

- 6 NOV. 1978

19 ES

11

NUMERO

451.451

10 A1

21

FECHA DE PRESENTACION

10-9-1976



ESPAÑA

Concedido el Registro de acuerdo con los datos que figuran en la presente descripción y según el contenido de la Memoria adjunta.

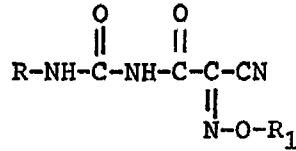
PATENTE DE INVENCION

50 PRIORIDADES:		
51 NUMERO	52 FECHA	53 PAIS
612,547 612,548	11.9.1975 11.9.1975	Estados Unidos " "
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	<i>C07C / A01N</i>	
54 TITULO DE LA INVENCION		
UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVOS DERIVADOS DE IMINOACETAMIDA.		
71 SOLICITANTE (S)		
E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
Wilmington, Delaware 19898 - Estados Unidos -		
72 INVENTOR (ES)		
Hein Louis Klopping, estadounidense.		
73 TITULAR (ES)		
74 REPRESENTANTE		
D. BERNARDO UNGRIA GOIBURU		

1

COMPENDIO DE LA INVENCION

Los compuestos de fórmula;



5

donde R es CH₃OCH₂-, CH₃O(CH₂)₃-, ciclopropilo o ciclopropilmetilo y R₁ es alquilo de 1 o 2 átomos de carbono, son útiles para el control de las enfermedades fúngicas en las plantas. El control de estas enfermedades incluye la prevención, inhibición y/o erradicación de la enfermedad.

10

Los compuestos de esta invención pueden ser aplicados a las plantas para evitar la infección de las mismas por los hongos. Los compuestos no sólo son de acción preventiva sino que también son sistémicos y curativos. Es decir, los compuestos son absorbidos por las plantas y se mueven por su interior. Así, pueden inactivar a un hongo que ya ha infectado la planta. Debido a que los compuestos son sistémicos, pueden ser aplicados no solamente a las partes de la planta infectadas o amenazadas sino también a las partes no infectadas o al terreno donde crece la planta. Todos estos puntos de aplicación están incluidos dentro del término "aplicación a las plantas".

15

20

El hecho de que los compuestos de esta invención sean sistémicos los hace especialmente bien adecuados para combinarlos con fungicidas preventivos convencionales. Así, las



25

1 composiciones de esta invención están constituidas esen-
cialmente por una cantidad fungicidamente efectiva de un
compuesto de esta invención más otro ingrediente fungicida-
mente activo. También pueden incluirse agentes de formula-
5 ción convencionales.

Los compuestos de esta invención donde R_1 es metilo,
2-ciano-2-metoxi-imino-N-metoximetilcarbamoilacetamida,
2-ciano-2-metoxi-imino-N-(3'-metoxipropil)carbamoilacetami-
da, 2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-2-metoxi-iminoacetamida
10 y 2-ciano-N-ciclopropilmetilcarbamoil-2-metoxi-iminoaceta-
mida, son los preferidos por su actividad fungicida.

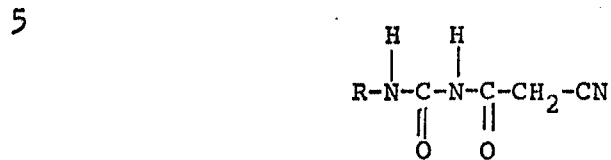
DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

Los nuevos compuestos de esta invención pueden ser
preparados convenientemente por dos vías diferentes.

15 En la primera de estas vías, la 2-ciano-2-metoxi-
iminoacetamida (O. Diels y E. Borgwardt, Ber. 54, 1342
(1921)) o un alcoxi-imino homólogo superior correspondien-
te de este material de partida se convierte en el anión
de la amida, por ejemplo mediante metóxido sódico o hi-
20 druro sódico en un disolvente inerte adecuado como tetra-
hidrofurano. Este anión se hace reaccionar con un isocia-
nato $R-NCO$, donde R es CH_3OCH_2- , $CH_3O(CH_2)_3-$,  o -
Esta reacción proporciona el anion del producto: el producto
se obtiene por acidulación en un medio acuoso.

25 En la segunda de estas dos vías, una amina $R-NH_2$ se

1 convierte en la correspondiente urea mediante un cianato
 como cianato potásico y la urea se hace reaccionar con
 ácido cianoacético y anhídrido acético para dar una ciano-
 acetilurea de fórmula general:



10 Este producto intermedio se convierte después en
 la oxima con nitrito sódico o un nitrito de alquilo adecua-
 do, por métodos conocidos en la técnica. El grupo hidroximi-
 nino es alquilado por métodos conocidos, por ejemplo por
 conversión en la sal sódica con metóxido sódico, empleando
 dimetilformamida como disolvente y agregando el agente alqui-
15 lante apropiado. Los agentes alquilantes adecuados son los
 yoduros y bromuros de alquilo. También pueden utilizarse los
 sulfatos de dialquilo.

