

MINISTERIO DE INDUSTRIA  
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ESPAÑA

10	ES	11	NUMER	451937	12	AI
		21				
		22	FECHA DE PRESENTACION			

PATENTE DE INVENCION

30	PRIORIDADES:	32	FECHA	33	PAIS
31	NUMERO				
	P 25 43 497.3		30 de septiembre de 1.975		Rep. Federal Alemana.
	P 26 30 849.6		9 de julio de 1.976	"	" "

47	FECHA DE PUBLICIDAD	51	CLASIFICACION INTERNACIONAL	62	PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
			CO7D, A01N		

64	TITULO DE LA INVENCION
	Procedimiento para preparar triacín-2,4-diones 1,3- igualmente sustituidas.

71	SOLICITANTE (S)
	PAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

	DOMICILIO DEL SOLICITANTE
	Leverkusen-Bayerwerk, República Federal Alemana.

72	INVENTOR (ES)
	Dr. Helmut Bredereck, Dr. Willi Kantlehner, Dr. Wolfgang Kugel, Dr. Edgar Möhring, Dr. Peter Roessler.

73	TITULAR (ES)

74	AGENCIANTE
	GOMEX-ACEBO.

La presente invención se refiere a un nuevo procedimiento químicamente característico para la producción de nuevas triacín-2, 4-dionas igualmente sustituidas en las posiciones 1 y 3, así como a su empleo como insecticidas.

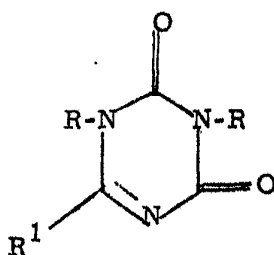
5 Ya se ha dado a conocer que, en la reacción de úrea con éster trietilico de ácido orto-fórmico, se forma triacín-2, 4-diona simétrica no sustituida (H. Bredereck, F. Effenberger, A. Hofmann, Angew. Chemie, Tomo 74, página 354 (1962). Por ese procedimiento, sin embargo, son obtenibles tan solo triacín-10 2, 4-dionas no sustituidas.

Además se ha dado a conocer que, en la reacción de biuretes correspondientemente substituidos con éster trietilico de ácido orto-fórmico, se forman triacín-2, 4-dionas simétricas 1, 3-disustituidas (A. Piskala, J. Gut, Chemical Abstracts, 15 Tomo 56, 4766b). Ese procedimiento, sin embargo, se limita a la producción de las triacín-2, 4-dionas 1, 3-disustituidas y, por consiguiente, no es aplicable universalmente.

Además se ha dado a conocer la preparación de 1, 3, 6-trimetiltriacín-2, 4-diona por alquilación de 6-metil-triacín-20 2, 4-diona mediante sulfato de dimetilo (G. Ostrogovich, M. Safta, Chemical Abstracts, Tomo 78, 84396 y). En ese procedimiento tiene que prepararse primeramente la 6-metil-triacín-2, 4-diona, como material de partida, que es alquilada en una segunda etapa. Ese procedimiento no es satisfactorio en su rendimiento total y no 25 es apropiado para una realización económica.

Además se ha dado a conocer que 1, 3-dimetil-  
triacin-2, 4-diona se forma por transposición térmica a partir de  
2, 4-dimetiloxi-1, 3, 5-triacina (A. Plskala, J. Gut en Chemical  
Abstracts, Tomo 62, 624 g). Sin embargo, el rendimiento de esa  
5 reacción que se desarrolla a 220°C, tampoco es satisfactorio, dado  
que se forman numerosos productos secundarios. Además está limi-  
tada al compuesto indicado y no permite la preparación amplia de  
triacin-2, 4-dionas sustituidas ulteriores. Por consiguiente, tam-  
poco ese procedimiento es apropiado para la producción económica  
10 de triacin-2, 4-dionas sustituidas.

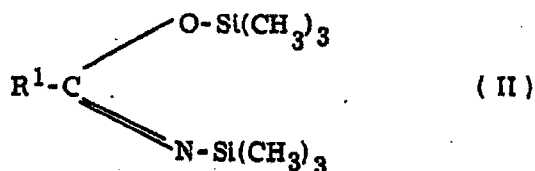
Ahora se ha encontrado que las triacin-2, 4-dio-  
nas-1, 3-igualmente sustituidas de la fórmula ( I )



( I )

en la cual representan

- 15 R alquilo lineal o ramificado con hasta 6 átomos de carbono, al-  
quilo cíclico con 5 a 6 átomos de carbono, naftilo o fenilo even-  
tualmente sustituido una o varias veces por halógeno, nítro,  
alquilo inferior con 1 a 4 átomos de carbono y  
R<sup>1</sup> hidrógeno o alquilo inferior con 1 a 4 átomos de carbono,  
20 son obtenidos, haciéndose reaccionar amidas de ácido carboxílico  
bis-sustituidas de la fórmula general ( II )



en la cual

$\text{R}^1$  tiene el significado arriba indicado,  
con isocianatos de la fórmula general ( III )



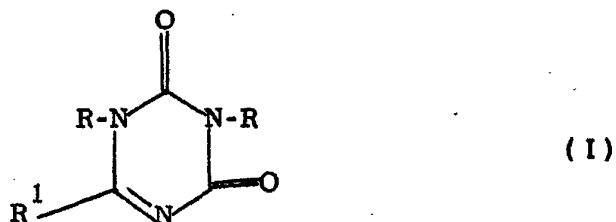
en la cual

R tiene el significado arriba indicado,  
eventualmente en presencia de un diluyente.

La reacción de amidas de ácido carboxílico bis-  
10 sililadas con isocianatos es nueva y da nuevas triacín-2, 4-dionas  
1, 3-igualmente sustituidas. Era sorprendente y no previsible que  
mediante esta reacción pueden prepararse en forma tan sencilla  
con elevado rendimiento las triacín-2, 4-dionas 1, 3-igualmente sus-  
tituidas hasta ahora aún no obtenidas. El procedimiento se distingue  
15 por la elección de compuestos de partida relativamente sencillos y  
de fácil manejo. El procedimiento permite preparar triacín-2, 4-dio-  
nas tanto 1, 3-disustituidas, como también 1, 3, 6-trisustituidas. En  
contraposición con esto, los procedimientos conocidos para la prepa-  
ración de compuestos de este tipo, permiten ya sea tan solo la pre-  
20 paración de los correspondientes compuestos 1, 3-disustituidos o sea  
tan solo la preparación del compuesto 1, 3, 6-trisustituido por metilo.

