



6 NOV 1977

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

19 ES	11 462092	10 A 1
21	FECHA DE PRESENTACION	
22	2 SET. 1977	

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:	32 FECHA	33 PAIS
31 NUMERO		
P 26 39 748.8	3 de septiembre de 1.976	Rep. Federal Alemana.
P 26 57 772.0	21 de diciembre de 1.976	"
P 27 27 416.4	18 de junio de 1.977	"

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07C // A01N	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
------------------------	--	--------------------------------------

54 TITULO DE LA INVENCION
Procedimiento para la obtención de N-aril-(N'-alquil y N'-cicloalquil)-tioureas.

71 SOLICITANTE (S)
BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
Leverkusen-Bayerwerk, República Federal Alemana.

72 INVENTOR (ES)
Dr. Edgar Enders., Dr. Wilhelm Stendel., Dr. Ingeborg Hammann.

73 TITULAR (ES)

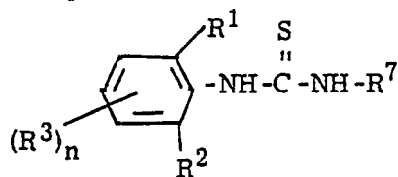
74 REPRESENTANTE
GOMEZ-ACEBO.

El presente invento se refiere a nuevas N-
aril-(N'-alquil y N'-cicloalquil)-tioureas, a un procedimiento para
su producción, así como a su empleo como agentes para la lucha contra
parásitos de animales y plantas, particularmente como ectoparasiticidas
5 insecticidas, fungicidas y acaricidas.

Ya se ha dado a conocer que las N-aril-N'; N'-
dialquiltioureas son eficaces como ectoparasiticidas particularmente
como garrapaticidas contra garrapatas del género Boophilus (véase al
respecto la patente publicada no examinada de la Rep. Fed. de Alemania
10 No. 2.337.122).

En comparación con los compuestos conocidos
y químicamente análogos, las N-aril-(N'-alquil y N'-cicloalquil)-
tioureas según la invención muestran un mejor efecto contra garrapatas
de la especie Boophilus resistentes a los ésteres fosfóricos, así como
15 un efecto secundario insecticida claramente pronunciado que no se
encuentra en los productos de comparación de la patente publicada no
examinada de la Republica Federal de Alemania No. 2.337.122. Además
son eficaces en la agricultura contra insectos nocivos para plantas y
contra ácaros.

20 Ahora fué encontrado que las nuevas N-aril-
(N'-alquil y N'-cicloalquil)-tioureas de fórmula general



en la cual representan

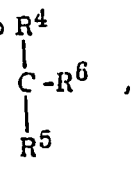
R¹, alquilo (C₁-C₆) ó cicloalquilo (C₃-C₇);

R², alquilo (C₂-C₆) ó cicloalquilo (C₃-C₇);

R³, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇),
cicloalqueno (C₅-C₇) o halógeno;

n, un número entero de 0 a 2, y

5 R⁷, cicloalquilo (C₃-C₁₀) eventualmente sustituido, cicloalqueno
(C₅-C₁₀) eventualmente sustituido o el resto R⁴



en la cual

R⁴ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇),

y R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes y representan alquilo

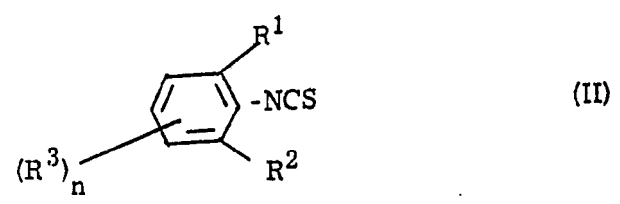
10 (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇),

tienen un fuerte efecto contra parásitos de animales y de plantas, particularmente un efecto ectoparasitida, insectida, fungida y acarida.

Además fué encontrado que se obtienen las nue-

vas N-aril-(N'-alquil y N'-cicloalquil)-tioureas de fórmula (I), si

15 a) isotiocianatos de arilo de fórmula



con aminos de fórmula

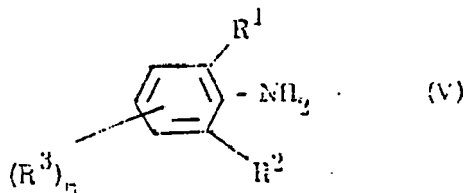


o, alternativamente,

20 b) isotiocianatos de fórmula



con arilaminas de fórmula



en cuyas fórmulas

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y n tienen en cada caso los significados arriba indicados.

5

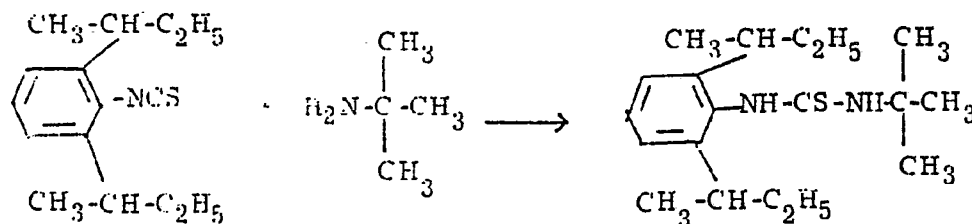
Sorprendentemente, las nuevas N-aril-N'-alquil y N'-cicloalquil)-tioureas según el invento muestran un efecto ectoparasitícida más fuerte que las N-aril-N', N'-dialquil-tioureas químicamente muy análogas de la patente publicada no examinada de la República Federal de Alemania No. 2. 337. 122, y adicionalmente un efecto insecticida, así como un efecto contra ácaros que los compuestos de la precitada patente alemana no tienen.

10

Por consiguiente, los compuestos según la invención representan un enriquecimiento de la técnica.

15

Si según la variante (a) se emplean como sustancias de partida el isotiocianato de 2,6-di-sec-butil-fenilo y la tert-butilamina, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



(Ecuación de reacción A).

20

Si según la variante (b) se emplean como subs-

(Ecuación de reacción D).

En el texto de la solicitud,

R¹, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ significando alquilo (C₁-C₆) representan preferi-
blemente uno de los siguientes restos: metilo, etilo, propilo, isopropilo,
5 butilo, sec-butilo, isobutilo, ter-butilo, pentilo-(2), pentilo-(3), ter-
pentilo, hexilo-(2);

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ significando cicloalquilo (C₃-C₇),
representan preferiblemente uno de los siguientes restos;
ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo;

10 R³ significando halógeno representa preferiblemente cloro, bromo
o flúor, particularmente cloro o bromo;

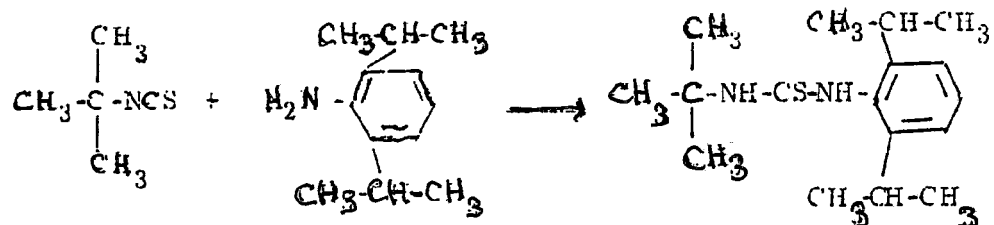
R⁷ significando cicloalquilo eventualmente sustituido (C₃ a C₁₀)
representa eventualmente cicloalquilo (C₃-C₁₀) sustituido
preferentemente con

15 ciclopropilo, 2-metil-ciclopropilo, 1-etil-ciclopropilo, ciclobutilo, 1-
metil-ciclobutilo, 2-metil-ciclobutilo, ciclopentilo, 1-metil-ciclopentilo,
1-etil-ciclopentilo, 2-metil-ciclopentilo, 3-metil-ciclopentilo, ciclo-
hexilo, 1-, 2-, 3- ó 4-metil-ciclohexilo, 2-, 3- ó 4-trifluometil-ciclo-
hexilo, 2- ó 4-etil-ciclohexilo, 2,4- 2,6-, 2,5- ó 3,5-dimetil-ciclohexilo,
20 3,5-bis-trifluometil-ciclohexilo, 4-metil-3-trifluometil-ciclohexilo,
2- ó 4-isopropil-ciclohexilo, 2,4- ó 2,6-dietil-ciclohexilo, cicloheptilo,
ciclooctilo, 1-metil-ciclooctilo,-

Los isotiocianatos de arilo de fórmula general

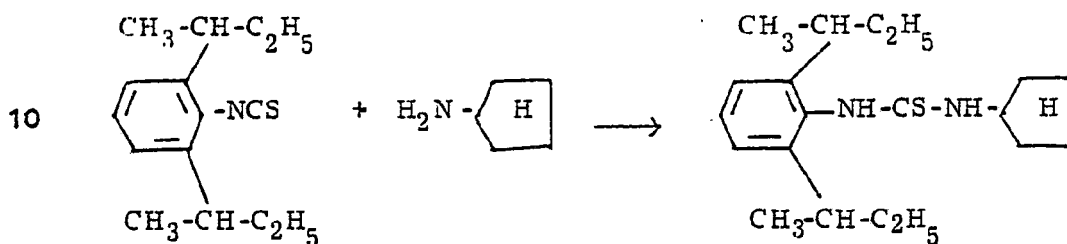
(II) así como los isotiocianatos de alquilo y de cicloalquilo de fórmula
25 general (IV), empleados como compuestos de partida, son conocidos

tancias de partida el isotiocianato de *ter*-butilo y la 2,6-diisopropil-fenilamina, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



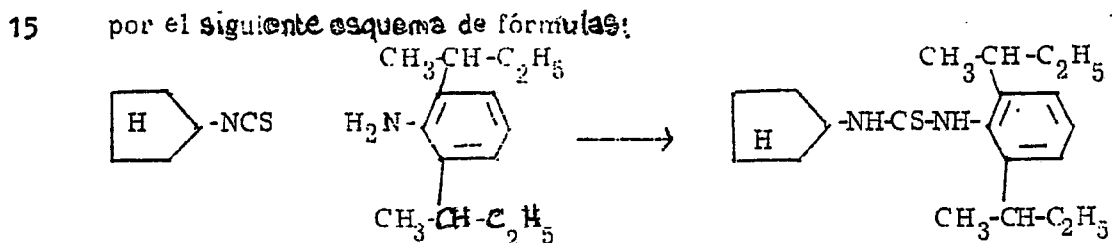
5 (Ecuación de reacción B).

Si según la variante (a) se emplean como sustancias de partida el isotiocianato de 2,6-di-*sec*-butil-fenilo y la ciclopentilamina, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmula:



(Ecuación de reacción C).

Si según la variante (b) se emplean como sustancias de partida el isotiocianato de ciclopentilo y la 2,6-di-*sec*-butil-anilina, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



o pueden ser preparados según métodos conocidos, por ejemplo, por reacción de arilaminas de fórmula general (V) o de alquil o cicloalquilaminas de fórmula general (III) con tiofosgeno; por reacción de sales de ácidos N-aril- o N-alquil- o N-cicloalquil-ditiocarboxílicos con fosgeno o agentes de oxidación, o de halogenuros de alquilo o de cicloalquilo con tiocianatos de metales alcalinos, o a partir de olefinas, y sulfocianuro de hidrógeno (véase : Houben-Weyl, "Methoden der organischen Chemie", Tomo IX, páginas 867-878).

Como compuestos de partida para isotiocianatos de arilo de fórmula general (II) a aplicar según la ecuación de reacción A ~~se~~ citados a título de ejemplo; isotiocianato de 2,6-dimetil-fenilo, isotiocianato de 2-metil-6-etil-fenilo, isotiocianato de 2,6-dietyl-fenilo, isotiocianato de 2-etil-6-isopropil-fenilo, isotiocianato de 2,6-diisopropil-fenilo, isotiocianato de 2,6-di-sec-butyl-fenilo, isotiocianato de 2-metil-6-sec-butyl-fenilo, isotiocianato de 2-etil-6-sec-butyl-fenilo, isotiocianato de 2-isopropil-6-sec-butyl-fenilo, isotiocianato de 2-metil-6-isopropil-fenilo, isotiocianato de 2-metil-6-ciclopentil-fenilo, isotiocianato de 2-etil-6-ciclopentil-fenilo, isotiocianato de 2-isopropil-6-ciclopentil-fenilo, isotiocianato de 2,6-di-ciclopentil-fenilo, isotiocianato de 2-metil-6-ter-butyl-fenilo,

- isotiocianato de 2-etil-6-ter-butil-fenilo,
- isotiocianato de 2-metil-6-ciclohexil-fenilo,
- isotiocianato de 2-etil-6-ciclopentil-fenilo,
- isotiocianato de 2,4-dimetil-6-etil-fenilo,
- 5 isotiocianato de 2,4-dimetil-6-isopropil-fenilo,
- isotiocianato de 2,4-dimetil-6-sec-butil-fenilo,
- isotiocianato de 2,4-dimetil-6-ter-butil-fenilo,
- isotiocianato de 2,4,6-trimetil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-metil-fenilo,
- 10 isotiocianato de 2,6-diisopropil-4-metil-fenilo,
- isotiocianato de 3,5-dimetil-2,6-dietil-fenilo,
- isotiocianato de 3-metil-2,6-dietil-fenilo,
- isotiocianato de 3-cloro-2,6-dietil-fenilo,
- isotiocianato de 2,4,6-triisopropil-fenilo,
- 15 isotiocianato de 2,6-di-(peril-2)-fenilo,
- isotiocianato de 2,4,6-trietil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-propil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-isopropil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-n-butil-fenilo,
- 20 isotiocianato de 2,6-dietil-4-sec-butil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-n-pentil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-ciclopentil-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-pentil-(3)-fenilo,
- isotiocianato de 2,6-dietil-4-(1,1-dimetil-propil)-fenilo,
- 25 isotiocianato de 2,6-dietil-4-(3-metil-butil)-fenilo,

- isotiocianato de 2,6-dietil-4-[3-metil-butyl-(2)]-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-n-hexil-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-alil-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-crotil-fenilo,
5 isotiocianato de 2,6-dietil-4-(2,2-dimetil-vinil)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-hexil-(2)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-hexil-(2)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-hexil-(3)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-(2,2-dimetil-propil)-fenilo,
10 isotiocianato de 2,6-dietil-4-[4-metil-pentil-(3)]-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-(2,3-dimetil-butyl)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-(2-etil-butyl)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-(1-metil-ciclopentil)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-ciclohexil-fenilo,
15 isotiocianato de 2,6-dietil-4-ciclohexen-(1)il-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-(1-metil-ciclohexil)-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-cicloheptil-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-4-fluoro-fenilo,
isotiocianato de 2,6-dietil-3-fluoro-fenilo,

20 Las arilaminas de fórmula general (V) en que se basan los precitados isotiocianatos de arilo pueden ser empleadas alternativamente para la producción de los compuestos de fórmula general (I) según la ecuación de reacción B.