20 Los compuestos de esta invención son útiles como
 agentes de control de las enfermedades de las plantas. La
 mayoría presentan propiedades de acción sistémica y curati-
 va cuando se aplican al terreno, a los trozos de propagación,
 a los tallos o al follaje. Las combinaciones con otros fungi-
 cidas, especialmente con los que poseen intensas propiedades
 residuales, proporcionan un control de la enfermedad especial-
25 mente excepcional. Los efectos sistémico y curativo de los
 agentes de control de las enfermedades de esta invención

1 constituyen una contribución única a estas combinaciones.
Por esta razón, se prefieren con frecuencia las composicio-
nes que contienen otro fungicida junto con un compuesto de
esta invención. La propiedad sistémica de los compuestos
5 de esta invención es sorprendentemente evidente en el con-
trol de la enfermedad llamada añublo tardío de la patata
y del tomate sobre el follaje, cuando los tratamientos con
los compuestos se aplican exclusivamente al sistema de raíces.
Otra evidencia adicional es la proporcionada por la acción
10 curativa contra las infecciones establecidas por el agente
causal de la enfermedad añublo tardío o mildiú veloso de
las uvas. La enfermedad puede ser detenida incluso cuando
los tratamientos se retrasan hasta horas después de que las
plantas hayan sido infectadas.

15 De los hongos que producen enfermedades en los culti-
vos económicos, los más virulentos son los clasificados como
Phycomycetes. Los trastornos causados por este grupo de hon-
gos son el añublo tardío del tomate y de la patata así como
el mildiú veloso de la uva, de las coles, de las legumbres
20 y de las cucurbitáceas. Las enfermedades causadas por
Phycomycetes son especialmente susceptibles al control por
los compuestos de esta invención.

25 Los compuestos de esta invención proporcionan protec-
ción contra los daños causados por ciertos hongos cuando se
aplican en el punto apropiado por los métodos descritos más

1 adelante y en la proporción suficiente para ejercer el efec-
to deseado. Son adecuados para la protección de las plantas
vivas por aplicación de los compuestos de la invención al
terreno donde están creciendo o en el que pueden ser sem-
5 bradas o plantadas posteriormente, a las semillas, tubércu-
los, bulbos u otras partes reproductoras de la planta,
antes de la siembra, así como al follaje, tallos y/o frutos.
Las aplicaciones al terreno se realizan con polvos finos,
gránulos, granzas, soluciones, emulsiones o suspensiones.

10 Las proporciones preferidas de aplicación de los com-
puestos de esta invención al terreno en el que las plantas
están creciendo o donde se cultivarán oscilan entre 0,5 y
500 ppm en peso del terreno donde las raíces están o estarán
creciendo. Las proporciones de uso más preferidas están com-
15 prendidas entre 1 y 200 partes por millón. Las proporciones
más preferidas están comprendidas entre 5 y 100 ppm. Las pro-
porciones preferidas de aplicación a semillas, tubérculos,
bulbos u otras partes reproductoras de la planta oscilan
entre 0,5 y 100 g de compuesto activo de esta invención por
20 kg de material de siembra tratado. Las proporciones más pre-
feridas están comprendidas entre 1 y 75 g de compuesto acti-
vo por kg y todavía mejor entre 2 y 50 g/kg. Las aplicacio-
nes de este tipo se realizan mediante polvos finos, suspen-
siones, emulsiones o soluciones.

25 Las proporciones preferidas de aplicación para los

1 compuestos de esta invención al follaje, tallos y/o frutos
de las plantas vivas oscilan entre 0,05 y 20 kg de ingre-
diente activo por hectárea. Las proporciones más preferi-
das están comprendidas entre 0,1 y 10 kg/Ha y todavía mejor
5 de 0,2 a 5 kg/Ha. La cantidad óptima dentro de estos lími-
tes depende de diversas variables muy conocidas por los ex-
pertos en la técnica de la protección de plantas. Las va-
riables son, aunque sin limitarse a ellas, la enfermedad que
ha de ser controlada, las condiciones atmosféricas esperadas,
10 el tipo de cultivo, la fase de desarrollo del mismo y el in-
tervalo transcurrido entre aplicaciones sucesivas. Puede ser
necesario repetir las aplicaciones dentro de los límites da-
dos una o muchas más veces, a intervalos de 1 a 60 días. Las
aplicaciones se realizan mediante polvos finos, suspensiones,
15 emulsiones o soluciones.