Además, el procedimiento según la invención da

con buen rendimiento nuevas triacín-2, 4-dionas 1, 3-igualmente  
sustituídas de la fórmula general ( I )



en la cual representan

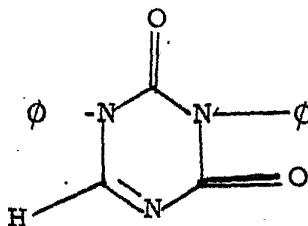
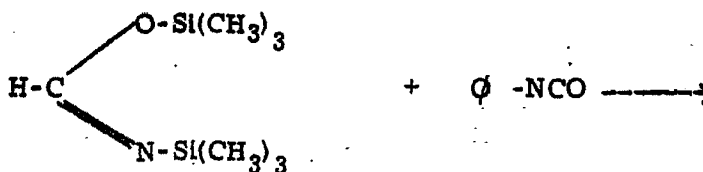
5 R alquilo lineal o ramificado con 2 a 6 átomos de carbono, alquilo  
cíclico con 5 a 6 átomos de carbono, naftilo o fenilo eventual-  
mente sustituido una o varias veces por halógeno, nitro, alquilo  
inferior con 1 a 4 átomos de carbono, y

R¹ hidrógeno o alquilo inferior con 1 a 4 átomos de carbono.

10 Por consiguiente, el procedimiento según la invención permite la  
preparación económica de las nuevas triacín-2, 4-dionas sustituidas.

Además era sorprendente el hecho de que los com-  
puestos obtenibles por el procedimiento según la invención muestran  
una excelente eficacia inhibidora de desarrollo, ya que de los cono-  
cidos compuestos de este tipo tal efecto no era conocido. Era cono-  
cido solamente el hecho de que la 1, 3-dimetiltriacín-2, 4-diona tenía  
15 cierta eficacia bactericida.

Si, como componentes de partida, se emplean  
bis-trimetilsililformamida e isocianato de fenilo, el desarrollo de la  
20 reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmu-  
las:



La estructura de bis-trimetil-sililformamida aún no está terminantemente aclarada. Es imaginable que este compuesto exista también como N,N-bis-trimetilsililformamida.

Las amidas de ácido carboxílico bis-sililadas aplicables según el invento, están definidas por la fórmula general (II). En esta fórmula, R<sup>1</sup> representa preferiblemente hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo e isopropilo. Un compuesto de partida particularmente preferido de la fórmula (II) es la bis-trimetilsililformamida. Los compuestos de la fórmula general (II) son conocidos.

Los isocianatos aplicables según la invención, están definidos por la fórmula general (III). En esta fórmula, R. representa preferiblemente fenilo que puede estar sustituido eventualmente una o varias veces por cloro o metilo y que puede estar sustituido eventualmente por nitro; además representa naftilo. Compuestos de partida particularmente preferidos de la fórmula (III)

son fenilo, 3-clorofenilo e isocianato de 3,4-diclorofenilo. Los compuestos de la fórmula general ( III ) son conocidos.

La reacción según el invento es llevada a cabo con el empleo de diluyentes orgánicos inertes. Como tales entran en consideración hidrocarburos alifáticos, aromáticos o eventual-  
5 mente clorados, por ejemplo benceno, tolueno, xileno, bencina, cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno, así como éteres, tales como éter dietílico, éter dibutílico y dioxano; además, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona,  
10 etilisopropilcetona y metilisobutilcetona; además, nitrilos, tales como acetonitrilo.

La reacción puede ser realizada a la presión normal.

La temperatura de reacción puede variar dentro de márgenes amplios.  
15

Por lo general, se trabaja entre 10 y 150°C, preferiblemente entre 35 y 100°C.

Las sustancias de partida son aplicadas generalmente en la relación molar.

Las sustancias activas, a una buena tolerabilidad por las plantas y a una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, son apropiadas para combatir parásitos de animales, particularmente insectos, arácnidos y nematodos que ocurren en la agricultura, en montes de silvicultura, en el sector de la protección  
20 de provisiones y materiales, así como en el sector de la higiene.  
25

Son eficaces contra clases normalmente sensibles y resistentes, así como contra todos los estados o estados individuales de desarrollo. A los parásitos arriba mencionados pertenecen:

- Del género de isópodos, por ejemplo *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, Porcellio scaber
- 5 del género de diplópodos, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*  
del género de quilópodos, por ejemplo *Geophilus carpophagus*,  
*Scutigera spec.*
- del género de Symphyla, por ejemplo *Scutigera immaculata*
- 10 del género de Thysanura, por ejemplo *Lepisma saccharina*  
del género de Collembola, por ejemplo *Onychiurus armatus*  
del género de ortópteros, por ejemplo *Blatta orientalis*,  
*Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*,  
*Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*
- 15 del género de dermápteros, por ejemplo *Forficula auricularia*  
del género de isópteros, por ejemplo *Reticulitermes spp.*,  
del género de Anoplura, por ejemplo *Phylloxera vastatrix*,  
*Pemphigus spp.*, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.*
- 20 Linognathus  
del género de Mallophaga, por ejemplo *Trichodectes spp.*, *Damolinea spp.*  
del género de tisanópteros, por ejemplo *Hercinothrips femoralis*,  
*Thrips tabaci*
- 25 del género de heterópteros, por ejemplo *Eurygaster spp.*

- Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*,  
*Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.  
del género de homópteros, por ejemplo *Aleurodes brassicae*,  
*Bemisia tabaci*, *trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*,  
5 *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*,  
*Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*,  
*Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum*  
*padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Mephotettix cincticeps*,  
*Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilapar-*  
10 *vata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus*  
spp., *Psylla* spp.  
del género de lepidópteros, por ejemplo *Pectinophora gossypiella*,  
*Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*,  
*Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*,  
15 *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*,  
*Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp.,  
*Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra bra-*  
*ssicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Tri-*  
*choplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp.,  
20 *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*,  
*Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*,  
*Clysis ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*,  
del género de coleópteros, por ejemplo *Anobium punctatum*,  
*Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*,  
25 *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*,

- Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala,  
Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis,  
Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cos-  
mopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica,  
5 Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp.,  
Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus,  
Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agrilotis  
spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solis-  
titalis, Costelytra zealandica  
10 del género de himenópteros, por ejemplo Diprion spp., Hoplocampa  
spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.  
del género de dípteros, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp.,  
Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp.,  
Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp.,  
15 Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys  
spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp.,  
Biblio hortulanus, Oxcinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami,  
Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa  
del género de sifonápteros, por ejemplo Xenopsylla cheopis,  
20 Ceratophyllus spp.,  
del género de arácnidos, por ejemplo Scorpio maurus, Latrodectus  
mactans  
del género de ácaros, por ejemplo Acarus siro, Argas spp.,  
Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phy-  
25 llocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyo-

mma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp.,  
Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia  
praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp.