De los isotiocianatos de alquilo y de ciclo-
25 alquilo de fórmula general (IV) sean mencionados a título de ejemplo:

- isocianato de isopropilo,
- isocianato de sec-butilo,
- isocianato de pentilo-(2),
- isocianato de hexilo-(2),
- 5 isocianato de octilo-(2),
- isocianato de 3-metil-butilo-(2),
- isocianato de 3-metil-pentilo-(2),
- isocianato de 4-metil-pentilo-(2),
- isocianato de pentilo-(3),
- 10 isocianato de 2-metil-pentilo-(3),
- isocianato de 2,4-dimetil-pentilo-(3),
- isocianato de hexilo-(3),
- isotiocianato de 2-metil-hexilo-(3),
- isotiocianato de 3,3-dimetil-butilo-(2),
- 15 isotiocianato de 2,2-dimetil-pentilo-(3),
- isotiocianato de 1-ciclopropil-etilo,
- isotiocianato de 1-ciclopentil-etilo,
- isotiocianato de ter-butilo,
- isotiocianato de ter-pentilo,
- 20 isotiocianato de 3-metil-pentilo-(3),
- isotiocianato de 3-etil-pentilo-(3),
- isotiocianato de 2-metil-pentilo-(3),
- isotiocianato de 2-metil-hexilo-(2),
- isotiocianato de 3-metil-hexilo-(3),
- 25 isotiocianato de 2-metil-octilo-(2),

Las alquil- y cicloalquilaminas de fórmula general (III) en que se basan los precitados isocianatos de alquilo pueden ser empleadas alternativamente para la producción de compuestos de fórmula general (I) en analogía con la ecuación de reacción A.

5 Como cicloalquilaminas y cicloalquenilaminas eventualmente substituídas de fórmula general (III) entran en consideración preferiblemente cicloalquilos y cicloalquenilos eventualmente substituídos con alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), trifluorometilo, amino. A título de ejemplo sean mencionadas:

- 10 ciclopropilamina, 1-metil-ciclopropilamina,
1-alil-ciclopropilamina, 1-etil-ciclopropilamina,
2-metil-ciclopropilamina, ciclobutilamina,
1-metil-ciclobutilamina, ciclopentilamina,
1-metil-ciclopentilamina, 1-etil-ciclopentilamina,
15 2-metil-ciclopentilamina, 3-metil-ciclopentilamina,
ciclopenten-2-il-amina, ciclohexilamina,
1-, 2-, 3- ó 4-metil-ciclohexilamina,
2-, 3- ó 4-trifluorometil-ciclohexilamina,
2- ó 4-etil-ciclohexilamina, 2- ó 4-isopropil-ciclohexilamina,
20 4-n-propil-ciclohexilamina, 4-n-butil-ciclohexilamina,
2,4-, 2,5-, 2,5-, 3,4- ó 3,5-dimetil-ciclohexilamina,
3,5-bis-trifluometil-ciclohexilamina,
4-metil-3-trifluometil-ciclohexilamina,
2,4- ó 2,6-dietil-ciclohexilamina,
25 cicloheptilamina, ciclohexen-(2)-il-amina,

ciclooctilamina, 1-metil-ciclooctilamina,
2-norbornilamina, 2-decahidro-1-naftilamina,
1-amino-adamantano.

5 Los isotiocianatos de cicloalquilo o de cicloalqueno de fórmula general (IV) correspondientes a las precitadas cicloalquilaminas, pueden ser empleados para la producción de los compuestos de fórmula general (I) según la ecuación de reacción D.

Como ya se ha mencionado arriba, de acuerdo con la invención, se hacen reaccionar

- 10 a) los isotiocianatos de arilo substituídos de fórmula general (II) con los alquilaminas y cicloalquilaminas de fórmula (III) o alternativamente
b) los isotiocianatos de alquilo y cicloalquilo de fórmula general (IV) con arilaminas de fórmula general (V),

La reacción procede en relaciones molares
15 o aproximadamente molares, pudiendo aplicarse en exceso el componente más volátil o menos valioso, por ejemplo un 5 a 50% de exceso. Sin embargo, en una forma de realización preferida, es también posible aplicar, por ejemplo, las alquilaminas y cicloalquilaminas de fórmula (III) en un gran exceso, es decir de 2 a 20 moles por mol de
20 isotiocianato de arilo (II). Así sirven al mismo tiempo de disolventes para las tioúreas de fórmula general (I) en formación, y, terminada la reacción, pueden ser recuperadas ampliamente por destilación. En la realización de la reacción según las ecuaciones A ó B, pueden agregarse bases orgánicas terciarias para acelerar la reacción, se trabaja, por ejemplo,
25 a temperaturas de 10 a 120 °C, particularmen-

te de 20 a 60 °C. La reacción de los isotiocianatos de arilo sustituido:
de fórmula general (II) con las alquil- o cicloalquilaminas de fórmula
general (III) o alternativamente de los isotiocianatos de alquilo o de ciclo-
alquilo (IV) con las arilaminas de fórmula (V) puede proceder sin disol-
5 viente al estado fundido o con adición de un disolvente o diluyente. Como
tales pueden emplearse, por ejemplo, los hidrocarburos o hidrocarburos
halogenados, tales como éter de petróleo, nafta para lavar, ligroína,
ciclohexano, benceno, tolueno, clorobenceno, cloruro de metileno, cloro-
formo, tetracloruro de carbono; disolventes hidrosolubles, tales como
10 metanol, etanol, acetona, acetonitrilo, dimetilformamida. En caso nece-
sario pueden agregarse además a las mezclas de reacción bases inorgá-
nicas o, como ya se ha mencionado arriba, bases orgánicas como agen-
tes aceleradores, por ejemplo trietilamina, 1,4-diaza-biciclo-[2,2,2]-
octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo-[4,3,0]-noneno-(5) (DBN), 1,8-
15 diaza-biciclo [5,4,0]-undeceno-(7) (DBU), hidroxido de potasio, hidróxi-
do de sodio, hidruro de sodio, óxido de sodio.

Según los compuestos de partida utilizados,
las reacciones pueden desarrollarse exotérmicamente y deben ser con-
troladas por refrigeración según la cantidad y presencia de diluyentes,
20 o bien las reacciones deben ser aceleradas por calentamiento, por ejem-
plo a temperaturas de 40 a 150°C, preferiblemente de 50 a 100 °C. Vale
decir que las condiciones de reacción son diferentes según el caso y
dependen de la índole y cantidad de los materiales de partida aplicados,
así como del disolvente empleado.

25 La elaboración procede ya sea por destilación

de los disolventes y recristalización del producto de la reacción, o bien por vertimiento en agua o en un ácido mineral diluído con agua, filtración y secado.

Como nuevas N-aril-N'-alquil-tioureas de

- 5 fórmula general (I) sean citados los siguientes compuestos:
- | | |
|--|-----------------|
| N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | P. f. 135-137°C |
| N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea | P. f. 134-155°C |
| N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(1,1,2,2-tetrametil-tiourea | P. f. 161-162°C |
| 10 N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | P. f. 98-100°C |
| N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea | P. f. 85-87°C |
| N-(2,6-di-sec-butyl)-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea | P. f. 116-118°C |
| N-(2,6-di-sec-butyl)-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | P. f. 115-117°C |
| N-(2,6-dietil-fenil)-N'-isopropil-tiourea | P. f. 108-110°C |
| 15 N-(2,6-dietil-fenil)-N'-sec-butyl-tiourea | P. f. 78-80°C |
| N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-isopropil-tiourea | P. f. 108-111°C |
| N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-sec-butyl-tiourea | P. f. 103-105°C |
| N-(2,4-dimetil-6-etil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | P. f. 130-132°C |
| N-(2,4-dimetil-6-etil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea | P. f. 105-107°C |
| 20 N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | P. f. 121-123°C |
| N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea | P. f. 98-101°C |
| N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | P. f. 94-96°C |
| N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea | P. f. 78-81°C |
| N-(2,6-dietil-3-metil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | |
| 25 N-(2,6-dietil-3,5-dimetil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea | |

- N-(2,6-dietil-3,5-dimetil-fenil)-N'-pentil-(2)-tiourea
- N-(2,6-di-isopropil-fenil)-N'-[3-metil-butil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-[pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-[hexil-(2)]-tiourea
- 5 N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-[pentil-(3)]-tiourea
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-[4-metil-pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-(2-metil-pentil-(3))-tiourea,
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(hexil-(2))-tiourea
- 10 N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[3-metil-pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[pentil-(3)]-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[2,2-dimetil-pentil-(3)]-tiourea
- N-(2-etil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea P. f. 96-99°C
- N-(2-isopropil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea P. f. 121-123°C
- 15 N-(2-isopropil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea P. f. 51-53°C
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[1-ciclopentil-etil]-tiourea
- N-(2,6-sec-butil-fenil)-N'-[2-metil-pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-sec-butil-fenil)-N'-(2-etil-pentil-(2))-tiourea
- N-(2,6-sec-butil-fenil)-N'-[2-metil-hexil-(2)]-tiourea
- 20 N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[2-metil-oetil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[2-metil-pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-[2-etil-pentil-(2)]-tiourea
- N-(2,6-dietil-3-cloro-fenil)-N'-ter-butil-tiourea
- N-(2-etil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea P. f. 74-76°C
- 25 N-(2,6-di-ciclopentil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea

- N-(2-etil-4-metil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea
N-(2,4-dimetil-6-ter-butil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea
N-[2,6-di-pentil-(2)-fenil]-N'-ter-butil-tiourea,
N-(2,4-dimetil-6-ciclohexil-fenil)-N'-ter-but il-tiourea
5 N-(2,6-diisopropil-4-clorofenil)-N'-ter-butil-tiourea
N-(2,5-dimetil-6-etil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea
N-(2,5-dimetil-6-isopropil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[2-metil-pentil-(2)]-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[2-etil-pentil-(2)]-tiourea
10 N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[2-metil-hexil-(2)]-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[decil-(5)]-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[1,1,2,2-tetrametil-propil]-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-[2,4-dimetil-pentil-(3)]-tiourea
N-(2,6-dimetil-fenil)-N'-[2,2-dimetil-pentil-(3)]-tiourea .
- 15 Como nuevas N-aril-N'-cicloalquil-tioureas
de fórmula general (I) sean citados los siguientes compuestos:
- N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea
N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea ,
20 N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
N-(2,4-dimetil-6-etil-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea P.f. 111-113°C
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ciclobutil-tiourea
N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
25 N-(2,6-dietil-fenil)-N'-(1-metil-ciclopentil)-tiourea P.f. 86-88°C

- N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(2,6-dietil-fenil)-N'-(2-metil-ciclohexil)-tiourea aceite
- N-(2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
- N-(2,6-dietil-fenil)-N'-ciclooctil-tiourea
- 5 N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea P.f. 113-115°C
- N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-metil-ciclohexil)-tiourea
- N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3,3,5-trimetil-ciclohexil)-
- 10 tiourea
- N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2,6-dietil-ciclohexil)-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea P.f. 97-99°C
- 15 N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclohexil)-
- tiourea P.f. 52-55°C
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-(4-trifluometil-ciclohexil)-
- tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-(3,5-bis-trifluometil-ciclo-
- 20 hexil)-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-ciclooctil-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-(2-norbornil)-tiourea
- N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-(1-adamantil)-tiourea
- 25 N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea

- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)-tiourea
- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-metil-ciclohexil)-tiourea
- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclohexil)-tiourea,
- 5 aceite
- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-trifluometil-ciclohexil)-
tiourea, aceite
- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2,4-dimetil-ciclohexil)-tiourea
- N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-etil-ciclohexil)-tiourea
- 10 N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(4-isopropil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(4-isopropil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea P. f. 120-123°C
- N-(4-isopropil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-
 ciclohexil)-tiourea, P. f. 127-140°C
- 15 N-(4-isopropil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2-norbornil)-
 tiourea
- N-(4-isopropil-2,6-dietil-fenil)-N'-(decahidronaftil-1)-
 tiourea
- N-(4-n-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- 20 N-(4-n-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea aceite
- N-(4-n-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)-
 tiourea aceite
- N-(4-n-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-metil-ciclohexil)-
 tiourea
- 25 N-(4-n-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-etil-ciclohexil)-
 tiourea

- N-(4-n-butyl-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclohexil)-tiourea, aceite
- N-(4-n-butyl-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
- N-(4-n-pentil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- 5 N-(4-n-pentil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(4-n-pentil-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
- N-(4-pentil-(3)-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclo-pentil-tiourea
- N-(4-pentil-(3)-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclo-hexil-tiourea
- N-(4-pentil-(3)-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclo-
- 10 hexil)-tiourea
- N-(4-pentil-(3)-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
- N-(4-n-hexil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(4-n-hexil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(4-ciclohexil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- 15 N-(4-ciclohexil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea
- N-(4-ciclohexil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclohexil)-
tiourea P. f. 118-125°C
- N-(4-(1-metil-ciclohexil-2,6-dietil)-N'-ciclopentil-tiourea
- 20 N-(4-ciclopentil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(4-ciclopentil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(4-ciclopentil-2,6-dietil-fenil)-N'-(ciclohexen-(2)-il)-
tiourea
- N-(4-sec-butyl-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- 25 N-(4-sec-butyl-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea P. f. 140°C

- N-(4-sec-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2-metil-ciclohexil)-
tiourea , aceite
- N-(4-sec-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)-
tiourea, aceite
- 5 N-(4-sec-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-metil-ciclohexil)-
tiourea P. f. 86-123°C
- N-(4-sec-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-
ciclohexil)-tiourea,
- N-(4-sec-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil)-tiourea
- 10 N-(4-sec-butil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3,3,5-trimetil-
ciclohexil)-tiourea, P. f. 58-80°C
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclobutil-tiourea
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea, aceite
- 15 N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea, P. f. 41-44°C
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(1-metil-ciclo-
pentil)-tiourea, P. f. 73-74°C
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2-metil-ciclohexil)-
tiourea, resina
- 20 N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)-
tiourea, P. f. 57-85°C
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-metil-ciclohexil)-
tiourea, P. f. 70-105°C
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(3-trifluometil-
ciclohexil)-tiourea, P. f. 50-55°C
- 25

- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(4-trifluometil-ciclohexil)-
tiourea, P.f. 52-60°C
- N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2,6-dimetil-ciclo-
hexil)-tiourea
- 5 N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(2-norbornil)-tiourea
N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-(1-adamantil)-tiourea
N-(4-isobutil-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
N-(4-cicloheptil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopentil)-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea, P.f. 166-168°C
- 10 N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea, P.f. 140-142°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(1-metil-ciclopentil)-
tiourea, P.f. 149-150°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea, P.f. 120-122°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(2-metil-ciclohexil)-
15 tiourea, P.f. 128-145°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)-
tiourea, P.f. 62-76°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(4-metil-ciclohexil)-
tiourea, P.f. 155-167°C
- 20 N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(2-trifluometil-ciclo-
hexil)-tiourea, P.f. 187°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclo-
hexil)-tiourea, P.f. 67-75°C
N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(4-trifluometil-ciclo-
25 hexil)-tiourea, P.f. 142-165°C

- N-(2,4,6-triisopropil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea P.f. 158-160°C
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(4-etil-ciclohexil)-tio-
úrea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(ciclohexen-(2)il)-tiourea
- 5 N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(3,3,5-trimetil-ciclohexil)-
tiourea P.f. 84-120°C
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(3,3,5-trimetil-ciclo-
hexil)-triurea P.f. 84-120°C
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(3,5-bis-trifluometil-ciclohexil)-
10 tiourea P.f. 180-182°C
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(2,4-dimetil-ciclohexil)-
tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(3-trifluometil-4-metil-ciclo-
hexil)-tiourea P.f. 145-165°C
- 15 N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(2-norbornil)-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-(1-adamantil)-tiourea
- N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea
- N-(2-etil-6-isopropil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea
- N-(4-metil-2,6-diisopropil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- 20 N-(2-isopropil-6-sec-butil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea P.f. 151-153°C
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea P.f. 140-142°C
- N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-(1-metil-ciclopentil)-
tiourea
- 25 N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea

	N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-(3-metil-ciclohexil)- tiourea	
	N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclo- hexil)-tiourea	P. f. 58-67°C
5	N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-(3,5-bis-trifluometil- ciclohexil)-tiourea,	aceite
	N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-(2-norbornil)-tiourea	
	N-(2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea	
	N-(2-etil-6-sec-butyl-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea	P. f. 122-123°C
10	N-(2,6-di-ciclopentil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea	P. f. 168-170°C
	N-(2,6-di-ciclopentil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea	
	N-(di-pentil-(2)-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea	
	N-(di-pentil-(2)-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea	
	N-(2-cloro-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea	P. f. 130-131°C
15	N-(3-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea	P. f. 145-146°C
	N-(3,5-dimetil-2,6-dietil-fenil)-N'-ciclopropil-tiourea	P. f. 145-146°C
	N-(4-metil-2,6-di-sec-butyl-fenil)-N'-ciclopropil- tiourea	P. f. 154-156°C
	N-(2,4,6-trietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea	P. f. 84-86°C
20	N-(4-n-propil-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea	aceite
	N-(4-isopropil-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea	P. f. 89-92°C
	N-(4-n-butyl-2,6-dietil-fenil)-N'-cicloheptil-tiourea	aceite

A una buena tolerabilidad por las plantas y a una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, las sustancias

activas se prestan para combatir parásitos animales, particularmente insectos, arácnidos y nematodos que ocurren en la agricultura, en la silvicultura, en el sector de la protección de provisiones y materiales, así como en el sector de la higiene. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como contra todos los estados o

5. contra estados individuales de desarrollo.

A los parásitos arriba mencionados pertenecen:

Del orden de los isópodos, p. ej. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

10 Del orden de diplópodos, p. ej. *Bianiulus guttulatus*.

Del orden de quilópodos, p. ej. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*

Del orden de Symphyla, p. ej. *Scutigera inmaculata*,

Del orden de los tisanuros, p. ej. *Lepisma saccharina*.

Del orden de Collembola, p. ej. *Onychiuros armatus*.

15 Del orden de ortópteros, p. ej. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*,

Leucophaea maderae, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Grylotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*,

Melanoplus differentialis, *Schistocerca gregaria*.

Del orden de dermápteros, p. ej. *Forficula auricularia*,

20 Del orden de los isópteros, p. ej. *Reticulitermes spp.*

Del orden de Anoplura, p. ej. *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus spp.*,

Pediculus humanus corporis, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*

Del orden de Mallophaga, p. ej. *Trichodectes spp.*, *Damalinea spp.*

Del orden de los tisanópteros, p. ej. *Hercinothrips femoralis*,

25 *Thrips tabaci*.

- Del orden de los heterópteros, p. ej. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Tiatoma* spp.
- 5 Del orden de los homópteros, p. ej. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phaedon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bolobatus*, *Nephotettix cincticeps*,
10 *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..
- 15 Del orden de los lepidópteros, p. ej. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp.,
20 *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Epeestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.
- 25 Del orden de los coleópteros, p. ej. *Anobium punctatum*, *Rhizo-*

- phertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus,
Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata,
Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psyllodes chrysocephala,
Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis,
5 Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus,
Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypero postica,
Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp.,
Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus,
Gibbium psyllodes, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes
10 spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon
solstitialis, Costelytra zealandica.
- Del orden de los himenópteros, p.ej. Diprion spp., Hoplocampa
spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- Del orden de los dípteros, p.ej. Aedes spp., Anopheles spp.,
15 Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp.,
Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomya spp.,
Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys
spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp.,
Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomya
20 hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.
- Del orden de los sifonápteros, p.ej. Xenopsylla cheopis, Cera-
tophyllus spp.,
- Del orden de los arácnidos, p.ej. Scorpio maurus, Latrodectus
mactans.
- 25 Del orden de los ácaros, p.ej. Acarus siro, Argas spp.,

Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis,
Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp.,
Amblyoma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp.,
Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia
5 praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp..

Los compuestos según la invención tienen además acción contra hongos nocivos, particularmente Pyricularia y Pellicularia.

La aplicación de las sustancias activas según el invento 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 límites amplios. La concentración de la sustancia activa de las formas de aplicación puede estar entre 0,0000001 y 100 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0,01 y 10 % en peso.

La aplicación procede en una forma usual adaptada a las formas 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.

La aplicación de las sustancias activas según

el invento procede en el sector de la veterinaria en forma conocida, tal como por administración oral en forma de p. ej. pastillas, cápsulas, bebidas, granulados, por aplicación dermal en forma de p. ej. inmersión, rociada, vertimiento y espolvoreo, así como por administración parente-
5 ral en forma de p. ej. la inyección.

Las sustancias activas pueden ser elaboradas en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos para rociar, suspensiones, polvos, preparados de espolvorear, espumas, pastas, polvos solubles, granulados, aerosoles, concentra-
10 dos de suspensión y de emulsión, polvos desinfectantes de semilla, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con sustancias activas; en microcapsulaciones en sustancias polímeras y en envolturas para semi-llas; además, en formulaciones para dispositivos de fumigación, tales como cartuchos, latas, espirales y similares de fumigación, así como
15 formulaciones de nebulización en frío y en caliente de volumen ultrabajo.

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

Entran en consideración esencialmente como disolventes líquidos; los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno,
25 tolueno, benceno o alquilnaftalenos; los hidrocarburos aromáticos o alifá-

ticos clorados , tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno; los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o parafinas p. ej. fracciones de petróleo; los alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres; cetonas, tales como acetona, 5 metileticetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona; disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua; como diluyentes o vehículos gaseosos licuados entendiéndose como tales aquellos líquidos que a la temperatura normal y a la presión normal son gaseosos: gases impelentes de aerosoles, tales como 10 hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono; como vehículos sólidos: minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos molidos, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como 15 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 y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes 20 y/o espumantes: emulsivos no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácidos grasos, éteres de polioxietileno y alcoholes grasos, p. ej. éteres alquilarilpoliglicólicos, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de proteínas; como agentes dispersantes: p. ej. lignina, lejjas de desecho de sulfito y 25 metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse agentes adherentes, tales como carboximetilcelulosa, polímeros pulverulentos, granulares o en forma de látices naturales y sintéticos, tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo.

5 Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, p. ej. óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro, y colorantes orgánicos, tales como alizarina, colorantes azoicos de ftalocianina metálica, y micronutrientes, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

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

Ejemplo

Ensayo con garrapatas *Boophilus microplus* in vitro.

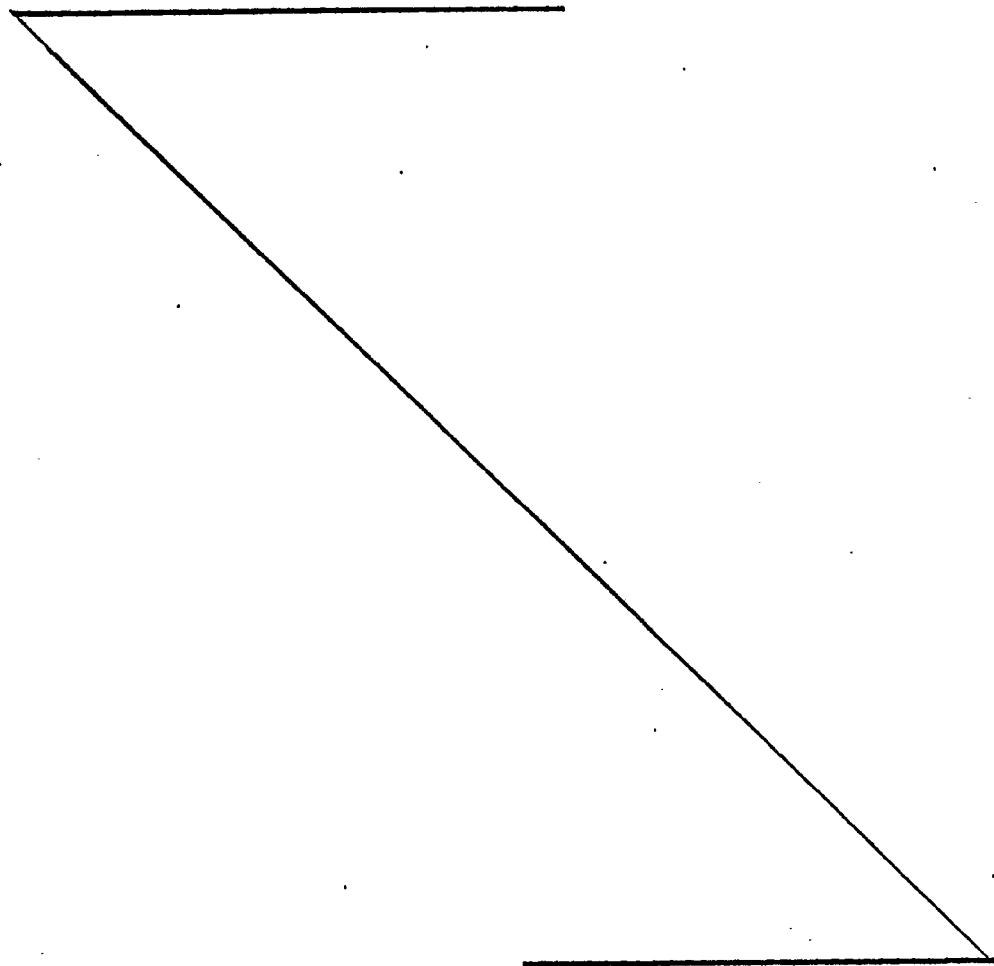
15 3 partes de la sustancia activa son mezcladas con 7 partes de una mezcla consistente en partes en peso iguales de éter monometílico de etilenglicol y de éter nonilfenolpoliglicólico. El concentrado de emulsión así obtenido es diluído con agua hasta la concentración de aplicación deseada.

20 Con la preparación de sustancia activa así obtenida se rocían vacunos infestados con larvas de garrapatas resistentes de la especie *Boophilus microplus*, raza Biarra (la infección se efectúa 12 veces a intervalos de 2 días) .

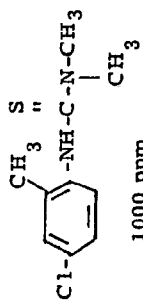
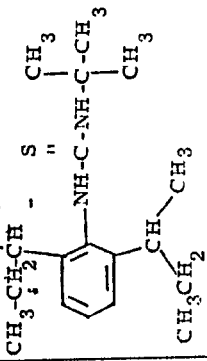
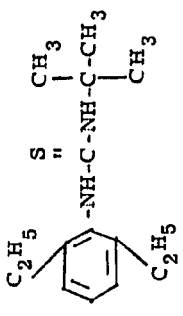
25 El efecto de la preparación de sustancia activa se determina determinando la cantidad de garrapatas hembras adultas

que alcanzan a desarrollarse sobre los vacunos tratados. Esta cantidad se compara con la cantidad de garrapatas hembras adultas que alcanzaron a desarrollarse sobre vacunos no tratados. Un compuesto es tanto más eficaz, cuanto menor es la cantidad de garrapatas hembras que llegan a desarrollarse después del tratamiento.

Como medida del grado de ataque antes del tratamiento, se utiliza el número de hembras adultas que de los animales tratados y no tratados llegan a desarrollarse en los últimos tres días antes del tratamiento sobre los animales tratados y no tratados.

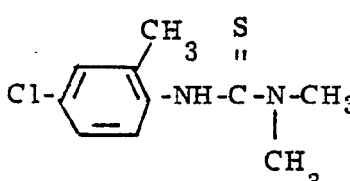
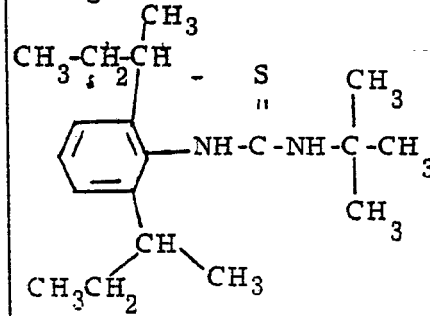
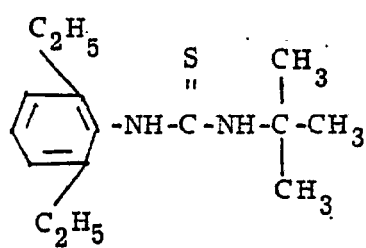


Ensayo en vivo

Substancia activa y concentración de substancia activa	días antes del tratamiento -2 a +0	Número de garratías con posturas fértiles							Σ	efecto en %
		+1-3	4-6	7,9	10-12	1-15	-16-18	19-21		
conocida de la Patente alemana no ex. 2.337.122:  1000 ppm	1910	132	37	35	54	0	0	273	97,63	
según invento  250 ppm	1244	21	12	10	10	2	0	55	98,5	
 250 ppm	595	21	0	27	8	0	0	56	96,5	

Ensayo 4

Número de garrapatas con

Substancia activa y concentración de substancia activa	días antes del tratamiento -2 a +0	Días después del t				
		+1-3	4-6	7,9	10-12	1-15
<p>conocida de la Patente alemana no ex. 2.337.122:</p>  <p>1000 ppm</p>	1910	132	37	35	54	5
<p>segun invento</p>  <p>250 ppm</p>	1244	21	12	10	10	2
 <p>250 ppm</p>	595	21	0	27	8	0

Ensayo en vivo

tas con posturas fértiles ~ :

és del tratamiento		Σ	efecto en	
5	-16-18	19-21	+1-21	%
	0	0	273	97,63
	0	0	55	98,5
	0	0	56	96,5

Ensayo con garrapatas

Disolvente: 35 partes en peso de éter monometílico de etilenglicol

Emulsivo: 35 partes en peso de éter nonilfenilpoliglicólico

5 Para la producción de una formulación adecuada, se mezclan 3 partes en peso de la sustancia activa con 7 partes en peso de la mezcla arriba indicada de disolvente-emulsivo, y se diluye el concentrado de emulsión con agua hasta la concentración deseada .