Las composiciones de esta invención, además del ingre-
diente activo de la misma, pueden contener insecticidas, aca-
ricidas, bactericidas, nematocidas, fungicidas u otros pro-
ductos químicos agrícolas convencionales tales como agentes
20 para que cuaje el fruto, compuestos para aclarar los frutos,
ingredientes fertilizantes y similares. Con frecuencia se
prefieren las composiciones con otros fungicidas, especial-
mente con maneb, captafol y chlorthalonil. Los productos quí-
micos agrícolas adicionales se emplean en mezclas o combina-
25 ciones en cantidades que oscilan entre 1 y 20 veces la del

1 compuesto o compuestos de esta invención. La elección apropiada del producto químico adicional y de sus proporciones es fácilmente realizada por el experto en la técnica de protección de las plantas contra la depredación causada por
5 las pestes. Los siguientes compuestos son ilustrativos de los productos químicos agrícolas que pueden ser incluidos en las composiciones de los compuestos de esta invención o que, adicionalmente, pueden ser agregados a las pulverizaciones que contienen uno o más de los compuestos activos de esta
10 invención:
disulfuro de bi(dimetiltiocarbamilo) o disulfuro de tetrametiltiuram (thiram);
sales metálicas de ácido etilen-bi-ditiocarbámico o de ácidos propilen-bi-ditiocarbámicos, v.g. sales de manganeso, cinc, hierro y sodio (maneb o zineb);
15 acetato de n-dodecilguanidina (dodine);
N-(triclorometiltio)ftalimida (folpet);
N-[(triclorometil)tio]-4-ciclohexen-1,2-dicarboxamida (captan);
20 cis-N-[(1,1,2,2-tetracloroetil)tio]-4-ciclohexen-1,2-dicarboximida (cáptafol);
2,4-dicloro-6-(o-cloroanilino)-s-triazina ("Dyrene");
3,3'-etilen-bi(tetrahidro-4,6-dimetil-2H-1,3,5-tiadiazin-2-tiona) (milneb);
25 hidróxido de trifenilestaño (hidróxido de fentin);

- 1 acetato de trifenilestaño (acetato de fentin);
N'-diclorofluormetiltio-N,N-dimetil-N'-fenilsulfamida
(dichlofluamid);
tetracloroisoflotalonitrilo (chlorthalonil);
5 sulfato de cobre tribásico;
cobre fijado;
azufre;
1-(butilcarbamoil)-2-bencimidazolcarbamato de metilo
(benomyl);
10 2-bencimidazolcarbamato de metilo;
1,2-bi(3-metoxicarbonil-2-tioureido)benceno (thiophanate de
metilo).

15 Los productos químicos agrícolas antes citados son
simplemente ilustrativos de los compuestos que pueden mez-
clarse con los compuestos activos de la invención y no se
pretende que en modo alguno la limiten.

El uso de pesticidas en combinación con un compuesto
de esta invención parece algunas veces aumentar considera-
blemente la actividad del compuesto activo de la invención.
20 Algunas veces se observa un grado inesperado de actividad
cuando se emplea otro pesticida junto con los métodos de es-
ta invención.

25 Las formulaciones útiles de compuestos de fórmula (I)
pueden prepararse por métodos convencionales. Comprenden
polvos finos, gránulos, granzas, soluciones, suspensiones,

1 emulsiones, polvos mojables, concentrados emulsionables y
similares. Muchos de ellos pueden ser aplicados directamen-
te. Las formulaciones pulverizables pueden ser diluidas con
5 medios adecuados y utilizadas a volúmenes de pulverización
comprendidos entre algunos litros y varios centenares de li-
tros por hectárea. Las composiciones de gran concentración se
utilizan fundamentalmente como intermediarios para otras for-
mulaciones. En sentido amplio, las formulaciones contienen
alrededor de 1 a 99 % en peso de ingredientes activos y por
10 lo menos uno de los siguientes ingredientes: a) alrededor de
0,1 a 20 % de agentes tensoactivos y b) alrededor de 5 a 99 %
de diluyentes sólidos o líquidos. Más específicamente, contie-
nen estos ingredientes en las siguientes proporciones aproxi-
madas:

15

	Porcentaje en peso		
	<u>Ingrediente activo</u>	<u>Diluyentes</u>	<u>Agentes tensoactivos</u>
Polvos mojables	20-90	0-74	1-10
20 Suspensiones oleosas, emul- siones y soluciones (incluidos los concen- trados emulsionables)	5-50	40-95	0-15
Suspensiones acuosas	10-50	40-84	1-20
Polvizo finos	1-25	70-99	0- 5
Gránulos y granzas	1-95	5-99	0-15
25 Composiciones concentradas	90-99	0-10	0- 2

Naturalmente, pueden utilizarse proporciones in-

1 feriores o superiores de ingrediente activo, de acuerdo con
el uso pretendido y las propiedades físicas del compuesto.
Algunas veces es conveniente emplear proporciones mayores
de agente tensoactivo a ingrediente activo y se consiguen
5 mediante la incorporación a la formulación o mezclando en tan-
ques. Análogamente, pueden incorporarse o mezclarse en tanque
aceites y humectantes.