5 A los nematodos parasitarios de plantas pertenecen:

Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci,  
Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Meloidogyne spp.,  
Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp.,  
Trichodorus spp.

10 Las sustancias activas según el invento, para el mejoramiento y la completación de su espectro de actividad, pueden ser combinadas con otras sustancias activas insecticidas según el empleo premeditado. Para esto se prestan particularmente bien las sustancias activas citadas a continuación, así como  
15 otros representantes de los grupos de sustancias activas caracterizados por estas sustancias activas:

Compuestos orgánicos de fósforo, tales como  
tiofosfato O, O-dimetil-S-isopropil-2-sulfíniletílico = ditiofosfato  
de O, O-dimetil-S-(2-metoxietil-acetamida) (Medithionat),  
20 ditiofosfato O, O-dietil-S-(N-etoxicarbonil-N-metilcarbamoilmetílico (Mecarbam), tiofosfato de S-(5-metoxi-4-piron-2-il-metil)-  
O, O-dimetílico, N-acetil-amido-tiofosfato O, S-dimetílico  
(Acephate), 1-fenil-3-(dietoxi-tiofosforiloxi)-1, 2, 4-triazol  
(Triazophos), O-[6-(3-(2-fenil)-piridacinonil)]-tiofosfato O, O-die-

tílico, 4-dimetoxi-tiofosforiloxi)-2-dietilamino-6-metil-pirimidina (Pirimiphos-Methyl), 4-dietoxi-tiofosforiloxi)-2-dietilamino-6-metil-pirimidina (Pirimiphos-Aethyl), O-(3-cloro-7-metil-2-pirazolo [1,5- $\alpha$ ] pirimidinil)-tiofosfato O,O-dietílico, (Chlorpyrophos), O-(2,4-diclorofenil)-tiofosfato O-etil-S-n-propílico (Dichloropropafos), ditiofosfato O-etil-O-(4-metilmercaptofenil)-S-n-propílico (Mercaptopropafos), amidotiofosfato O-etil-O-(2-carbisopropoxifenil)-isopropílico (Isofenphos), tiolotionato S-clorometil-dietilfosfórico (Chlormephos), ditiofosfato S-(ter-butiltio) metil-O,O-dietílico, tiofosfato de O,O-dietil-O-[O-clorofenil]-gloxilo-nitril-oxima (Chlorphoxim), tiofosfato de O,O-dietil-O-fenilgloxilo-nitril-oxima (Methylphoxim), anhídrido de ácido bis-O,O-dietil-fosfórico (TEPP), fosfonato dimetil (2,2,2-tricloro-1-hidroxi-etílico) (Trichlorfon), fosfato 1,2-dibromo-2,2-dicloroetil-dimetílico (Naled), fosfato 2,2-diclorovinildimetílico (Dichlorvos), fosfato 2-metoxicarbamil-1-metilvinildimetílico (Meviphos), fosfato dimetil-1-metil-2-(metilcarbamoil)-vinílico cis (Monocrotophos), 3-(dimetoxifosfiniloxi)-N,N-dimetil-cis-crotonamida (Dicrotophos), fosfato 2-cloro-2-dietilcarbamoil-1-metilvinildimetílico (Phosphamidon), tiofosfato O,O-dietil-O (o S)-2-(etiltio)-etílico (Demeton), ditiofosfato S-etiltioetil-O,O-dimetílico (Thiometon), ditiofosfato O,O-dietil-S-etilmercaptometílico (Phorate), ditiofosfato O,O-dietil-S-2-etiltioetílico (Disulfoton), tiofosfato O,O-dimetil-S-2-(etilsulfinil)-etílico (Oxydemetonmethyl), ditiofosfato O,O-dimetil-S-(1,2-dicarbetoiletílico) (Malathion), bis-

ditiofosfato de O, O, O, O-tetraetil-S, S'-metileno (Ethion), ditiofosfato O-etil-S, S-dipropílico (Prophos), ditiofosfato O, O-dimetil-S-(N-metil-N-formilcarbamoilmetílico) (Formothion), ditiofosfato O, O-dimetil-S-(N-metilcarbamoilmetílico) (Dimethoat), tiofosfato O, O-dimetil-O-p-nitrofenílico (Parathion-methyl), tiofosfato O, O-dietil-O-p-nitrofenílico (Parathion), tiofosfonato O-etil-O-p-nitrofenilfenílico (EPN), tiofosfato O, O-dimetil-O-(4-nitrom-tolílico) (Fenitrothion), tiofosfato O, O-dimetil-O-2, 4, 5-triclorofenílico (Ronnel), tiofosfonato O-etil-O-2, 4, 5-triclorofeniletílico (Tricloronat), tiofosfato O, O-dimetil-O-2, 5-dicloro-4-bromofenílico (Bromophos), tiofosfato O, O-dimetil-O-(2, 5-dicloro-4-yodofenílico) (Jodofenphos), O-metilamidofosfato 4-ter-butil-2-clorofenil-N-metílico (Crufonat), tiofosfato O, O-dimetil-O-3-(3-metil-4-metilmercaptofenílico) (Fenthion), fosfato isopropilamino-O-etil-O-(4-metilmercapto-3-metilfenílico) (Phenamiphos), tiofosfato O, O-dietil-O-p-(metilsulfinil)-fenílico (Fensulfothion), tiofosfato O-p-(dimetilsulfamido)-fenil-O, O-dimetílico (Famphur), tiofosfato de O, O, O', O'-tetrametil-O, O'-tiodi-p-fenileno, ditiofosfonato O-etil-S-feniletílico (Fonofos), fosfato O, O-dimetil-O-( $\alpha$ -metilbencil-3-hidroxicrotonílico), fosfato 2-cloro-1-(2, 4-diclorofenil) vinil-dietílico (Chlorfenvinphos), fosfato 2-cloro-1-(2, 4, 5-triclorofenil) vinil-dimetílico, tiofosfato O-[2-cloro-1-(2, 5-diclorofenil)]-vinil-O, O-dietílico, tiofosfato O, O-dietílico de fenilgloxilo-nitriloxima (Phoxim), tiofosfato O, O-dietil-O-(3-cloro-4-metil-2-oxo-2-H-1-benzopiran-7-ílico) (Coumaphos), S, S-bis