10 En esta preparación de sustancia activa se inmergen garrapatas hembras adultas llenas de la especie *Boophilus microplus* (sensible o resistente) durante un minuto. Después de la inmersión de cada vez 10 ejemplares hembras de las diferentes especies de garrapatas, éstos se transfieren a placas de Petri, cuyo fondo está cubierto con un disco de tamaño correspondiente de papel para filtrar.

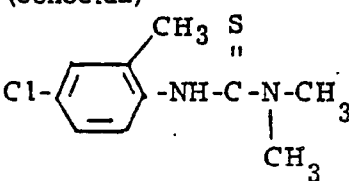
15 Al cabo de 10 días, se determina la eficacia de la preparación de sustancia activa por verificación de la inhibición de la puesta de huevos en comparación con las garrapatas testigos no tratadas. Se expresa el efecto en %, significando 100 % que no hay más puesta de huevos, y 0 % indica que las garrapatas pusieron huevos en cantidad normal.

20 Las sustancias activas ensayadas, sus concentraciones, los parásitos ensayados y los resultados obtenidos se encuentran indicados en la siguiente tabla.:

Substancia activa según invento	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructor en % Boophilus microplus res.
	10.000 1.000	100 >50
	10.000 1.000	100 100
	10.000 1.000	100 >50
	10.000 1.000	100 >50
	10.000 1.000	100 <50

Substancia activa según invento	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructor en % <i>Boophilus microplus</i> res
	<p>10.000 1.000 100</p>	<p>100 100 <50</p>
	<p>10.000 1.000</p>	<p>100 <50</p>
	<p>10.000 1.000</p>	<p>100 >50</p>
	<p>10.000 1.000</p>	<p>100 >50</p>

Para comparación:

Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructor en % <i>Boophilus microplus</i> res.
(conocida)		
	1.000 100	450 0

Ensayo con larvas parasitarias de moscas

Disolvente: 35 partes en peso de éter etilenpoliglicol-monometílico,

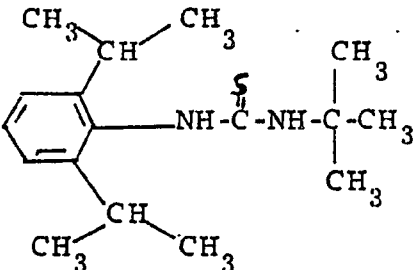
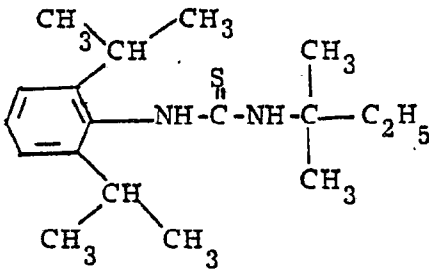
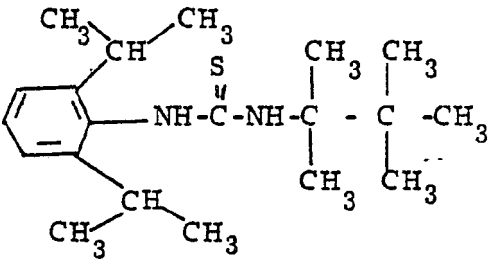
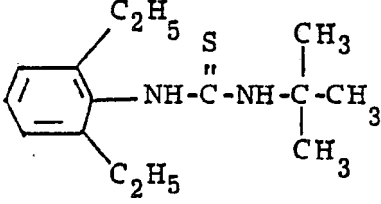
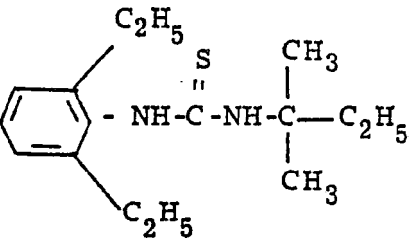
5 Emulsivo: 35 partes en peso de éter nonilfenolpoliglicólico

Para obtener una preparación adecuada de substancia activa, se mezclan 30 partes en peso de la respectiva substancia activa con la cantidad indicada del disolvente que contiene la proporción arriba indicada del emulsivo y se diluye el concentrado así obtenido con agua hasta la concentración deseada.

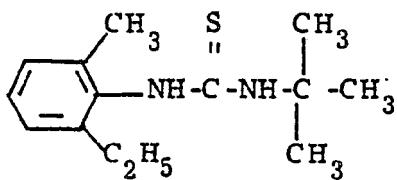
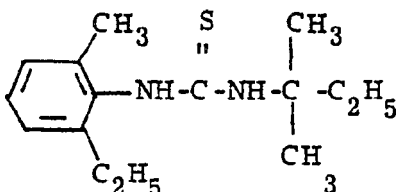
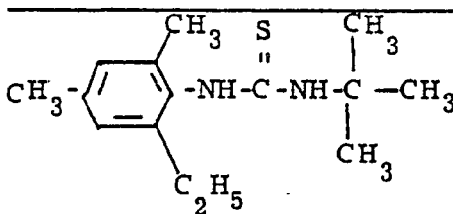
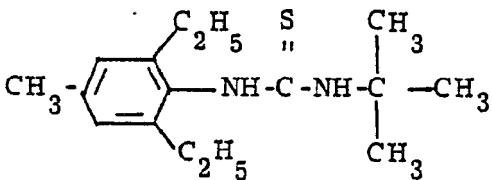
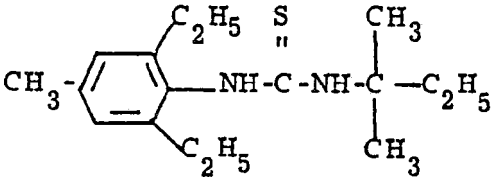
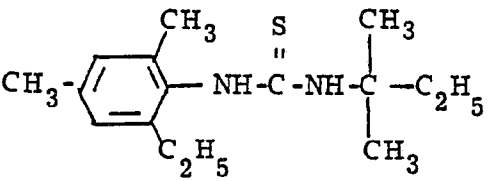
10 Unas 20 larvas de moscas (*Lucilia cuprina*) son introducidas en un tubito de ensayo que contiene aproximadamente 2 cm³ de musculatura de caballo. A esta carne de caballo se aplican 0,5 ml de la preparación de substancia activa. Al cabo de 24 horas,

15 se determina el grado de destrucción en %, significando 100 % que fueron matadas todas las larvas, y 0 % que no fue matada ninguna larva.

Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructor en % Lucilia cuprina res
	1.000 300	100 100
	1.000	100
	1.000 300 100	100 100 >50
	1.000	100

Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructivo en % Psoroptes canis
	1.000	100
	300	100
	100	100
	1.000	100
	100	100
	1.000	100
	100	100
	10	100
	1.000	100
	100	100
	10	100
	1	100
	1.000	100
	100	100
	10	100
	1	> 50

Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructor en % Psoroptes cunicul
	<p>1.000</p> <p>100</p> <p>10</p> <p>1</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>1.000</p> <p>100</p> <p>10</p> <p>1</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p> <p>50</p>
	<p>1.000</p> <p>100</p>	<p>100</p> <p>100</p>
	<p>1.000</p> <p>100</p> <p>10</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>
	<p>1.000</p> <p>100</p> <p>10</p>	<p>100</p> <p>100</p> <p>100</p>

Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm	efecto destructor en % Psoroptes cuniculi
	1.000 100	100 100
	1.000 100	100 100
	1.000 100	100 100
	1.000 100	100 100
	1.000	100
	1.000	100

Tabla

(Acaros nocivos para plantas)

Ensayo con Tetranychus (resistente)

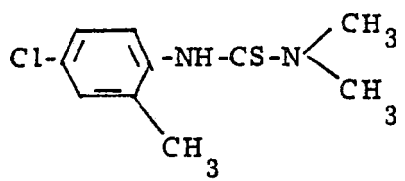
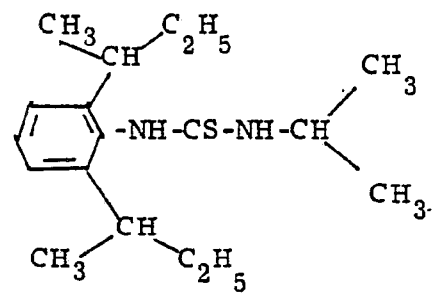
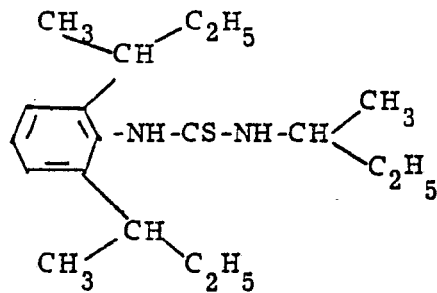
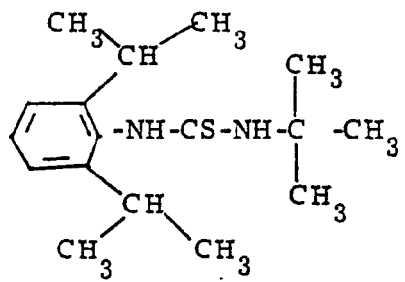
Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
 <p>Cl- CH₃</p>	0,1 0,01	60 0
conocida		
substancias activas de acuerdo con la invención		
 <p>CH₃ C₂H₅ CH₃ CH₃</p>	0,1 0,01	100 100
 <p>CH₃ C₂H₅ CH₃ C₂H₅</p>	0,1 0,01	100 100
 <p>CH₃ CH₃ CH₃ CH₃</p>	0,1 0,01	100 100

Tabla (Continuación)

(Acaros nocivos para plantas)

Ensayo con *Tetranychus* (resistente)

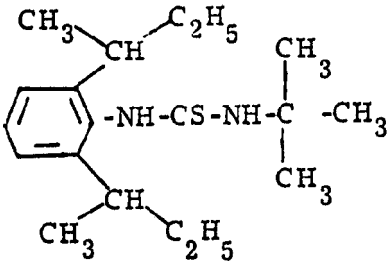
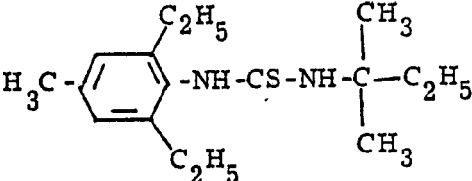
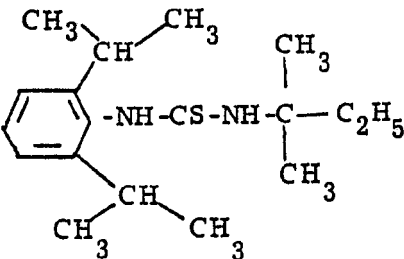
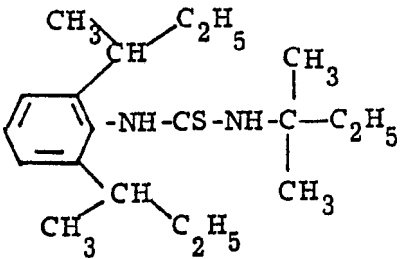
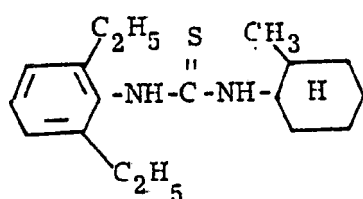
Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
	0,1 0,01	100 70
	0,1 0,01	100 99
	0,1 0,01	100 99
	0,1 0,01	100 100

Tabla (Continuación)

(Acaros nocivos para plantas)

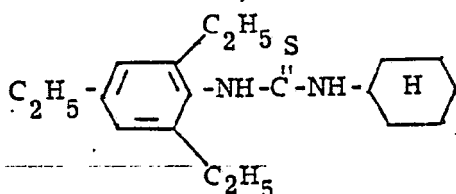
Ensayo con Tetranychus (resistente)

Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
---------------------	---	---



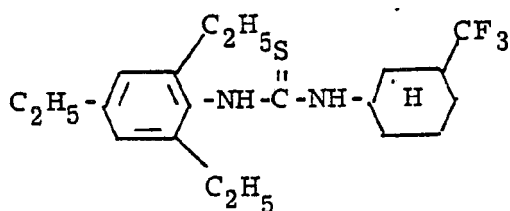
0,1
0,01

100
100



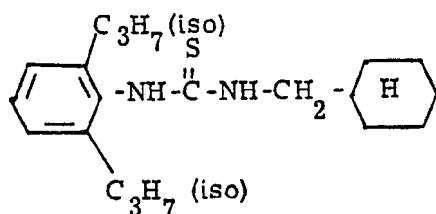
0,1
0,01

100
100



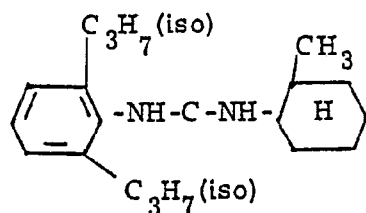
0,1
0,01

100
100



0,1
0,01

100
100



0,1
0,01

100
100

Tabla (Continuación)

(Acaros nocivos para plantas)

Ensayo con Tetranychus (resistente)