 Los diluyentes sólidos típicos están descritos en la
obra de Watkins y colaboradores, "Handbook of Insecticide
10 Dust Diluents and Carriers", segunda edición, Dorland Books,
Caldwell, N.J. Se prefieren los diluyentes más absorbentes pa-
ra los polvos mojables y los más densos para los polvos finos.
Los diluyentes y disolventes líquidos típicos están descritos
en la obra de Marsden, "Solvents Guide", segunda edición,
15 Interscience, New York, 1950. Se prefiere una solubilidad infe-
rior a 0,1 % para los concentrados en suspensión; los concen-
trados en solución deben ser preferiblemente estables contra
la separación de fases a 0°C. En la obra "McCutcheon's Deter-
gents and Emulsifiers Annual", MC Publ.Corp., Ridgewood, New
20 Jersey, así como en la de Sisely y Wood, "Encyclopedia of
'Surface Active Agents", Chemical Publ.Co., Inc., New York,
1964, se encuentran listas de agentes tensoactivos y aplicacio-
nes recomendadas. Todas las formulaciones pueden contener can-
tidades minoritarias de aditivos para reducir la espuma, apel-
25 mazamiento, corrosión, crecimiento microbiológico, control

1 del pH, etc. Preferiblemente, los ingredientes deben ser
aprobados por la U.S. Environmental Protection Agency para el
uso pretendido.

5 Los métodos de preparación de estas composiciones son
muy conocidos. Las soluciones se preparan simplemente mezclan-
do los ingredientes. Las composiciones sólidas finas se prepa-
ran mezclando y habitualmente moliendo, por ejemplo en un mo-
lino de martillos o fluído. Las suspensiones se preparan mo-
liendo en mojado (véase, por ejemplo, la patente estadouniden-
se 3.060.084 de Littler). Los gránulos y granzas pueden pre-
pararse rociando el material activo sobre vehículos granulados
preformados o por técnicas de aglomeración. Véase J.E. Browning,
10 "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de Diciembre de 1967,
pág. 145 ff. y "Perry's Chemical Engineer's Handbook", cuarta
edición, McGraw-Hill, N.Y., 1963, págs. 8-59 ff.

15 Para más información relativa a las formulaciones,
véanse, por ejemplo, las siguientes referencias;

J.B. Buchanan, patente estadounidense 3.576.834, 27 de
Abril de 1971, columna 5, línea 36 a columna 7, línea
20 70, y Ejemplos 1-4, 17, 106, 123-140.

R.R. Shaffer, patente estadounidense 3.560.616, 2 de
Febrero de 1971, columna 3, línea 48 a columna 7, lí-
nea 26 y Ejemplos 3-9, 11-18.

25 E. Somers, "Formulation", capítulo 6 en Torgeson,
"Fungicides", volumen I, Academic Press, New York, 1967.

1 calienta a reflujo durante 2 horas. Después se enfría en hielo
y el producto se precipita por adición de agua de hielo. Des-
pués de filtrar, lavar con agua y éter y secar, el producto
5 pesa 3,8 g. Por recristalización en alcohol absoluto se obtie-
nen 3,2 g de 2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-2-metoxi-imino-
acetamida, p.f. 181,5-182,5°.

EJEMPLO 2

Preparación de 2-ciano-N-ciclopropilmetilcarbamoil-2-metoxi- iminoacetamida

10 Se disuelven 50 g de hidrocioruro de ciclopropilmetil-
amina (Columbia Organic Chemicals Co.) en 160 ml de agua. Se
añaden poco a poco y agitando 57 g de cianato potásico con agi-
tación. Después la solución se calienta durante 3 horas en un
baño de vapor. La mezcla se concentra a vacío hasta sequedad
15 y el residuo sólido se extrae exhaustivamente con etanol abso-
luto hirviendo. Los extractos combinados se concentran a vacío
y se aíslan las sucesivas cosechas de la ciclopropilmetilurea
deseada, p.f. 116-8°. Rendimiento: 27,5 g.

20 Se agitan y se calientan en un baño de vapor 26 g de
la urea anterior con 21,4 g de ácido cianoacético y 46 ml de
anhídrido acético, durante una hora. Se produce cierto despren-
dimiento de calor cuando la temperatura de la mezcla llega a
85°. Después la mezcla se enfría, se filtra, se lava con éter
y se seca. El rendimiento es de 26 g, p.f. 156-8°.

25 Se suspenden 24 g de la cianoacetilurea anterior en

1 100 ml de ácido acético. La suspensión se agita a unos 15°
y se añade gota a gota una solución de 16,5 g de NaNO_2 en
24 ml de agua, Después de agitar durante la noche a la tempe-
ratura ambiente, la suspensión espesa se trata gota a gota
5 con 11 ml de ácido clorhídrico concentrado mientras se en-
fría. El compuesto hidroxí-imino deseado se recoge en un fil-
tro, se lava con agua de hielo y éter y se seca. El rendimien-
to es de 25 g de 2-ciano-N-ciclopropilmetilcarbamoil-2-hidroxí-
iminoacetamida que funde a 200-2°.

10 Se disuelven 3,1 g de la oxima anterior en 25 ml de
acetona. Se añaden 1,2 g de carbonato potásico anhidro pul-
verizado y 1,7 ml de sulfato de dimetilo y la mezcla se agi-
ta y se calienta a reflujo durante 2 horas. El producto pre-
cipita por adición de agua de hielo a la mezcla de reacción
15 enfriada. Después de filtrar, lavar con agua de hielo y éter
y secar, el producto pesa 2,4 g. Después de recristalizar en
etanol absoluto, el producto, 2-ciano-N-ciclopropilmetilcar-
bamoil-2-metoxi-iminoacetamida, pesa 2,2 g y funde a 148,5-
149°.