O,O-dietilditiofosfato de 2,3-p-dioxanditiol (Dioxathion), ditiofosfato 5-[6-cloro-2-oxo-3-benzoxazolinil)-metil]-O,O-dietílico (Phosalon), 2-(dietoxifosfinilimino)-1,3-ditiolano (Phosfolan), ditiofosfato O,O-dimetil-S-[2-metoxi-1,3,4-tiadiazol-5-(4H)-onil-(4)-metílico] (Methidation), ditiofosfato O,O-dimetil-S-ftalimidometílico (Imidan), tiofosfato O,O-dietil-O-(3,5,6-tricloro-2-piridílico) (Chlorpyrifos), tiofosfato O,O-dietil-O-2-piracínílico (Thionazin), tiofosfato O,O-dietil-O-(2-isopropil-4-metil-6-pirimidílico) (Diazinon), tiofosfato O,O-dietil-O-(2-quinoxalílico) (Quinalphos), ditiofosfato O,O-dimetil-S-(4-oxo)-1,2,3-benzotriacín-3(4H)-il-metílico (Azinphosmethyl), ditiofosfato O,O-dietil-S-(4-oxo-1,2,3-benzotriacín-3(4H)-il-metílico) (Azinphosaetyl), ditiofosfato S-[4,6-diamino-s-triacín-2-il)-metil]-O,O-dimetílico (Menazon), tiofosfato O,O-dimetil-O-(3-cloro-4-nitrofenílico) (Chlorthion), tiofosfato O,O-dimetil-O-(o S)-2-(etiltioetílico) (Dameton-S-Methyl), cloruro de 2-(O,O-dimetil-fosforil-tiometil)-5-metoxipiron-4-3,4-diclorobencil-trifenilfosfonio, ditiofosfato O,O-dietil-S-(2,5-diclorofeniltiometílico) (Phenkapton), 5-acinobis (dimetilamido) fosfinil-3-fenil-1,2,4-triazol (Triamifos), N-metil-5-(O,O-dimetiltiofosforil)-3-tiavaleriamida (Vamidotion), tiofosfato O,O-dimetil-S-(metilcarbamoil metílico) (Omethoato), tiofosfonato O-etil-O-(8-quinolinil)-fenílico (Oxinothiophos), amidotiofosfato O-metil-S-metílico (Methamidophos), benzotiofosfonato O-metil-O-(2,5-dicloro-4-bromofenílico) (Phesvel), ditiofosfato O,O-dietil-S-(N-isopropilcarbamoil metílico) (Prothoat), tiofosfato

S, N-(1-cloro-1-metiletíl)-carbamoilmetildietílico (Cyanthoat),  
ditiófosfato S-(2-acetamidoetil)-O, O-dimetílico, tiófosfato O, O-  
dimetil-O-(2-cloro-4-nitrofenílico (Dicaphon), tiófosfato O, O-di-  
metil-O-p-cianofenílico (Cyanox), tiófosfonato O-etil-O-p-ciano-  
5 fenílico, tiófosfato O, O-dietil-O-2, 4-diclorofenílico (Dichlorofen-  
thion), tiófosfato O, O-dietil-O-2, 5-dicloro-4-bromofenílico  
(Bromophos-etil), fosfato dimetil-p-(metiltio)-fenílico, tiófosfato  
O, O-dimetil-O-p-sulfamido-fenílico, tiófosfato O- $\left[ \begin{array}{c} \text{p} \\ \text{---} \end{array} \right]$ -p-(p-clorofe-  
10 nil)-azofenil $\left[ \begin{array}{c} \text{---} \\ \text{---} \end{array} \right]$ -O, O-dimetílico (Azothoat), tiófosfato O, O-dimetil-S-  
p-clorofenílico, ditiófosfato O, O-dimetil-S-(p-clorofeniltiomético)  
(Methylcarbophenothion), ditiófosfato O, O-dietil-p-clorofenilmercap-  
tomético (Carbophenothion), tiófosfato O, O-dietil-S-p-clorofeniltio-  
metético, ditiófosfato O, O-dimetil-S-(carbetoxi-fenilmetético  
(Phenthoato), tiófosfato O, O-dietil-7-hidroxi-3, 4-tetrametilen-cu-  
15 marínico (Coumlthoato), sulfuro de 2-metoxi-4-H-1, 3, 2-benzo-  
dioxafosforina-2, ditiófosfato S-(2-cloro-1-ftalimidoetil)-O, O-di-  
etético (Diallflor), fosfato N-hidroxinaftalimido-dietético, tiófosfato  
O, O-dimetil-O-(3, 5, 6-tricloro-2-piridínico, tiófosfato S-2-(etilsul-  
20 fonil)-etil-dimetético (Dioxydemeton-S-Methyl), ditiófosfato dietil-  
S-2-(etilsulfonil) etético (Ocydisulfoton), anhídrido de ácido bis-O, O-  
dietiltiófosfórico (Sulfotep), fosfato dimetil-1, 3-di (carbometoxi)-  
1-propen-2-ético, fosfonato dimetil-(2, 2, 2-tricloro-1-butirolóxi-  
etético) (Butonato), ditiófosfato dimetil-N-metoximetilcarbamoilme-  
tético (Formocarbam), ditiófosfato O-etil-S, S-difenílico (Ediphen-  
25 phos), fosfato diisopropilaminofluórico (Mipafos), ditiófos -