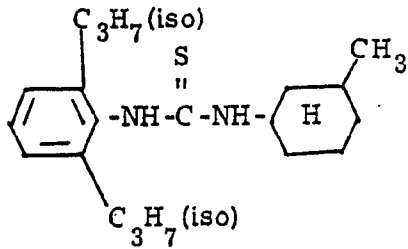
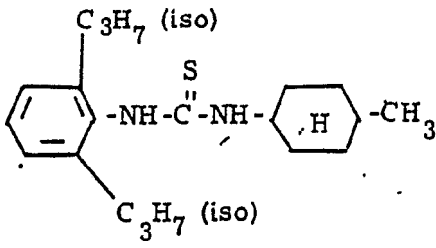
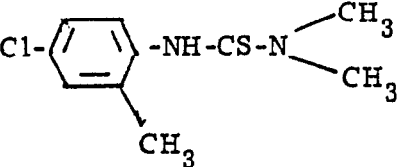
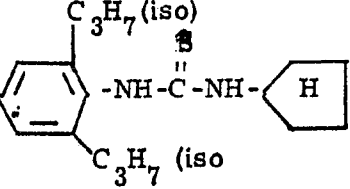
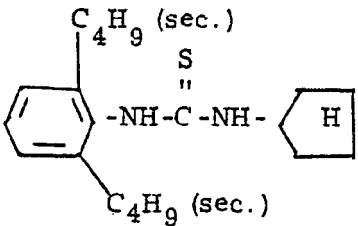
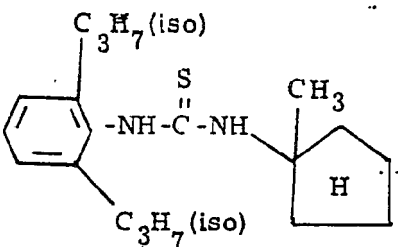
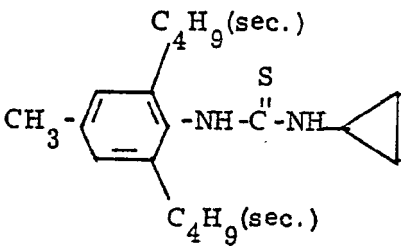
Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	60 0
(conocida)		
	0,1 0,01	100 99

Tabla (Continuación)

(Acaros nocivos para plantas)

Ensayo con *Tetranychus* (resistente)

Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
 <p> C_4H_9 (sec.) C_4H_9 (sec.) $-NH-C(=S)-NH-$ </p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>
 <p> C_3H_7 (iso) C_3H_7 (iso) $-NH-C(=S)-NH-$ CH_3 </p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>
 <p> CH_3 C_4H_9 (sec.) C_4H_9 (sec.) $-NH-C(=S)-NH-$ </p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>

Ejemplo

Ensayo con *Plutella*

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida

Emulgente: 1 parte en peso de éter alquilaril-poliglicólico

5

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

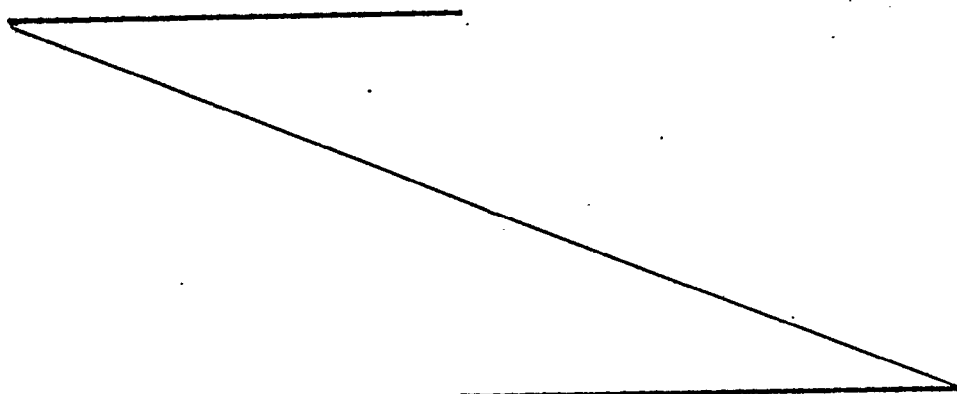
10

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

15

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

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

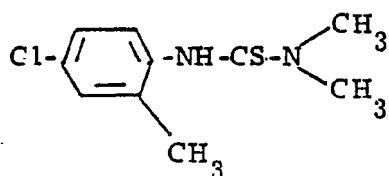


Tabla

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Plutella*

Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
---------------------	---	---

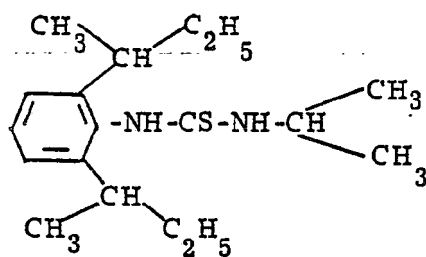


0,1

80

(conocida)

substancias activas según el invento:

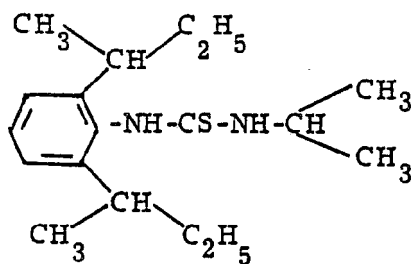


0,1

100

0,01

100

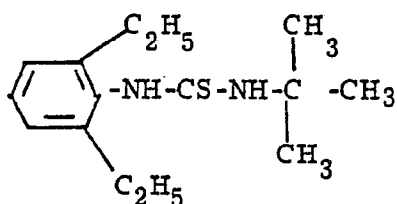


0,1

100

0,01

100



0,1

100

0,01

95

Tabla (Continuación)

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Plutella*

Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1 0,01	100 90
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100

Tabla (Continuación)

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Plutella*

Substancias Activas	concentración de las substancias activas en ‰	grado de destrucción en ‰ al cabo de 3 días
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	80 0

(conocida)

Tabla (continuación)

(Insectos nocivos para plantas)

Ensayo con *Plutella*

Substancias activas	concentración de las substancias activas en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
<p style="text-align: center;"> C_4H_9 (sec.) S $-NH-C-NH-$ C_4H_9 (sec.) </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 90</p>
<p style="text-align: center;"> C_3H_7 (iso) S $-NH-C-NH-$ C_3H_7 (iso) </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 95</p>
<p style="text-align: center;"> C_3H_7 (iso) S $-NH-C-NH-$ $(iso)C_3H_7$ </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 90</p>
<p style="text-align: center;"> C_4H_9 (sec.) S $-NH-C-NH-$ C_4H_9 (sec.) </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 90</p>
<p style="text-align: center;"> C_4H_9 (sec.) S $-NH-C-NH-$ C_2H_5 </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 90</p>

Ejemplo 1

N-(2-6-di-sec-butil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea

20,0 g de isotiocianato de 2,6-di-sec-butil-fenilo son disueltos en 20,0 g de ter-butilamina y la solución es mantenida durante 12 horas a 20°C. Entonces se la vierte en ácido clorhídrico diluido, se separa por filtración el producto de la reacción, se lo lava hasta reacción neutra y se lo seca.
Rendimiento: 25,0 g ; 96% de la teoría. P.f. = 115-117°C.

Análogamente se obtiene, a partir de isotiocianato de 2,6-di-sec-butil-fenilo y ter-pentilamina, la N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea de P.f. = 116-118°C.

El isotiocianato de 2,6-di-sec-butil-fenilo, empleado como material de partida, puede ser preparado como sigue:

100 g de 2,6-di-sec-butil-anilina en 200 ml de cloruro de metileno son instilados bajo agitación y a una temperatura de 0 a 5°C en una mezcla de 300 ml de agua, 500 ml de cloruro de metileno, 100 g de carbonato de calcio y 68 g de tiosogeno. Luego se calienta con reflujo hasta la terminación del desarrollo de gas. Después del enfriamiento se eliminan los sólidos por filtración, se separa la capa de cloruro de metileno, se la seca con cloruro de calcio y se la fracciona: P.e.: 117-120°C/1,0 mm. Hg; rendimiento: 112 g ; 93% de la teoría.

Análogamente al ejemplo 1, son preparados: a partir de isotiocianato de 2-etil-6-sec-butil-fenilo y de ter-butilamina el compuesto:

N-(2-etil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea de punto de fusión 96-99°C; a partir de isotiocianato de 2-etil-6-sec-butil fenilo y de ter-pentilamina, el compuesto

5 N-(2-etil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea del punto de fusión de 74-76°C;

a partir de isotiocianato de 2-isopropil-6-sec-butil-fenilo y de ter-butilamina, el compuesto

N-(2-isopropil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea de punto de fusión 121-123°C;

10 a partir de isotiocianato de 2-isopropil-6-sec-butil-fenilo y de ter-pentilamina, el compuesto

N-(2-isopropil-6-sec-butil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea de punto de fusión 51-53°C.

Ejemplo 2

15 N-(2,6-diisopropil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea

15 g de isotiocianato de 2,6-diisopropil-fenilo son introducidos en 25 g de ter-butilamina y mantenidos durante 12 horas a 20°C. Luego se vierte en ácido clorhídrico diluido, se filtra, se lava y se seca.

20 Rendimiento: 17 g; P.f. = 135-137°C.

El mismo compuesto puede ser obtenido de la siguiente manera:

25 50 g de isotiocianato de 2,6-diisopropil-fenilo y 19,0 g de ter-butilamina son calentados en 250 ml de benceno y 20 ml de trietilamina durante 5 horas, con reflujo. Subs-

guientemente se elimina el disolvente por destilación y se lleva el residuo a cristalizar en éter de petróleo. Rendimiento: 34 g
P.f. = 135-137°C.

El isotiocianato de 2,6-diisopropil-fenilo

5 usado como compuesto de partida puede ser preparado de la siguiente manera:

100 g de isotiocianato de 2,6-diisopropilo en 200 ml de cloruro de metileno son instilados bajo agitación y a la temperatura de 0 a 5°C en una mezcla de 300 ml de agua, 500 ml de cloruro de metileno, 120 g de carbonato de calcio y 78 g de tiosulfeno. Luego se calienta con reflujo hasta la terminación de desarrollo de CO₂. Después del enfriamiento se filtra, se separa la capa de cloruro de metileno, se seca con cloruro de calcio y se fracciona. Rendimiento: 110 g; P.e. 144-148°C/11 mm Hg.

15 Ejemplo 3

N-(2,6-diisopropil-fenil)-N-ter-pentil-tiourea

11,0 g de isotiocianato de 2,6-diisopropil-fenilo y 10 g de ter-pentilamina son calentados con 5 ml de trietilamina durante 10 minutos a 100°C. Después de un reposo durante 12 horas, la mezcla en parte cristalizada es agitada con éter de petróleo, enfriada hasta -10°C separada por filtración y secado. Rendimiento: 14,0 g; P.f. = 134-135°C.

25 Por reacción de 15,0 g de isotiocianato de 2,6-diisopropilo con 9,0 g de 1,1,2,2-tetrametil-propilamina en 10 ml de trietilamina se obtiene como precedentemente descrito la N-(2,6-

Ejemplo 5

N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-isopropil-tiourea

15,0 g de isotiocianato de 2,6-sec-butil-fenilo son introducidos bajo enfriamiento en 20 g de una solución acuosa al 65% de isopropilamina. Después de una agitación durante 3 horas a 20°C la mezcla de reacción es introducida bajo agitación en ácido clorhídrico diluido, el producto de reacción precipitado en estado cristalino es filtrado por succión y lavado hasta reacción neutra; la pasta es frotada con metanol al 50%, nuevamente filtrada por succión y secada. Rendimiento: 17,0 g; P.f.=108-111°C.

Si en el ejemplo precedente se reemplaza la isopropilamina por 15,0 g de sec-butilamina y se trabaja como se ha indicado, se obtienen la N-(2,6-di-sec-butil-fenil)-N'-sec-butil-tiourea; P.f. 103-105°C.

Por reacción de isotiocianato de 2,6-dietil-fenilo con isopropilamina según el procedimiento precedentemente indicado, se obtiene la N-(2,6-dietil-fenil)-N'-isopropil-tiourea de P.f. = 108-110°C; con sec-butilamina la N-(2,6-dietil-fenil)-N'-sec-butil-tiourea de P.f.=78-80°C.

Ejemplo 6

N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea.

15,0 g de isotiocianato de 2-metil-6-etil-fenilo son introducidos bajo refrigeración en 20,0 g de ter-pentilamina. Al cabo de 2 horas la mezcla es introducida bajo agitación en ácido clorhídrico diluido, el producto de reacción filtrado por suc-

ción, frotado con metanol al 50%, filtrado por succión y secado.

Rendimiento: 19,0 g; P.f. = 78-81°C.

Si en el ejemplo precedentemente la ter-
pentilamina es reemplazada por la misma cantidad de ter-butilamina,
5 se obtiene la N-(2-metil-6-etil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea; P.f. =
94-96°C.

El isotiocianato de 2-metil-6-etil-fenilo
puede ser preparado de la siguiente manera:

10 100 g de 2-metil-6-etil-anilina en 200 ml de cloruro de metileno
son instilados a la temperatura de 0 a 5°C en una mezcla de 500
ml de cloruro de metileno, 300 ml de agua, 120 g de carbonato
de calcio y 103 g de tiosgenio. Luego se calienta con reflujo
hasta terminación del desarrollo de CO₂. Entonces se eliminan los
sólidos por filtración, se separa la capa de cloruro de metileno,
15 se seca con cloruro de calcio y se fracciona.

Rendimiento: 121 g; P.e: 88-91°C/1,0 mm Hg.

Ejemplo 7.

N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ter-butyl-tiourea.

20 15,0 g de isotiocianato de 4-metil-2,6-
dietil-fenilo son introducidos en 20,0 g de ter-butilamina. Se agi-
ta durante 2 horas, se vierte en ácido clorhídrico diluido, se fil-
tra, se lava y se seca.

Rendimiento: 18,0 g P.f. = 121-123°C.

25 Si en el ejemplo precedente se reemplaza
la ter-butilamina por la misma cantidad de ter-pentilamina y se tra-

baja como se ha indicado, se obtiene la N-(4-metil-2,6-dietil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea. P.f. = 98-101^oC.

Análogamente se obtienen a partir de isotiocianato de 2,4-dimetil-6-etil-fenilo y de ter-butilamina, la N-(2,4-dimetil-6-etil-fenil)-N'-ter-butil-tiourea (P.f. = 130-132^oC), y a partir del mismo isotiocianato sustituido y de ter-butil-amina, la N-(2,4-dimetil-6-etil-fenil)-N'-ter-pentil-tiourea (P.f. = 105-107^oC).

El isotiocianato de 4-metil-2,6-dietil-fenilo precedentemente empleado como compuesto de partida, puede ser preparado según la siguiente prescripción:

100 g de 2,4-dimetil-6-etilanilina en 200 ml de cloruro de metileno son instilados a la temperatura de 0 a 5^oC en una mezcla de 500 ml de cloruro de metileno, 300 ml de agua, 120 g de carbonato de calcio y 92 g de tiosogeno, bajo agitación. Subsiguientemente se calienta con reflujo hasta la terminación del desarrollo de CO₂.