20 Los siguientes compuestos pueden prepararse de forma
similar:

2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-2-etoxi-iminoacetamida, p.f.

136,5-138° y

2-ciano-N-ciclopropilmetilcarbamoil-2-etoxi-iminoacetamida.

25

1

EJEMPLO 3

Preparación de 2-ciano-2-metoxi-imino-N-(metoximetilcarbamoil)

:: acetamida

5 A una suspensión de 2,70 g de 2-ciano-2-metoxi-imino-
acetamida en 10 ml de tetrahidrofurano se añaden 1,20 g de
una suspensión al 55 % de hidruro sódico en aceite mineral,
poco a poco y agitando. Después de agitar durante 15 minutos,
se añaden gota a gota 2,40 g de isocianato de metoximetilo.
La mezcla se agita a 50°C durante 3 minutos para asegurar que
10 la reacción es completa. Después la mezcla se enfría en un
baño de hielo y se añade rápidamente y agitando una solución
de 1,9 ml de ácido acético en 120 ml de agua de hielo. Des-
pués de agitar durante 25 minutos más, se recoge la 2-ciano-2-
metoxi-imino-N-metoximetilcarbamoilacetamida en un filtro, se
15 lava con agua y éter y se seca. El producto pesa 2,7 g y fun-
de a 163,5-165°C.

EJEMPLO 4

Preparación de 2-ciano-2-metoxi-imino-N-(3'-metoxipropil)car-

bamoilacetamida

20

Se prepara 3-metoxipropilurea a partir de metoxipropil-
amina y cianato potásico. Se mezclan 76 g de este producto con 43
g de ácido cianoacético y 100 ml de anhídrido acético. La mezcla
se agita y se calienta en un baño de vapor. Cuando la tempera-
tura de la mezcla llega a 85°C, se desprende calor de reacción
25 y se aplica refrigeración externa para mantener la temperatura

1 bajo control. Después de agitar durante una hora en el baño de vapor, se enfría la mezcla. La cianoacetilurea se recupera por filtración, lavado con agua y secado. Rendimiento: 67,5 g, p.f. 128,5-130,5°.

5 Se suspenden 70 g de la urea anterior en 560 ml de ácido acético. Se enfría la suspensión a 5-10°C y se añade lentamente y agitando una solución de 42 g de nitrito sódico en 65 ml de agua. Después de agitar durante la noche, se añaden lentamente 35 ml de ácido clorhídrico y la solución se
10 concentra a vacío a sequedad. El residuo se tritura con un volumen aproximadamente igual de agua y se enfría en hielo. La 2-ciano-2-hidroxi-imino-N-(3'-metoxipropil)carbamoilacetamida se obtiene por filtración, lavado con agua de hielo y secado y es suficientemente pura para ser utilizada en la siguiente etapa.
15

 Se disuelven 4,5 g del compuesto hidroxí-imino en 25 ml de acetona y se añaden 1,6 g de carbonato potásico anhidro pulverizado y 2,2 ml de sulfato de dimetilo. La mezcla se calienta a reflujo y se agita durante 2 horas. Después se enfría
20 en hielo y se trata con agua de hielo. Precipita el producto que se filtra, se lava con agua y éter y se seca. Rendimiento: 4 g, p.f. 126-127°.

EJEMPLO 5

25 La 2-etoxi-imino-2-cianoacetamida puede prepararse por reacción de 2-ciano-2-hidroxi-iminoacetamida con un agente eti-

1 lante como sulfato de dietilo, en presencia de una base como
carbonato potásico, en un disolvente inerte como acetona. Por
reacción de la 2-etoxi-imino-2-cianoacetamida con isocianato
de metoximetilo por el método del Ejemplo 3, puede prepararse
5 2-ciano-2-etoxi-imino-N-metoximetilcarbamoilacetamida, p.f.
124-125°C.

EJEMPLO 6

Siguiendo el método del Ejemplo 4, haciendo reaccio-
nar 2-ciano-2-hidroxi-imino-N-(3'-metoxipropil)carbamoilacetami-
10 da con sulfato de dietilo, puede prepararse 2-ciano-2-etoxi-imi-
no-N-(3'-metoxipropil)carbamoilacetamida.

EJEMPLO 7

Un preparado en polvo mojable puede obtenerse y aplicar-
se como sigue:

15

	<u>Porcentaje</u>
2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-2- metoxi-iminoacetamida	50
alquilnaftalensulfonato sódico	2
metilcelulosa de baja viscosidad	2
20 tierra de diatomeas	46

20

Los ingredientes se mezclan, se muelen groseramente a
martillos y después se muelen al aire para producir partículas
de ingrediente activo, prácticamente todas ellas por debajo
de 20 micras de diámetro. El producto se vuelve a mezclar
antes de envasarlo.
25

Todos los compuestos de la invención pueden ser for-

1 mulados de manera análoga.