fato O, O-dimetil-S-(morfolinilcarbamoilmetílico (Morphothion),  
amida octametilpirofosfórica (Schradan), fosfato N, N, N', N'-tetra-  
metildiamidofluórico (Dimetox) amidotiofosfato O-metil-O-(2-car-  
isopropoxifenílico (Isocarbophos), así como nitrofenoles y sus de-  
5 rivados, tales como 4, 6-dinitro-6-metilfenol, sal sódica [dinitro-  
cresol], sal de dinitrobutilfenil (2, 2', 2''-trietanolamina, crotona-  
to de 2-(1-metilheptil)-4, 6-dinitrofenilo (Dinocap), butenoato 2-sec-  
butil-4, 6-dinitrofenil-3-metílico (Binapacryl), carbonato 2-sec-bu-  
til-4, 6-dinitrofenil-isopropílico (Dinobuton), así como diclorodife-  
10 niltricloroetano (DDT), 2, 2-bis-(p-clorofenil)1, 1-dicloroetano  
(TDE), bis-(p-clorofenil)-tricloroetanol (Dicofol), glicolato etil-  
4, 4'-diclorodifenílico (Chlorobenzilate), 4, 4'-diclorobencilato iso-  
propílico (Chloropropylate), 4, 4'-dibromobencilato isopropílico  
(Phenisobromolate), 1, 1, 1-tricloro-2, 2-bis-(p-metoxifenil)-etano  
15 (Metoxychlor), 1, 1-bis-(p-etilfenil)-2, 2-dicloroetano (Perthane),  
bis-(4-clorofenil)-ciclopropilcarbinol (Kilacar), sulfonato de diclo-  
rofenilbenceno (Genite), sulfuro 4-clorofenil-2, 4, 5-triclorofenil-  
azóico (Milbex), sulfito 2-(p-ter-butilfenoxi)-isopropil-2'-cloroetilí-  
co (Aracide), sulfito 2-(p-ter-butilfenoxi)-ciclohexil-2-propinílico  
20 (Omite), 2-fluor-N-metil-N-1-naftilacetamida (Nissol), anilida  
de ácido N-diclorofluormetil-tio-dimetilaminosulfónico (Dichlo-  
fluamid), N-[diclorofluormetil]-tio]-N, N'-dimetil-N-p-tolilsulfa-  
mida (Tolylfluamid), 1, 2-dibromo-3-cloropropano (DBCP), 1, 5-bis-  
(2, 4-dimetilfenil)-3-metil-1, 3, 5-triazapenta-1, 4-dieno (Amitraz),  
25 O-benzoil-3-cloro-2, 6-dimetoxibenzohidroximato etílico (Benzomate),

hidróxido de estaño triciclohexílico (Plictran), 1-triciclohexiles-  
tannil-1, 2, 4-triazol (Triciclazol), torque (Neostanox),  
11-metoxi-3, 7, 11-trimetildodeca-2, 4-dienoato isopropílico  
(Altosid), 3, 7, 11-trimetil-2, 4-dodecadienoato etílico (Altozar),  
5 acetato 2, 2, 2-tricloro-1-(3, 4-diclorofenil)-etanólico (Dichlorfena-  
to), piretrina I, piretrina II, crisantemumato 3-allyl-2-metil-4-oxo-  
2-ciclopenten-1-ílico (Alletrin), crisantemumato 6-cloroiperimlico  
(Barthrin), crisantemumato 2, 4-dibencílico (Dimethrin), crisante-  
mumato 2, 3, 4, 5-tetrahidroftalimidometílico, 6-metil-2-oxo-1, 3-  
10 ditiolo-[4, 5-b]-quinoxalina (Quinomethionato) crisantemum-mono-  
carboxilato de (1)-3-(2-furfuril)-2-metil-4-oxociclopent-2-enilo  
(1)-(cis + trans) (Furethrin), sulfuro de 4-clorobencil-4-fluorfenilo  
(Fluorbenside), 5, 6-dicloro-1-fenoxicarbanil-2-trifluormetil-benz-  
imidazol (Fenazoflor), sulfonato de p-clorofenil-p-clorobenceno  
15 (Ovex), sulfonato de p-clorofenil-benceno (Fenson) p-clorofenil-  
2, 4, 5-triclorofenilsulfona (Tetradifon) sulfuro de p-clorofenil-2, 4, 5-  
triclorofenilo (Tetrasul), sulfuro de clorobencil-p-clorofenilo  
(Chlorobenside), 2-tio-1, 3-ditiolo-(5, 6)-quinoxalina (Thiochinox),  
sulfito prop-2-inil-(4-1-butilfenoxi)-ciclohexílico (Propargil), 1-di-  
20 metil-2-(2'-metil-4'-clorofenil)-formamidina (Chlorphenamidina);  
además úreas, tales como 1-(2, 6-diclorobenzoil)-3-(3, 4-diclorofe-  
nil)-úrea (DU 19 111), 1-(2, 6-diclorobenzoil)-3-(4-clorofenil)-  
urea (pH 6,0-3,8), 1-(2, 6-difluorbenzoil)-3-(4-clorofenil)-úrea  
(pH 6,0-4,0), N-2-metil-4-clorofenil-N', N'-dimetil-tioúrea, y  
25 carbamatos, tales como 2-metiltio-O-(N-metil-carbamoil)-butano

