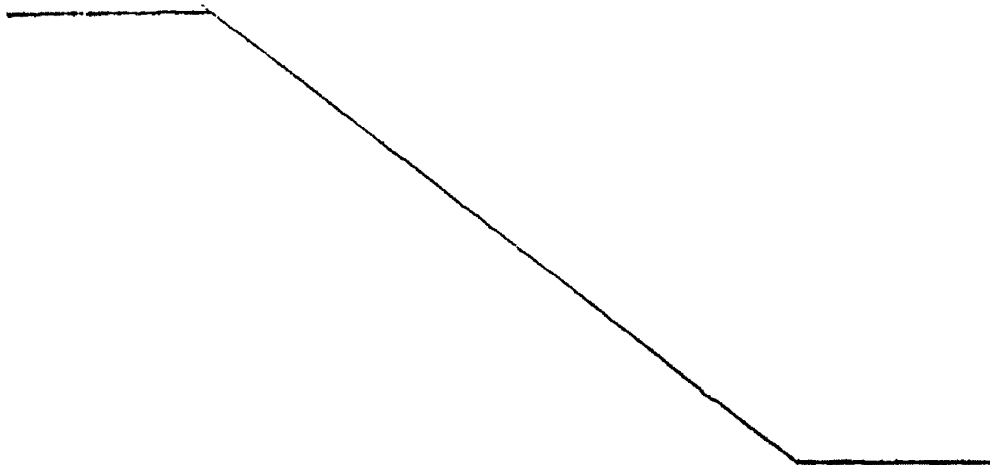
10. Esta mezcla se muele en un molino de pitones o de chorro de aire hasta un tamaño de partículas de 5 a 15 milimicras. El polvo para aspersiones así obtenido da en agua una buena suspensión.

Ejemplo 7

Agente de espolvoreo

Se mezclan intensamente

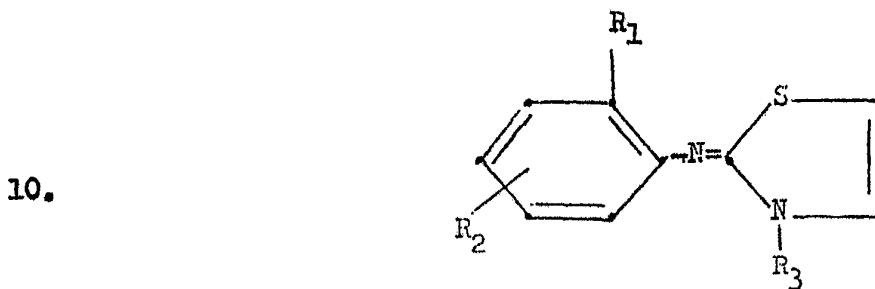
15. 5 partes en peso de materia activa finamente molida
con
2 partes en peso de un ácido silícico precipitado y
93 partes en peso de talco



N O T A

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 5894/75 del 7 de Mayo de 1975.

5. 1. Procedimiento para la preparación de nuevas tiazolinas de la fórmula I

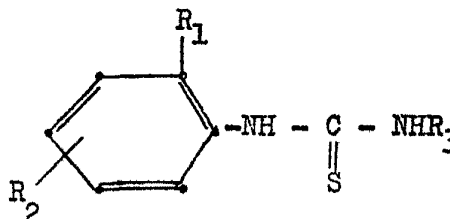


en la que

15. R_1 y R_2 , independientemente uno de otro, significan cloro, metilo o etilo, aunque R_2 puede asumir la posición 4 o la 6, con la salvedad de que cuando R_1 y R_2 significan cloro, R_2 no puede hallarse en posición 4, y
20. R_3 significa un grupo alquílico de 1 a 4 átomos de carbono, lineal o ramificado y eventualmente sustituido por alcóxilo de 1-2-átomos de carbono; o bien significa un grupo alquénico de 3 a 5 átomos de carbono, lineal o ramificado y eventualmente sustituido por halógeno,
25. incluidas las sales de adición de ácido, en particular

los clorhidratos, que constituyen la materia activa en la composición de agentes especialmente aptos para combatir a los ácaros y particularmente a las garrapatas, caracterizado por hacerse reaccionar, a temperatura alta, un compuesto de la fórmula

5.



10.

en la que los radicales

R₁ a R₃ tienen el mismo significado que en la fórmula I,

con aldehído cloroacético, en un disolvente polar, y eventualmente, cuando el aldehído cloroacético se halle

15.

en forma del dietilacetal, emplearse como medio de reacción ácido mineral diluido.

2. Procedimiento para la preparación de nuevas tiazolinas.

20.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 20 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid a 6 de Mayo de 1975

p.a.

p. p.

JEAN L. MORRA

 JOSE L. MORRA