Este preparado se dispersa en agua en una cantidad suficiente para dar una concentración de 400 ppm de compuesto activo de esta invención. La dispersión se pulveriza hasta chorrear sobre unas plantas de tomate en macetas y se deja
5 secar. Tanto las plantas tratadas como las no tratadas se inoculan con una suspensión de esporas de Phytophthora infestans y se incuban durante un día en una cámara saturada de humedad. Al cabo de 5 días de incubación adicional en el invernadero,
10 todos los tomates no tratados han muerto debido a la enfermedad añublo tardío. Las plantas tratadas con una concentración de 400 ppm están sanas con pocos síntomas de enfermedad. Los compuestos N-ciclopropilmetílico, N-metoximetílico o N-metoxi-propílico pueden sustituir a la 2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-
15 2-metoxi-iminoacetamida con resultados similares.

EJEMPLO 8

El preparado del Ejemplo 7 puede mezclarse en un tanque de pulverización con el fungicida benomyl. Este preparado puede diluirse hasta una concentración de 500 ppm de
20 ingrediente activo. El benomyl en la mezcla debe encontrarse a una concentración de 100 ppm. Pueden aplicarse pulverizaciones hasta chorrear, cada semana durante la temporada de desarrollo, a un campo de pepinos expuesto a infección por el hongo del mildiú vellosa (Pseudoperonospora cubensis),
25 el hongo del mildiú pulverulento (Erysiphe chichoracearum),

1 y el hongo del añublo del tallo gomoso (Mycosphaerella
citrullina). Las plantas pulverizadas con esta mezcla son
sanas y producen una cosecha normal mientras que las plantas
no pulverizadas están dañadas por uno o más de los hongos
5 citados.

EJEMPLO 9 .

Unas plantas de tomate cultivadas en macetas en inver-
nadero se inoculan pulverizándolas con una suspensión de espo-
ras de P. infestans. Se incuban en una cámara saturada de hu-
medad a 20°C durante 20 horas. Las plantas de tomate infecta-
10 das se sacan de la cámara de incubación con el tiempo sufi-
ciente para pulverizarlas con diversos agentes de control de
la enfermedad. Los compuestos citados más adelante se dispersan
a una concentración de 400 ppm de ingrediente activo. Se pul-
15 verizan tres plantas infectadas con dispersión suficiente para
chorrear sobre las plantas secas. Después del tratamiento, las
plantas se introducen en un invernadero durante 5 días más
de incubación. Las plantas no tratadas mueren a causa de la
enfermedad añublo tardío. Las plantas tratadas se clasifican
20 con respecto al porcentaje de follaje que está sano (porcenta-
je de control de la enfermedad). La acción curativa de los
compuestos de esta invención se pone de manifiesto en la si-
guiente tabla:

25

1	<u>Compuesto</u>	<u>Porcentaje de control de la enfermedad</u>
	2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-2-metoxi-iminoacetamida	100
	2-ciano-2-metoxi-imino-N-metoximetilcarbamoilacetamida	96
5	2-ciano-N-ciclopropilmetilcarbamoil-2-metoxi-iminoacetamida	100
	2-ciano-2-metoxi-imino-N-metoxipropilcarbamoilacetamida	99
	control de tratamiento con agua	0

EJEMPLO 10

10 Un preparado en polvo mojable puede obtenerse como sigue:

	<u>Porcentaje</u>
2-ciano-N-ciclopropilcarbamoil-2-etoxi-iminoacetamida	80
15 alquilnaftalensulfonato sódico	2
ligninsulfonato sódico	2
sílice amorfa sintética	3
caolinita	13

20 Los ingredientes pueden mezclarse íntimamente, pasarse por un molino de martillos para producir un tamaño promedio de partícula inferior a 40 micras, mezclarse de nuevo y tamizarse a través de un tamiz n° 50 de las Normas Estadounidenses (aperturas de 0,3 mm) antes de embalarlo.

25 Este preparado puede aplicarse como sigue: se selecciona un campo de patatas donde hay una infección uniforme pe-

1 ro ligera del añublo tardío y en el que el follaje más anti-
guo de cada planta contiene una o dos lesiones de
Phytophthora infestans esporulante. El daño producido a la
planta en este momento debe ser ligero pero las posibilidades
5 de propagación de la enfermedad pueden ser grandes. Se esta-
blecen unas parcelas de 5 surcos de anchura y 20 m de longitud.
Los tratamientos se asignan a las diversas parcelas al azar
por todo el campo, dejando gran parte del campo sin tratar co-
mo tampones entre las parcelas tratadas. Se selecciona una
10 serie de tratamientos para la aplicación inmediatamente des-
pués de que se hayan producido las condiciones atmosféricas
que conducen a la propagación de la enfermedad. Entre estos
tratamientos se incluye el preparado de este ejemplo dispersa-
do en agua a una concentración de 300 ppm de ingrediente acti-
15 vo. Otros tratamientos deben incluir una representación de fun-
gicidas comerciales como maneb, captáfol y chlorothalonil, apli-
cados en la proporción de uso recomendada. Además de estas
aplicaciones de compuestos individuales, se aplican combina-
ciones del preparado de este ejemplo con cada uno de los fun-
20 gicidas comerciales en proporciones iguales a la mitad de las
proporciones utilizadas cuando el producto se emplea solo. Las
aplicaciones por pulverización se realizan inmediatamente des-
pués de una lluvia nocturna que tiene la posibilidad de propa-
gar la enfermedad. Al cabo de una o dos semanas, el follaje no
25 tratado en este campo será completamente destruido por