oxima-(3) (Butocarboxim) = Blumi, carbamato (2-etilmercapto-  
metilfenil)-N-metílico (Ethiophencarb), éster metílico de ácido  
1-(dimetilcarbamoil)-N-(metilcarbamoiloxi)-tioformhidroxímico  
(Oxamil) = Vydate), carbamato 2, 2-dimetil-1, 3-benzodioxol-4-il-  
5 N-metílico (Bendoxicarb), carbamato 1-naftil-N-metílico (Carbaril),  
carbamato de 4-dimetilamino-3, 5-xilil-N-metílico, carbamato de  
4-dimetilamino-3, 5-xilil-N-metílico, carbamato 4-dimetilamino-3-  
tolil-N-metílico, (Aminocarb), carbamato 4-metiltio-3, 5-xilil-N-  
metílico (Methiocarb), carbamato 3, 4, 5-trimetilfenil-N-metílico,  
10 carbamato 2-clorofenil-N-metílico (CPMC), 5-cloro-6-oxo-2-nor-  
bornan-carbonitril-O-(metilcarbamoil)-oxima, carbamato 1-(di-  
metilcarbamoil)-5-metil-3-pirazolil-N, N-dimetílico, (Dimetilan),  
carbamato 2, 3-dihidro-2, 2-dimetil-7-benzofuranil-N-metílico  
(Carbofuran), O-(metilcarbamoil)-oxima de 2-metil-2-metiltio-  
15 propionaldehido (Aldicarb), carbamato n-(1-etilpropil)-fenil-N-  
metílico, carbamato 3, 5-di-ter-butil-N-metílico, carbamato n-(1-  
metilbutil) fenil-N-metílico, carbamato 2-isopropilfenil-N-metílico  
(Isoprocab), carbamato 2-sec-butilfenil-N-metílico, carbamato  
3-isopropil-5-metilfenil-N-metílico (Promecarb), carbamato 2-(1, 3-  
20 dioxolan-2-il) fenil-N-metílico (Dioxacarb), carbamato 2-isopropo-  
xilfenil-N-metílico (Arprocab), carbamato 4-dialilamino-3, 5-xilil-  
N-metílico (Allyxicarb), carbamato 2, 3-dihidro-2-metil-7-benzofu-  
ranil-N-metílico (Decarbofuran), carbamato 1-isopropil-3-metilpi-  
razol-5-il-N, N-dimetílico (Isolan), carbamato 2-dimetilamino-5, 6-  
25 dimetilpirimidin-4-il-N, N-dimetílico (Pirimicarb), carbamato 3, 4-

dimetilfenil-N-metílico, carbamato 3-dimetilamino-metilenimino-  
fenil-N-metílico (Formetanate) y sus sales, carbamato 1-metiltio-  
etil-imino-N-metílico (Methomil), hidrocioruro de 1, 3-bis (carba-  
moltio)-2-(N, N-dimetilamino)-propano, carbamato 5, 5-dimetil-  
5 hidrosorcindimetílico, e hidrocarburos clorados, tales como  
3-óxido de 6, 7, 8, 9, 10, 10-hexacloro-1, 5, 5a, 6, 9, 9a-hexahidro-6, 9-  
metano-2, 4, 3-benzodioxatiepina (Endosulfan), alcanfeno clorado  
con 67-69 % de contenido de cloro (Toxaphen), terpenos clorados  
(Strobane), 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 10-decacloro-pentaciclo-[5.2.1.0<sup>2.6</sup>  
10 . 0<sup>3.9</sup> 0.5, 8]-decan-4-ona (Chlordecane), dedecaclorooctahidro-  
1, 3, 4-meteno-2H-ciclobuta-(cd)-pentaleno (Mirex), decacloro-bi-  
2, 4-ciclopentadien-1-ilo (Deklaflor), levulinato de etil-1, 1a, 3, 3a,  
4, 5, 5, 5a, 5b, 6-decaclorooctahidro-2-hidroxi-1, 3, 4-meteno-(2H)-  
ciclobuta [cd]-pentaleno-2 (Kelevan),  $\gamma$ -hexaclorociclohexano  
15 (Gammexane; Lindan;  $\gamma$ HCH), 1, 2, 4, 5, 6, 7, 8, 8-octacloro-3a, 4,  
7, 7a-tetrahidro-4, 7-metilenindano (Chlordan), 1, 4, 5, 6, 7, 8, 8-hep-  
tacloro-3a, 4, 7, 7a-tetrahidro-4, 7-metilenindano (Heptachlor),  
1, 2, 3, 4, 10, 10-hexacloro-6, 7-epoxi-1, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a-octahidro-  
endo-endo-5, 8-dimetanonaftaleno (Endrin); además, feromonas,  
20 agentes sinérgicos, repelentes, sustancias activas vegetales,  
productos de metabolismo de microorganismos, agentes inhibidores  
de desarrollo.

Las sustancias activas pueden ser elaboradas  
en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones,  
, 25 polvos rociables, suspensiones, polvos, preparados de espolvorear,

espumas, pastas, polvos solubles, granulados, aerosoles, concentrados de suspensión-emulsión, polvos desinfectantes de semillas, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con sustancia activa, encapsulaciones finísimas en sustancias polímeras y en  
5 masas de envoltura para semillas; además en formulaciones con elementos de combustión, tales como cartuchos, cajas, espirales y similares de fumigación, así como formulaciones de nieblas frías y calientes para el procedimiento de aplicación de volumen ultrabajo.

10 Estas formulaciones son producidas en forma conocida, por ejemplo mezclándose las sustancias activas con diluyentes, vale decir, disolventes líquidos, gases licuados puestos bajo presión y/o vehículos sólidos, eventualmente con el empleo de agentes tensioactivos, vale decir, agentes emulsionantes y/o dispersantes y/o espumantes. En el caso de la utilización de agua como  
15 diluyente, pueden emplearse, por ejemplo, también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.

Entran en consideración esencialmente, como disolventes líquidos: hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos  
20 o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o parafinas, por ejemplo fracciones de aceite mineral; alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres; cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ci-  
25

clohexanona; disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua;

bajo diluyentes o vehículos gaseosos licuados se entienden tales líquidos que a la temperatura normal y bajo presión normal son gaseosos, por ejemplo gases impelentes de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono;

entran en consideración, como vehículos sólidos: minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos molidos, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos sólidos para granulados: piedras naturales quebradas y fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de material orgánico, tales como aserrines, cáscaras de nueces de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes: emulsivos no iónicos y aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácidos grasos, éteres de polioxietileno y alcoholes grasos, por ejemplo éteres alquilaril-poliglicólicos, sulfonatos alquílicos, sulfatos alquílicos, sulfonatos arílicos así como hidrolizados de albúmina; como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfito y metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse agentes adhesivos, tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales o

sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de latex, tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina y de ftalocianina metálica azóica, y sustancias nutritivas en indicios, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Por lo general, las formulaciones contienen entre 0,1 y 95 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0,5 y 90 %.