Después del enfriamiento, la mezcla de reacción es liberada de sólidos por filtración y la capa de cloruro de metileno es separada, secada con cloruro de calcio y fraccionada.

Rendimiento: 118 g P.eb. 101-104^oC/1,5 mm Hg.

Según el mismo procedimiento se obtiene a partir de 4-metil-2,6-dietil-anilina y de tiosogeno el isotiocianato de 4-metil-2,6-dietil-fenilo. P.eb. 113-116^oC/1,2 mm Hg.

Las N-aril-N'alquil-tioureas según la invención citadas en la tabla que se encontrará más adelante pueden ser preparadas en forma análoga a partir de los correspondientes isotiocianatos de fenilo disustituidos en 2 y 6, y de las correspondientes alquilaminas.

Ejemplo 8

Isotiocianato de 4-ciclohexil-2,6-dietil-fenilo

231 g de 4-ciclohexil-2,6-dietil-anilina en 300 ml de cloruro de metileno son instilados a 10-15°C en una suspensión de 600 ml de cloruro de metileno, 500 ml de agua, 200 g de carbonato de calcio y 140 g de tiosgenio. Luego se calienta a ebullición hasta la terminación del desarrollo de gas. La mezcla de reacción enfriada es liberada de los sólidos por filtración. La capa de cloruro de metileno es secada con cloruro de calcio y fraccionada.

P.e. 175-179°C/1,5 mm Hg. Rendimiento: 251 g.

Análogamente pueden prepararse los siguientes isotiocianatos de arilo a partir de los correspondientes

derivados de anilina:

15	isotiocianato de 2,4,6-trietil-fenilo	P.e.: 128-130°C/1,8 mm Hg.
	isotiocianato de 4-n-propil-2,6-dietil-fenilo	" : 132-137°C/1,5 mm Hg.
	isotiocianato de 4-iso-propil-2,6-dietil-fenilo	" : 130-132°C/1,8 mm Hg.
	isotiocianato de 4-n-butil-2,6-dietil-fenilo	" : 150-155°C/2,0 mm Hg.
	isotiocianato de 4-isobutil-2,6-dietil-fenilo	" : 133-136°C/1,4 mm Hg.
20	isotiocianato de 4-ter-butil-2,6-dietil-fenilo	" : 130-133°C/1,8 mm Hg.
	isotiocianato de 2,6-di-ciclopentil-fenilo	" : 155-158°C/1,3 mm Hg.
	isotiocianato de 4-metil-2,6-diciclopentil-fenilo	" : 188-195°C/2,0 mm Hg.
	isotiocianato de 2,6-di-pentil-(2)-fenilo	" : 148-152°C/1,4 mm Hg.
	isotiocianato de 4-metil-2,6-di-sec-butil-fenilo	" : 130-132°C/1,2 mm Hg.
25	isotiocianato de 2-metil-4,6-di-ter-butil-fenilo	" : 135-139°C/1,5 mm Hg.
	isotiocianato de 3-metil-2,6-dietil-fenilo	" : 110-113°C/1,0 mm Hg.
	isotiocianato de 3-cloro-2,6-dietil-fenilo	" : 118-121°C/1,2 mm Hg.
	isotiocianato de 3,4-dimetil-2,6-dietil-fenilo	" : 125-130°C/1,2 mm Hg.

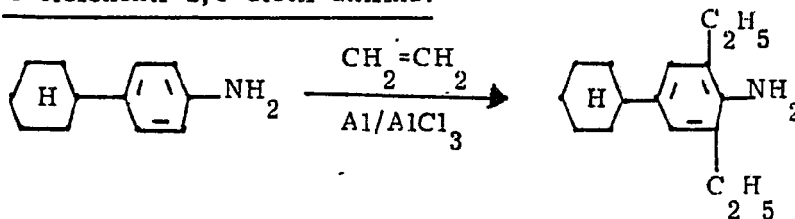
- isotiocianato de 3,5-dimetil-2,6-dietil-fenilo P.e.: 119-127°C/1,0 mm Hg.
isotiocianato de 4-metil-2-etil-6-sec-butil-fenilo " : 126-128°C/1,5 mm Hg.
isotiocianato de 4-metil-2,6-diisopropil-fenilo " : 124-126°C/1,2 mm Hg.
isotiocianato de 2-isopropil-6-sec-butil-fenilo P.f.: 115-117°C/1,0 mm Hg.
- 5 isotiocianato de 2,4,6-tri-isopropil-fenilo " : 130-132°C/1,2 mm Hg.
isotiocianato de 2-etil-6-isopropil-fenilo " : 104-106°C/1,2 mm Hg.

Los derivados de anilina disubstituida en 2,6 necesarios como material de partida para la síntesis de los isotiocianatos de arilo, pueden ser preparados según los procedimientos descritos en Angew. Chemie Tomo 69, páginas 124 y siguientes (1975).

10

Ejemplo 9

4-ciclohexil-2,6-dietil-anilina.



15

300 g de 4-amino-ciclohexilbenzeno, 5,0 g de granulado de aluminio y 17 g de cloruro de aluminio anhidro, son calentados en un autoclave de acero a 250°C, inyectándose etileno hasta una presión interior de 200 atmósferas. Después de la caída de presión, se vuelve a inyectar etileno hasta que termina su absorción, duración aproximadamente 7 horas. Después del enfriamiento, la mezcla es agitada con 500 ml de benceno, 300 ml de lejía de soda cáustica al 40% y 500 ml de agua durante 15 minutos a la temperatura de 40 a 50°C; la fase bencénica es separada, lavada con agua, deshidratada con carbonato de potasio y fraccionada.

20

P.eb. 148-150°C/0,8 mm Hg, rendimiento: 318 g.

25

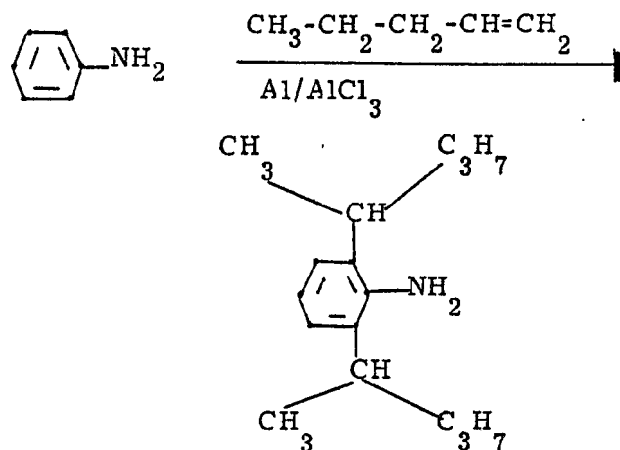
En forma análoga pueden prepararse los si-

guientes derivados de anilina:

	2, 4, 6-trietil-anilina	P. eb: 89-91°C/0, 6 mm Hg.
	4-n-propil-2, 6-dietil-anilina	" : 102°C/1, 4 mm Hg.
	4-isopropil-2, 6-dietil-anilina	" : 103-105°C/2, 0 mm Hg.
5	4-n-butil-2, 6-dietil-anilina	" : 117-118°C/2, 0 mm Hg.
	4-isobutil-2, 6-dietil-anilina	" : 97-99°C/0, 7 mm Hg.
	4-ter-butil-2, 6-dietil-anilina	" : 89-91°C/0, 6 mm Hg.
	2-etil-6-isopropil-anilina	" : 127-128°C/16 mm Hg.
	2-isopropil-6-sec-butil-anilina	" : 136-143°C/13 mm Hg.
10	3-metil-2, 6-dietil-anilina	" : 132-133°C/20 mm Hg.
	3-cloro-2, 6-dietil-anilina	" : 145-148°C/15 mm Hg.
	3, 4-dimetil-2, 6-dietil-anilina	" : 147-148°C/15 mm Hg.
	3, 5-dimetil-2, 6-dietil-anilina	" : 146-154°C/15 mm Hg,
		P. f : 47-50°C
15	4-metil-2, 5-diisopropil-anilina	P. e: 141-143°C/16 mm Hg.

Ejemplo 10

2, 6-bis-(pentil-(2))-anilina



170 g de anilina, 5 g de granulado de aluminio y 15 g de cloruro de aluminio anhidro son calentados en un autoclave de acero hasta 300°C, introduciéndose entonces 300 g de penteno-(1) en aproximadamente 5 horas hasta una presión interior de 300 atmósferas subsiguientemente, la mezcla es mantenida todavía durante 6 horas a 300°C, cayendo la presión interior hasta 107 atmósferas. Después del enfriamiento, el contenido del autoclave es agitado con 500ml de benceno, 250 ml de lejía de soda cáustica al 40 % y 300 ml de agua durante 15 minutos a 30-40°C; la capa bencénica es lavada con agua, deshidratada con carbonato de potasio y fraccionada. Se obtienen 113 g de 2-mono-pentil-(2)-anilina, (P. e. 78-82°C/0,6 mm Hg) y 131 g de 2,6-bis-pentil-(2)-anilina, (P. e. 168-174°C) 1,5 mm Hg).

Análogamente se obtienen a partir de anilina y ciclopenteno:

15 2-ciclopentil-anilina (P. e. 102-109°C/1,7 mm Hg) y
2,6-di-ciclopentil-anilina (P. e. 159-165°C/1,5 mm Hg);

a partir de p-toluidina y ciclopenteno:

4-metil-2-ciclopentil-anilina (P. e. 104-106°C/0,7 mm Hg) y
4-metil-2,6-diciclopentenil-anilina; (P. e. 157-158°C/0,8 mm Hg);

20 a partir de p-toluidina y buteno -(1),

4-metil-2-sec-butil-anilina, (P. e. 72°C/1,0 mm Hg) y
4-metil-2,6-sec-butil-anilina, (P. e. 121-128°C/3,0 mm Hg).

A partir de anilina y buteno-(1) se obtienen análogamente 2-sec-butil-anilina, (p. e. 109-111°C/13 mm Hg)

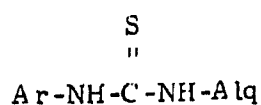
25 2,6-di-sec-butil-anilina, (P. e. 145-147°C/13 mm Hg).

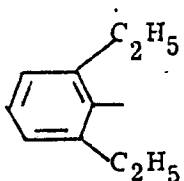
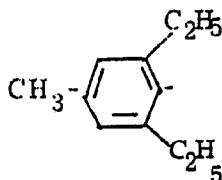
A partir de o-toluidina e isobuteno se obtiene con Tonsil K 10 como catalizador a 200°C y 200 atmósferas de presión la 6-metil-2,4-di-ter-butil-anilina (p. e. 101-103°C/1,1 mm Hg).

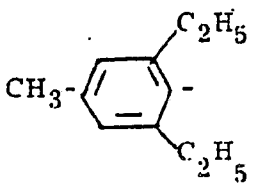
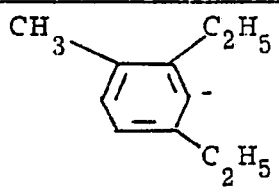
5

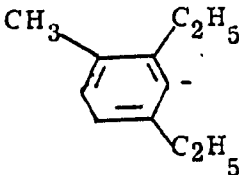
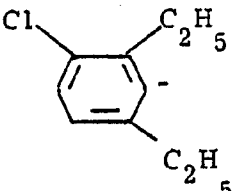
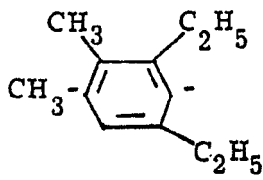
En analogía con los ejemplos 1 a 7 se obtienen las siguientes sustancias activas:

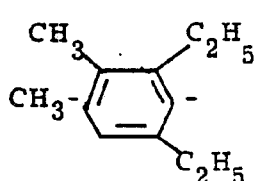
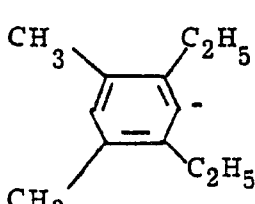
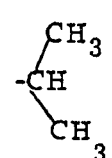
T A B L A

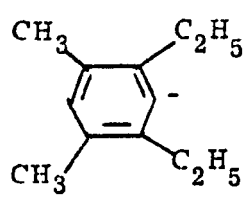
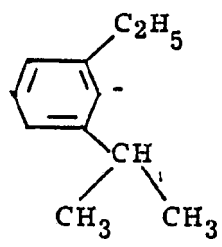


Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
11		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	84-86
12	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	103-104
13	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	109-111
14		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	143-145

Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
15		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	119-120
16	"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	98-100
17	"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	110-112
18	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	70-72
19	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	120-123
20	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \quad \text{CH}_3 \\ \quad \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	124-126
21		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	119-120

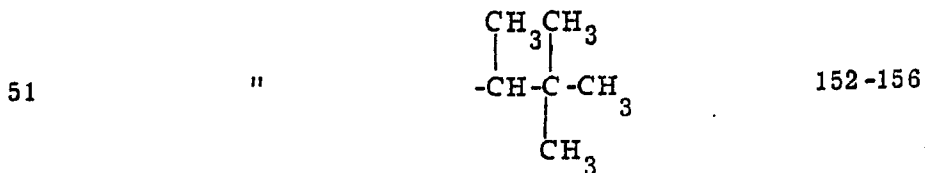
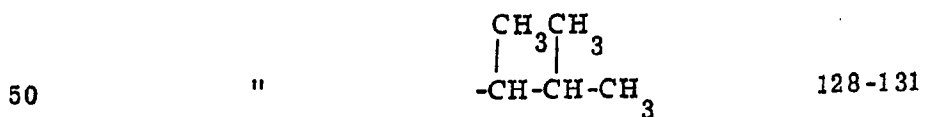
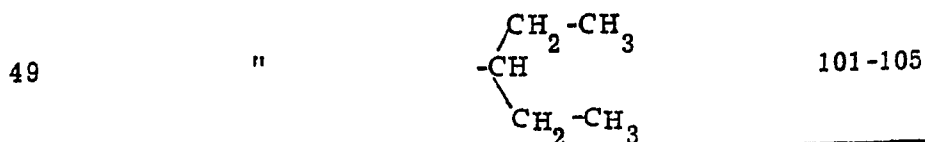
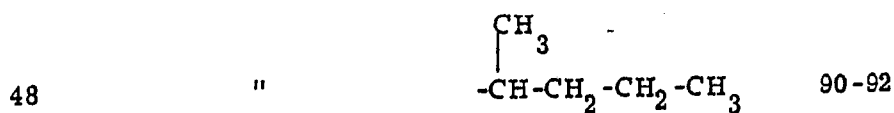
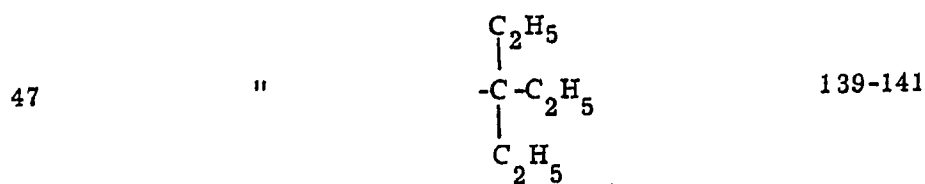
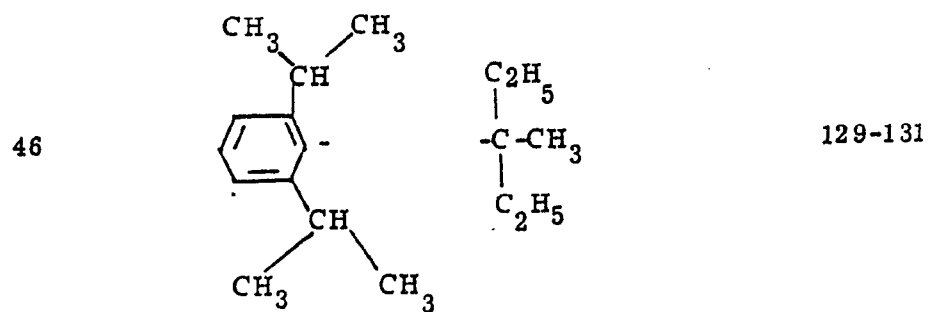
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
22		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	115-117
23	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	123-125
24	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	112-115
25		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	108-110
26	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	95-97
27	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	99-102
28		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	168-169