1 el añublo tardío. Las parcelas que reciben los tratamientos
de fungicidas comerciales están gravemente dañadas y desfolia-
das en un 80 % aproximadamente. Las parcelas que reciben el
preparado de este ejemplo están protegidas del añublo tardío
5 y sólo ligeramente desfoliadas. Las parcelas que reciben la
combinación del preparado de esta invención más un fungicida
comercial son sanas y están libres de enfermedad activa. Pue-
den emplearse los demás compuestos de esta invención con resul-
tados similares.

10

EJEMPLO 11

Puede prepararse un polvo mojable como sigue:

	<u>Porcentaje</u>
2-ciano-2-metoxi-imino-N-metoximetilcarba- moilacetamida	80
15 dioctilsulfosuccinato sódico	1
ligninsulfonato sódico	2
atapulgita	17

20

Los ingredientes se mezclan y se pasan por un molino de
martillos provisto de un tamiz grueso. Después de mezclar de
nuevo, se muele finamente en un molino de martillos y se envasa.

25

Unas cepas de uva cultivadas en invernadero se inoculan
rociándolas con una suspensión de esporas de Plasmopara viticola,
mildíu velloso. Al cabo de 20 horas de incubación en una cáma-
ra saturada de humedad a 20°C, seis de las plantas se pulveri-
zan hasta chorrear con el preparado anterior dispersado en agua
hasta una proporción de 100 ppm de ingrediente activo. Se reali-

1 zan tratamientos con maneb a 2000 ppm de ingrediente activo
sobre plantas similares. Al cabo de 2 semanas de incubación
en un invernadero, las plantas no tratadas y las plantas tra-
tadas con maneb están gravemente infectadas por el mildiú ve-
5 lloso (alrededor del 90 % de las hojas susceptibles están in-
fectadas). Las plantas tratadas con el preparado anterior es-
tán exentas de enfermedad, poniendo de manifiesto su efecto
curativo.

EJEMPLO 12

10.	<u>Polvo mojable</u>	<u>Porcentaje</u>
	2-ciano-N-(3'-metoxipropil)carbamoil-2-me- toxi-iminoacetamida	40
	dioctilsulfosuccinato sódico	1,5
	ligninsulfonato sódico	3
	metilcelulosa de baja viscosidad	1,5
15	atapulgita	54

Los ingredientes se mezclan bien, se pasan por un mo-
lino de aire para producir un tamaño promedio de partícula
inferior a 15 micras, se mezclan de nuevo y se tamizan por
un tamiz del n°50 de las normas estadounidenses (aperturas
20 de 0,3 mm) antes de envasarlo.

Todos los compuestos de la invención pueden ser formu-
lados de la misma manera.

EJEMPLO 13

25	<u>Polvo mojable</u>	<u>Porcentaje</u>
	2-ciano-N-metoximetilcarbamoil-2-metoxi- iminoacetamida	80

1	<u>Polvo mojable</u>	<u>Porcentaje</u>
	alquilnaftalensulfonato sódico	2
	ligninsulfonato sódico	2
	sílice amorfa sintética.	3
5	caolinita	13

Los ingredientes se mezclan y después se pasan por un molino de martillos para producir un 95 % de partículas menores de 44 micras (tamiz n°325 de las normas estadounidenses). Después de tamizar por un tamiz con aperturas de 0,3 mm (n°50), el producto se envasa.

EJEMPLO 14

	<u>Suspensión oleosa</u>	<u>Porcentaje</u>
	2-ciano-N-metoximetilcarbamoil-2-metoxi- iminoacetamida	25
15	hexaoleato de polioxietilensorbitol	5
	aceite hidrocarbonado altamente alifático	70