La aplicación de las sustancias activas es efectuada en forma de sus formulaciones corrientes en el comercio y/o de las formas de aplicación preparadas de estas formulaciones.

El contenido de sustancia activa de las formas de aplicación preparadas de las formulaciones corrientes en el comercio, puede variar dentro de margenes amplios. La concentración de la sustancia activa en las formas de aplicación puede ser de 0,000 000 1 a 100 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0,01 y 10 % en peso.

La aplicación es efectuada en una forma usual adaptada a las preparaciones de aplicación.

En la aplicación contra parásitos antihigiénicos y de provisiones, las sustancias activas se distinguen por un sobresaliente efecto residual sobre madera y arcilla, así como por una

buena resistencia a álcalis sobre bases encaladas.

A elevadas concentraciones de aplicación, los compuestos según la invención muestran también cierto efecto herbicida.

5 Por los ensayos descritos a continuación, se demuestra el efecto inhibitorio de la metamorfosis de artrópodos de los compuestos según la invención, sin querer hacerse una limitación en cuanto a la amplitud de actividad de estos compuestos. En esto, durante el desarrollo total indicado de los animales de ensayo se  
10 evalúan los cambios morfológicos, tales como animales transformados hasta la mitad en crisálidas, larvas u orugas salidas incompletamente, alas defectuosas, cutícula pupal en insectos totalmente desarrollados, así como la muerte. La suma de las deformidades morfológicas y de la destrucción durante el desarrollo es indicada en %  
15 del número de los animales de ensayo.

Ejemplo 1.

Efecto inhibitorio de la metamorfosis / ensayo de comida

Animales de ensayo: *Plutella maculipennis* (orugas en el cuarto estado de desarrollo) 20 ejemplares

20 *Phaedon cochleariae* (larvas en el cuarto estado de desarrollo) 20 ejemplares

Plantas de forraje: plantas de col (*Brassica oleracea*)

Disolvente: 10 partes en peso de dimetilformamida

25 Emulsivo: 1 parte en peso de monolaurato de polioxietileno-sorbitan.

Para la producción de una preparación adecuada de sustancia activa, se mezclan 2 partes en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada del disolvente y del emulsivo y tanta agua que se forma una mezcla al 1% que es diluida con agua hasta la concentración deseada.

5

Los animales son alimentados con hojas de las plantas de ensayo provistas de un recubrimiento uniforme de rocía de la mezcla de sustancia activa de la concentración elegida, hasta el desarrollo de adultos.

10

Para el contralor, una parte de los animales son alimentados solamente con hojas provistas de disolvente y emulsivo de la concentración indicada. Los resultados constan en la siguiente tabla:

Tabla

15 Efecto inhibitor de metamorfosis / ensayo de comida

Sustancia activa Ejemplo No.	Animales de ensayo: concentración:	Plutella 0,01 %	Phaedon 0,01 %
Testigo		0	0
1, 3, 6-trimetil-1, 3-triacin-2, 4-diona (conocida)		20 %	30 %
14		100 %	100 %
3		60 %	85 %
15		85 %	/
8		100 %	/
25 9		100 %	/

Ejemplo 2.

Efecto inhibidor de metamorfosis / ensayo con *Laphygma*

Animales de ensayo: *Laphygma exigua* (orugas en el cuarto estado de desarrollo)

5 Alimento: discos de 1 cm de espesor y de 3 cm de diámetro de forraje artificial secado al aire que consta de harina de núcleo de habas, levadura, mezcla de vitaminas, polvo de hojas, agar-agar y sustancia de conservación.

Disolvente: 10 partes en peso

10 Emulsivo: 1 parte en peso de monolaurato de polioxietileno (20) sorbitán.

Para la producción de una preparación adecuada de sustancia activa, se mezclan 2 partes en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada del disolvente y del emulsivo y tanta 15 agua que se forma una mezcla al 1 % que es diluída con agua hasta la concentración deseada.

Cada vez un animal de ensayo es colocado sobre un disco de forraje humedecido con 1,5 ml de la solución de sustancia activa de la concentración deseada y es observado hasta la salida del adulto. A un ensayo pertenecen 5 a 10 animales de ensayo. 20 Para el contralor, cada vez un animal de ensayo es colocado sobre un disco de forraje humedecido con 1,5 ml de disolvente y emulsivo de la concentración deseada y es observado hasta la salida del adulto. Los resultados constan en la siguiente tabla:

Tabla

Efecto inhibidor de metamorfosis / ensayo con Laphygma

Sustancia activa Ejemplo No.	Animales de ensayo: concentración:	Laphygma exigua 0,1 %
Testigo		0
5	1, 3, 6-trimetil-triacin-2, 4-diona (conocida)	20 %
	14	100 %
	1	50 %
	3	80 %
10	15	90 %
	8	80 %

Ejemplo 3.

Efecto inhibidor de metamorfosis / ensayo con cénzalos

Animales de ensayo: Aedes aegypti (larvas en el tercer estado de desarrollo) 20 ejemplares

Disolvente: 10 partes en peso

Emulsivo: 1 parte en peso de monolaurato de polioxietileno(20) sorbitan.

Para la producción de una preparación apropiada de sustancia activa, se mezclan 2 partes en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada de disolvente y de emulsivo y con tanta agua que se forma una mezcla que contiene 100 ppm de sustancia activa. Esta mezcla es diluída con agua hasta la concentración deseada.

Los animales de ensayo son colocados en 90 ml

de estas soluciones de sustancia activa y son observados hasta la salida de los insectos totalmente desarrollados. Para el contralor, unos animales son puestos en una mezcla de disolvente y emulsivo con agua de la concentración indicada y son observados hasta la salida de los insectos totalmente desarrollados.

Los resultados constan en la siguiente tabla:

Tabla

Efecto inhibitor de metamorfosis / ensayo con cenzalos

Sustancia activa Ejemplo No.	animales de ensayo concentración	Aedes aegypti 10 ppm
10 Testigo		0
1, 3, 6-trimetil-triacin-2, 4-diona (conocida)		60 %
15 15		80 %
2		100 %
15 14		100 %
3		85 %

Ejemplos de Preparación

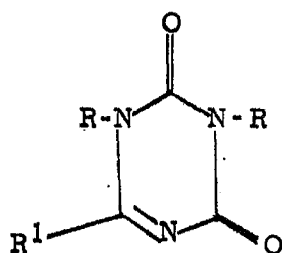
1) Procedimiento para la preparación de 1, 3-difenil-triacin-2, 4-diona.