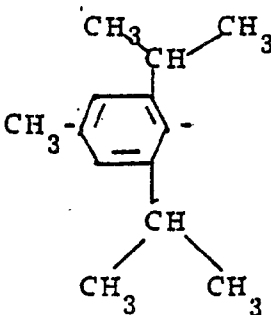

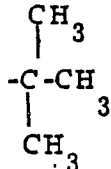
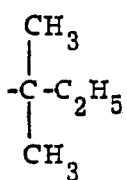
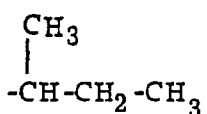
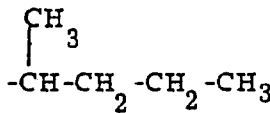
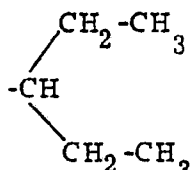
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
29		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	150-151
30	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	144-145 (descomposición)
31	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	133-136
32			152-155
33	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	128-130
34	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	138-140 (descomposición)

Ejem - plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
35		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	130-132
36	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3\text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	151-154
37		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \quad \diagdown \\ -\text{CH} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	89-90
38	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	85-87
39	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	113-115
40	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	97-98

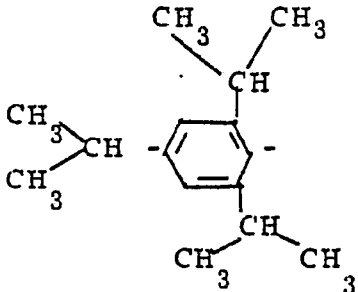
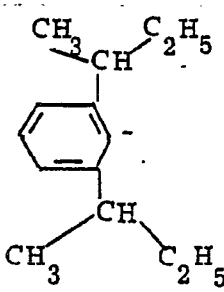
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
41		$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	113-115
42	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	127-128
43		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	104-107
44	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	96-97
45		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	108-112

Ejem - plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
----------------	----	-----	------------

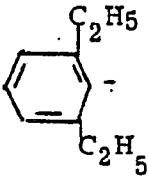
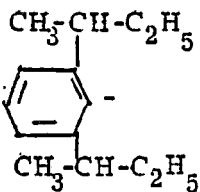
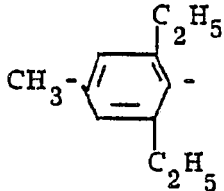
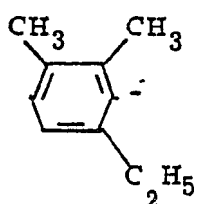
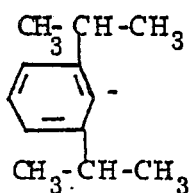
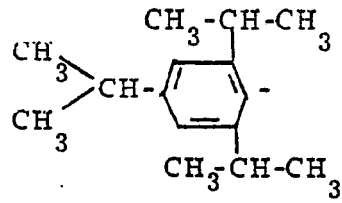


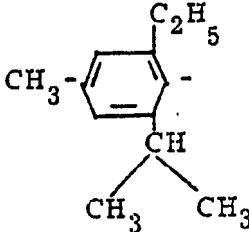
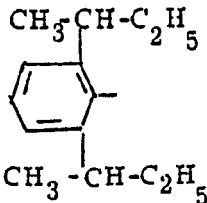
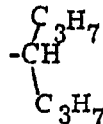
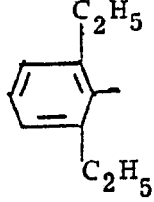
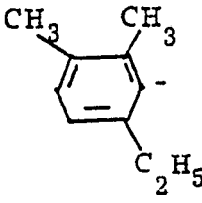
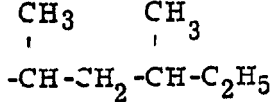
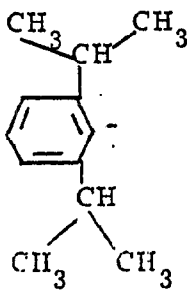
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
52			192-193 (descomposición)
53	"		152-153 (descomposición)
54	"		153-154 (descomposición)
55	"		175-178
56	"		125-128
57	"		170-172

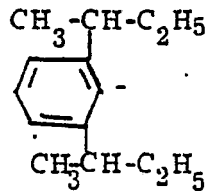
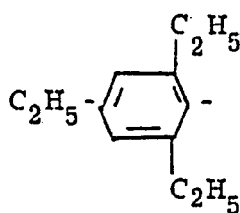
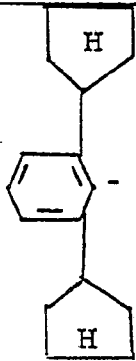
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
58			185-187
59			88-92
60	"		aceite
61			133-135
62	"		120-122
63	"		133-135

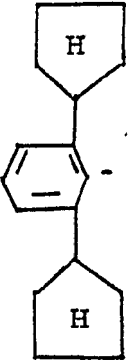
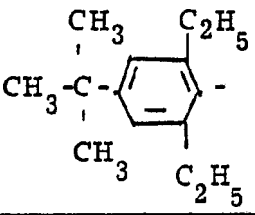
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
64		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	115-118
65	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	120-123
66	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	155-158
67		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
68	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	83-85
69	"	$\begin{array}{c} \text{CH} \text{ CH} \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	96-100

Ejem - plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
70			89-96
71	"		93-96
72			130-132
73	"		120-123
74	"		119-123
75	"		115-117

Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
76		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	103-106
77		"	102-105
78		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	116-118
79		"	118-120
80		"	146-148
81		"	155-160

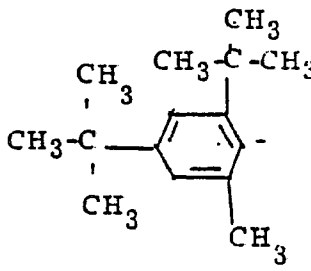
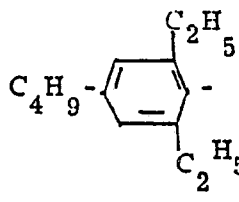
Ejem - plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
82		"	78-87
83			70-73
84		"	102-105
85			aceite
86		"	aceite

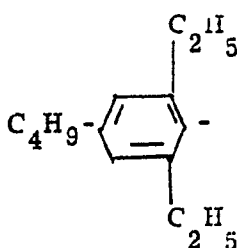
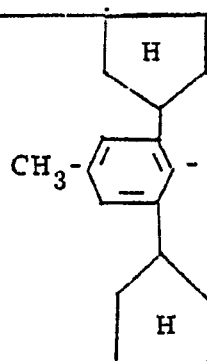
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
87		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	aceite
88		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	70-72
89	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	97-99
90	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	78-80
91	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	88-90
92		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	117-119

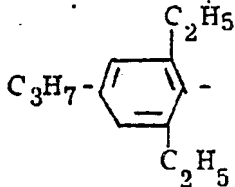
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
93		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	148-152
94	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	128-135 (descomposición)
95	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	135-140 (descomposición)
96		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	100-102
97	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	113-114
98	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	153 (descomposición)

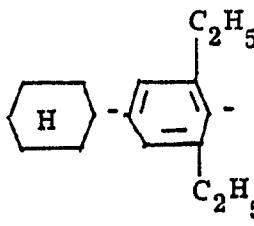
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
99		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	129-130
100	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	163-165
101	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	134-136
102	"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ / \\ -\text{CH} \\ \backslash \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	125-126
103		$\begin{array}{c} \text{CH} \\ \\ 3 \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
104	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	64-66
105	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	74-76

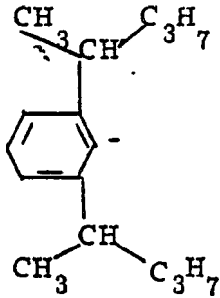
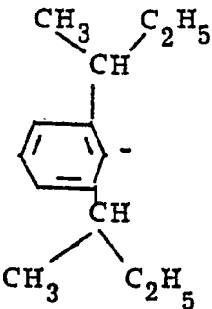
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
106		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	73-74
107	"		84-86
108	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3\text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	100-103
109	"		aceite
110	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3\text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
111		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	132-134
112		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	137-139

Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
113		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	140-143
114	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	156 (descomposición)
115		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
116	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
117	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	82-84
118	"	$\begin{array}{c} \text{CH} \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	52-54

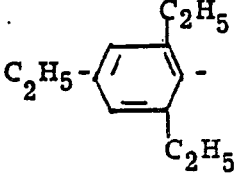
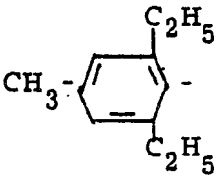
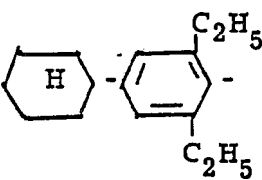
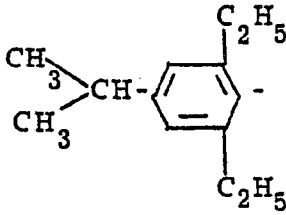
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
119		$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{CH}-\text{C}_4\text{H}_9 \end{array}$	aceite
120		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	137-139
121	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	186-189
122	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	168-170 (descomposición)
123	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	152 (descomposición)

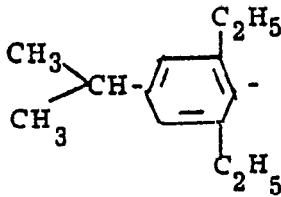
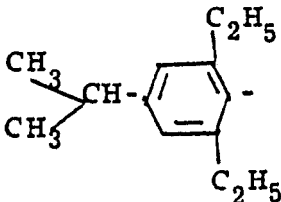
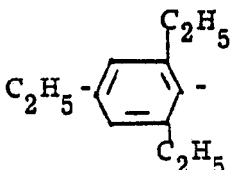
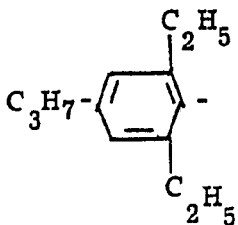
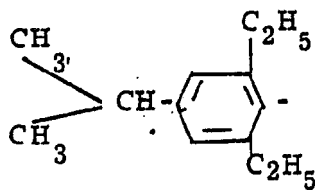
Ejem - plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
124		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
125	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
126	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	aceite
127	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	aceite -
128	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	aceite
129	"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ / \\ -\text{CH} \\ \backslash \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	aceite
130	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite

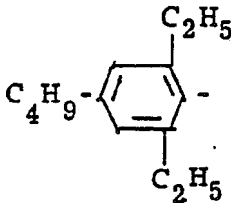
Ejem - plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
131		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	93-95
132	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	120-124
133	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	110-112
134	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	115-118
135	"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ / \\ -\text{CH} \\ \backslash \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	142-144
136	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3\text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	138-140

Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
137		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
138	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
139	"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{CH} \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	aceite
140	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	aceite
141	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	aceite
142		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite

Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
143	<p>Structure: A benzene ring with two isopropyl groups (-CH(CH₃)-C₂H₅) attached at the para position.</p>	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	aceite
144	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	100-103
145	<p>Structure: A benzene ring with two ethyl groups (-C₂H₅) attached at the para position.</p>	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{CH}-\text{C}_4\text{H}_9 \end{array}$	72-75
146	<p>Structure: A benzene ring with two isopropyl groups (-CH(CH₃)-CH₃) attached at the para position.</p>	"	102-104
147	<p>Structure: A benzene ring with three ethyl groups (-C₂H₅) attached at the 1, 3, and 4 positions.</p>	"	aceite
148	<p>Structure: A benzene ring with two isopropyl groups (-CH(CH₃)-C₂H₅) attached at the para position.</p>	"	aceite

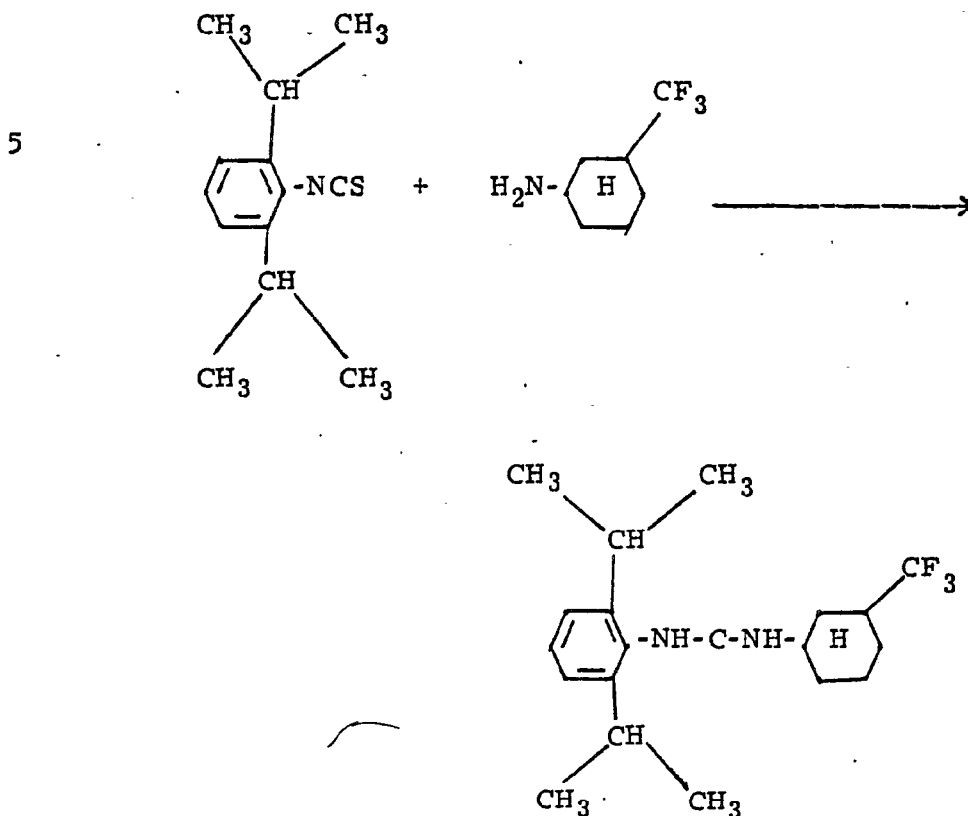
Ejem- plo No.	Ar	Alq	P.f. (°C)
149		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7 \end{array}$	aceite
150	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	aceite
151		"	aceite
152		"	86-92
153		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	117-118
154	"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	91-93°

Ejem - plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
155		$-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-$	98-100
156		$-\overset{\text{CH}_3}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	123-125
157	"	$-\overset{\text{CH}_2-\text{CH}_3}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	112-115
158	"	$-\overset{\text{CH}_3}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	67-70
159		$-\overset{\text{CH}_3}{\text{C}}-\text{C}_5\text{H}_{11}(\text{n})$	aceite
160		"	aceite
161		"	aceite

Ejem- plo No.	Ar	Alq	P. f. (°C)
162		"	aceite

Ejemplo 163.