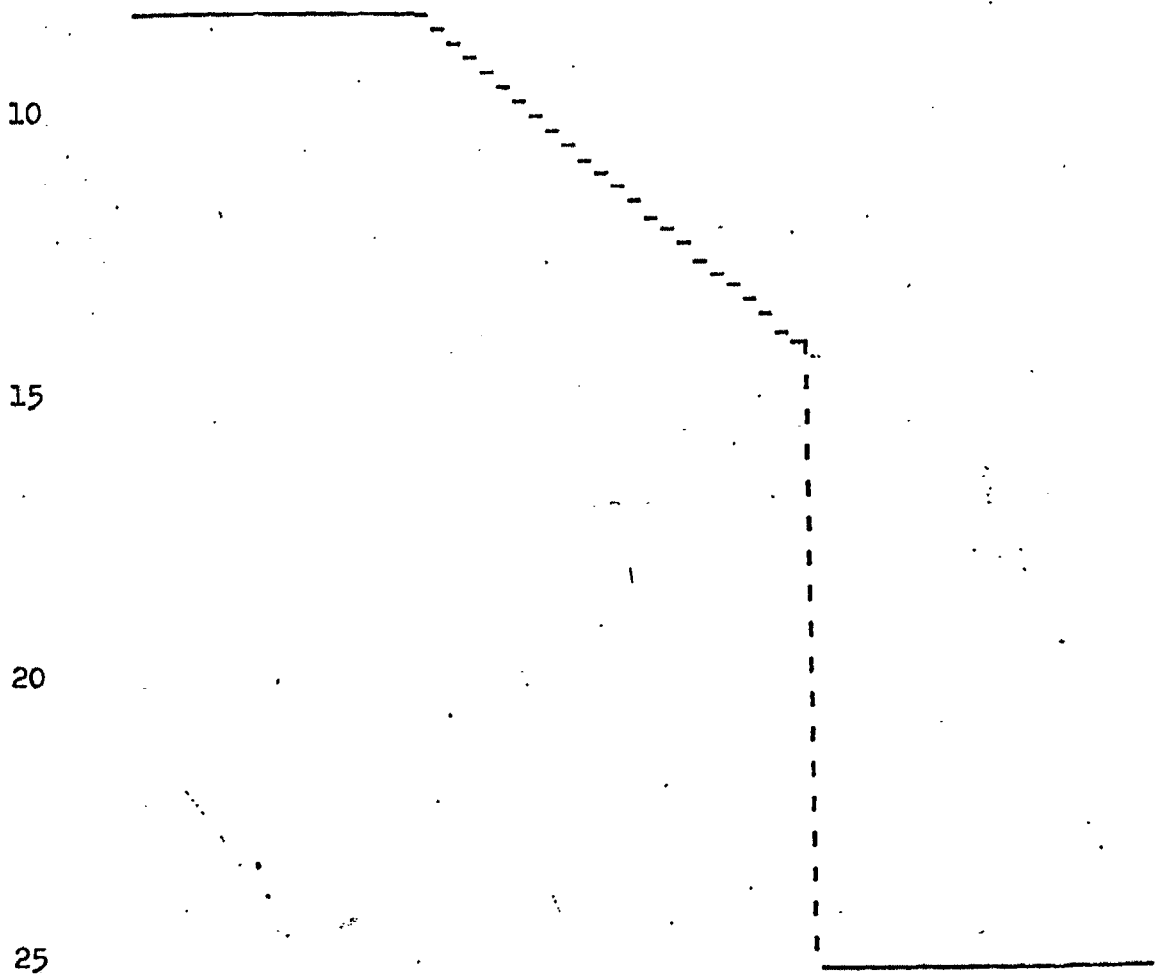
Los ingredientes se muelen juntos en un molino de arena hasta que las partículas sólidas han sido reducidas a un tamaño inferior a unas 5 micras. La suspensión espesa resultante puede ser aplicada directamente pero preferiblemente después de haber diluido con aceites o emulsionado con agua.

EJEMPLO 15

	<u>Polvo fino</u>	<u>Porcentaje</u>
	2-ciano-N-metoxipropilcarbamoil-2-metoxi- iminoacetamida	10
25	atapulgita	10

1	<u>Polvo fino</u>	<u>Porcentaje</u>
	pirofilita	80

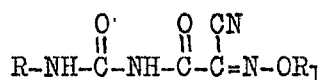
El ingrediente activo se mezcla con atapulgita y después se pasa por un molino de martillos para producir partículas prácticamente todas menores de 200 micras. El concentrado molido se mezcla después con pirofilita pulverizada hasta que la mezcla es homogénea.



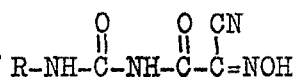
1 En resumen, la Patente de Invención que se solicita de
berá recaer sobre las siguientes:

REIVINDICACIONES

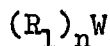
5 1. Un procedimiento para la preparación de nuevos deri
vados de iminoacetamidas, útiles como fungicidas de fórmula:



10 donde R es $\text{CH}_3\text{OCH}_2^-$, $\text{CH}_3\text{O}(\text{CH}_2)_3^-$, ciclopropilo o ciclopropilme
tilo y R_1 es metilo o etilo; cuyo procedimiento se caracteriza
por hacer reaccionar un compuesto de fórmula:



15 donde R es el definido anteriormente, con un compuesto de fór
mula:



donde n es 1 cuando W es halógeno, preferiblemente, yodo o bro
mo, y n es 2 cuando W es sulfato y R_1 es el definido anterior
mente.

20 2. Un procedimiento según la reivindicación 1, donde
 R_1 es metilo.

3. Se reivindica por último como objeto sobre el que -
ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: UN PROCE
DIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVOS DERIVADOS DE IMINOACETA
MIDA.

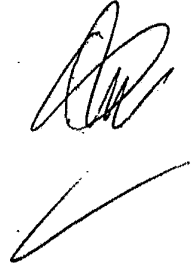
25

1

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de veintinueve páginas mecanografiadas.

5

Madrid, 10 Septiembre 1976
BERNARDO UNGRIA
p.p.



10

15

20

25