20 A 23, 8 g (0, 2 moles) de isocianato de fenilo en 50 ml de éter se agregan gota a gota 18, 9 g (0, 1 mol) de bis-trimetilformamida tan rapidamente que el disolvente se encuentra justamente en ebullición. Terminada la reacción, lo que puede ser constatado por el decrecimiento de la producción de calor de la re-

acción exotérmica, se separan por destilación el hexametilsiloxano, formado y el disolvente. Los cristales que quedan, son recristalizados en cloroformo. Se obtienen 22,3 g (84,2 % de la teoría) de 1,3-difenil-triacin-2,4-diona del punto de fusión de 224°C.

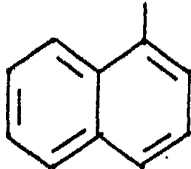





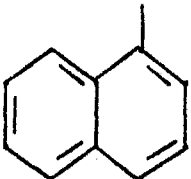
5 Análogamente se preparan:

Tabla I.



Ejemplo	R	R <sup>1</sup>	P.f. °C	rendimiento (%)
2		H	167	69,5
3		H	171	97,4
4		CH <sub>3</sub>	246	88,5
5		CH <sub>3</sub>	245	43,7

10

Ejemplo	R	R <sup>1</sup>	P.f. °C	rendimiento (%)
6		CH <sub>3</sub>	277 (desc.)	69,7
7		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	231	82,9
8		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	225	81,2
5	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	75	97
10		n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	206	67,2
11		n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	212	29,8
12		n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	252	38,4
13		n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	264	38,8

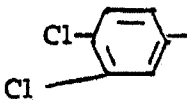
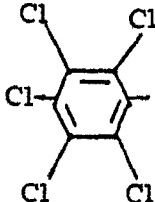
Ejemplo 14.

Preparación de 1, 3-di-p-clorofenil-triacin-2, 4-diona.

A 30, 6 g (0, 2 moles) de isocianato de 4-clorofenilo en 50 ml de benceno se agregan gota a gota 18, 9 g (0, 1 mol) de bis-trimetilsililformamida tan rápidamente que el disolvente se encuentra en ebullición. Terminada la reacción, lo que puede ser constatado por el decrecimiento de la producción del calor de la reacción exotérmica, se separan por destilación el disolvente y el hexametilsiloxano formado. Los cristales que quedan, son recristalizados en cloroformo. Se obtienen 33, 1 g de 1, 3-di-p-clorofenil-triacin-2, 4-diona del punto de fusión de 205°C.

Análogamente se obtienen los siguientes compuestos:

Tabla II.

Ejemplo	R	R'	P.f. °C	rendimiento (%)
15		H	204	92.3
16		H	239	94
17	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	70	90


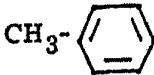
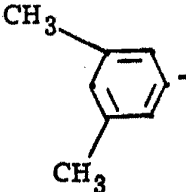
Ejemplo 17.

Preparación de 1, 3-di-n-propil-triacin-2, 4-diona.

A 3, 4 g (0, 04 moles) de isocianato de n-propilo en 5 ml de ligroina se agregan lentamente gota a gota a la temperatura ambiente 3, 78 g (0, 02 moles) de bis-trimetilsililformamida. Subsiguientemente se calienta la mezcla durante 3 horas a 100°C, entonces se la enfria lentamente y se recogen por succión los cristales que quedan. Se obtienen 3, 47 g de 1, 3-di-n-propil-triacin-2, 4-diona del punto de fusión de 90°C.

10 Análogamente se obtienen los siguientes compuestos:

T a b l a III.

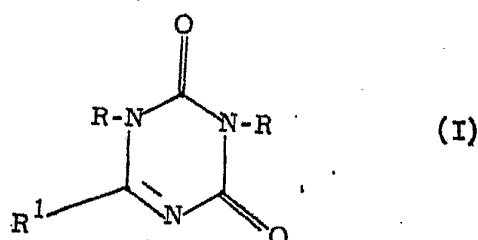
Ejemplo	R	R'	P.f. °C	rendimiento (%)
18	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	89	84
15 19		H	101	79
20		H	180	79
21		H	195	84

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarse en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.

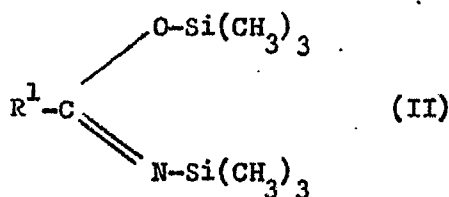
5

REIVINDICACIONES

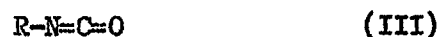
1.- Procedimiento para preparar triacín-2,4-dio-  
nas 1,3-igualmente sustituidas, de fórmula (I)



5 en la que R es alquilo lineal o ramificado con hasta 6 áto-  
mos de carbono, alquilo cíclico con 5 a 6 átomos de carbono,  
naftilo o fenilo eventualmente sustituido una o varias ve-  
ces por halógeno, nitro, alquilo inferior con 1 a 4 átomos  
de carbono y R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquilo inferior con 1 a 4  
10 átomos de carbono, caracterizado porque se hacen reaccionar  
amidas de ácido carboxílico bis-sililadas de fórmula gene-  
ral (II)



15 en la cual R<sup>1</sup> tiene el significado arriba indicado, con iso-  
cianatos de fórmula general (III)



en la cual R tiene el significado arriba indicado, eventual-  
mente en presencia de un diluyente.

20 2.- Procedimiento según la reivindicación 1,  
caracterizado porque la reacción se efectúa a una tempera-

tura entre 0 y 150°C.

3.- Procedimiento para preparar triacin-2,4-dio-  
nas 1,3-igualmente sustituidas, tal y como queda sustan-  
cialmente descrito en la presente Memoria.

5 Esta Memoria consta de 33 hojas escritas a máqui-  
na por una sola cara.

Madrid, 29 SET. 1976

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

GOMEZ ACEBU Y CAÑALES

Apdo. 10, Edificio L. Gran Fortales