N-(2, 6-diisopropil-fenil)-N'-(3-trifluometil-ciclohexil-tiourea.

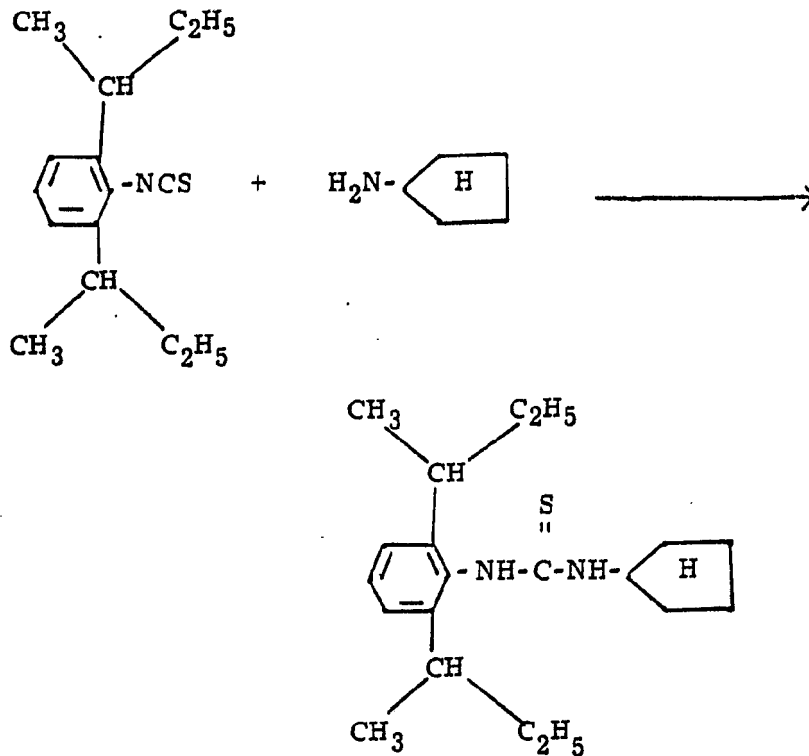


10 Se parte de 16,0 g de 3-trifluometil-ci-
clohexilamina y bajo agitación se introducen 18,0 g de isotiocianato de
2, 6-diisopropil-fenilo. La reacción comienza con un desarrollo debil
de calor. Se deja en reposo durante 12 horas y se agita con ácido clorhí-
drico diluido. El producto cristalino es aislado por filtración, frotado
con metanol diluido, filtrado y secado. Se obtiene el compuesto en for-
ma de una mezcla de estereo-isómeros de P. f. = 67-75°C. Rendimien-

to: 27 g. El análisis elemental, el espectro RMN (resonancia magnética nuclear) y el espectro IR (infrarrojo) coinciden con la composición supuesta.

Ejemplo 164.

5 N-(2, 6-di-sec-butil-fenil)-N'-ciclopentil-tiourea.



Se parte de 20,0 g de ciclopentilamina y

se introducen bajo agitación 15,0 g de isotiocianato de 2, 6-di-sec-bu-
10 til-fenilo. La reacción es exotérmica. Se deja la mezcla de reacción

en reposo durante 12 horas, se la agita con ácido clorhídrico diluído y se la filtra. La torta de la filtración a succión es frotada con metanol diluído, filtrada por succión, lavada y secada. Para una purificación ulterior puede recristalizarse en éter de petróleo.

15 Rendimiento: 18 g ; P.f. = 107-108°C.

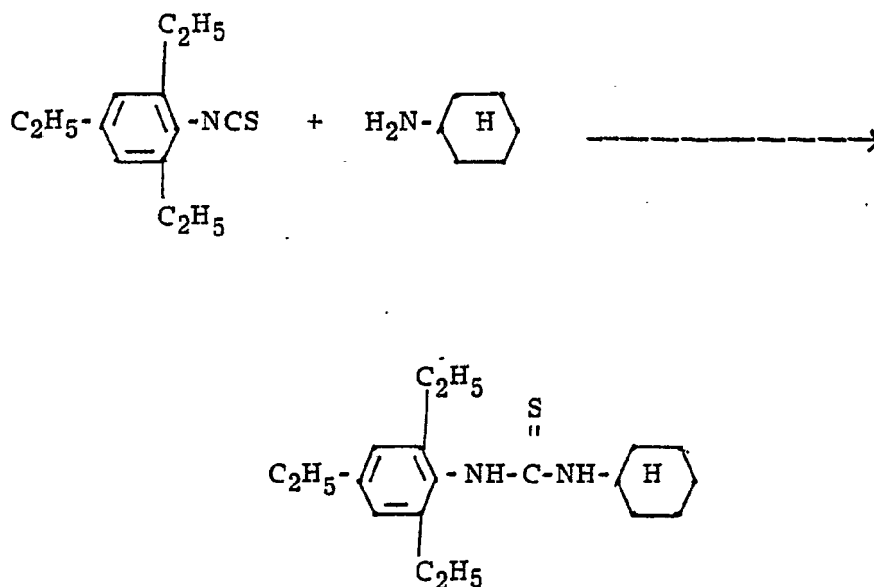
El análisis elemental, el espectro RMN

(resonancia magnética nuclear) y el espectro IR (infrarrojo) coinciden con la constitución supuesta.

En forma análoga puede obtenerse a partir de ciclohexilamina y de isotiocianato de 2, 6-di-sec-butil-fenilo la N-(2, 6-di-sec-butil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea. (P.f. = 140°C).

Ejemplo 165.

N-(2, 4, 6-trietil-fenil)-N'-ciclohexil-tiourea.



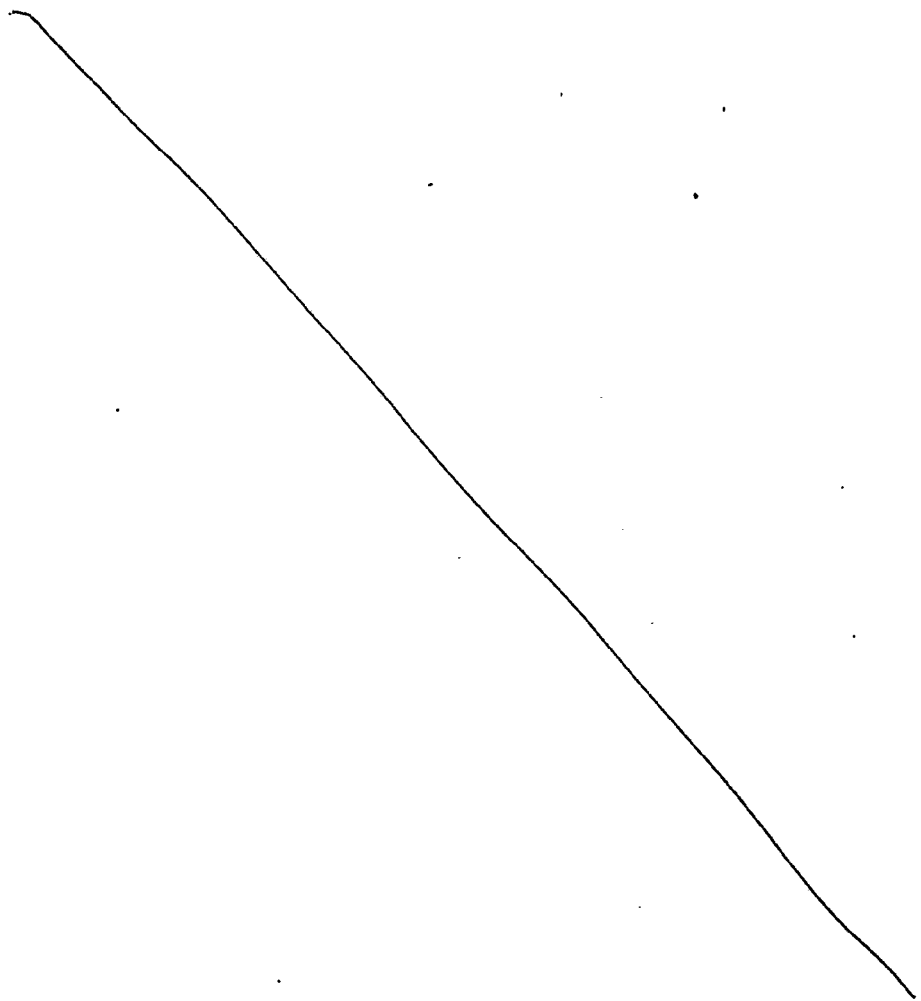
10 Se parte de 20,0 g de ciclohexilamina y se introducen bajo agitación 15,0 g de isotiocianato de 2, 4, 6-trietil-fenilo. La reacción procede bajo un desarrollo debil de calor. Se deja en reposo durante 12 horas, se agita con ácido clorhídrico diluído y se filtra. El producto de la reacción cristalino es frotado con metanol

15 diluído, filtrado por succión, lavado y secado. Rendimiento: 22,0 g P.f. = 97-99°C. El análisis elemental, el espectro RMN (resonancia

magnética nuclear) y el espectro IR (infrarrojo) coinciden con la constitución supuesta.

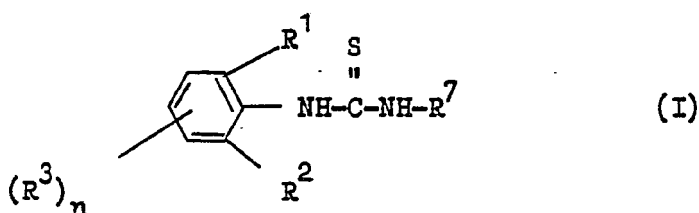
En forma análoga se obtiene la N-(4-n-butil-2, 6-dietil-fenil)-N'-ciclohexil-tioúrea en forma de aceite a partir
5 de ciclohexilamina y de isotiocianato de 4-n-butil-2, 6-dietil-fenilo.

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
10 detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.



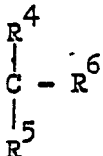
REIVINDICACIONES

1.- Procedimiento para la obtención de N-aril-
(N¹-alquil y N¹-cicloalquil)-tioureas, de fórmula general:



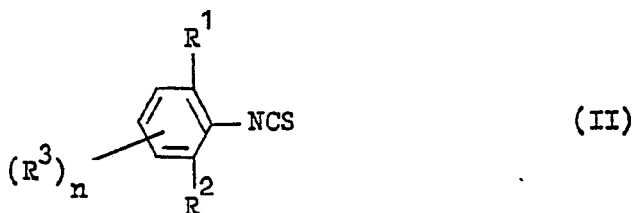
en la cual representan:

5 R¹ alquilo (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇); R² alquilo (C₂-C₆)
o cicloalquilo (C₃-C₇); R³ alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₃-C₆)
cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalqueno (C₅-C₇) o halógeno;
n, un número entero de 0 a 2, y R⁷ cicloalquilo (C₃-C₁₀) even-
10 tualmente sustituido, cicloalqueno (C₅-C₁₀) eventualmente
sustituido o el resto



en el cual

R⁴ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇),
y R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes y representan alquilo
(C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇), y sus sales de adición de ácido
15 fisiológicamente tolerables, caracterizado porque
a) isotiocianatos de arilo de fórmula



en la cual R^1 , R^2 , R^3 y n tienen los significados arriba
indicados, se hacen reaccionar con aminas de fórmula



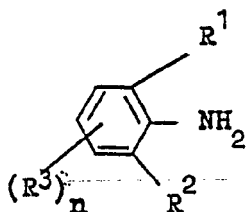
5 en la cual R^7 tiene el significado arriba indicado, eventual-
mente en presencia de disolventes inertes, o

b) isotiocianatos de fórmula



en la cual R^7 tiene el significado arriba indicado, se hacen
reaccionar con arilaminas de fórmula

10



(V)

en la cual R^1 , R^2 , R^3 y n tienen los significados arriba
indicados, eventualmente en presencia de disolventes inertes.

15 2.- Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque en la variante (a) se trabaja
con un exceso de amina de fórmula (III).

3.- Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1 (a y b), caracterizado porque para la producción de
N-aril-N'-alquil-tioureas de fórmula (I) la reacción se lleva
a cabo en presencia de bases orgánicas terciarias a tempera-
20 turas de 10 a 120°C, preferiblemente de 20 a 60°C.

4.- Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1 (a y b), caracterizado porque para la producción de

A large, stylized handwritten signature or set of initials is located in the bottom left corner of the page.

N-aril-N'-cicloalquil-tioureas de la fórmula (I), se lleva a cabo la reacción en presencia de bases orgánicas terciarias a temperaturas de 20 a 150°C, preferiblemente de 40 a 100°C.

5 5.- Procedimiento para la obtención de N-aril-
(N'-alquil y N'-cicloalquil)-tioureas, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 93 hojas escritas a máquina por una sola cara.

- 2 SET 1977

Madrid,

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

10

J. M. GONZÁLEZ ACEBO Y POMBA
p. d. Firmado: Alejandro Callo Lopez