

20 JUL. 1978

ES

11	NUMERO	465.503
21		
22	FECHA DE PRESENTACION	28-12-77

A1



ESPAÑA

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

**PATENTE DE INVENCION**

30	PRIORIDADES:	32	FECHA	33	PAIS
31	NUMERO				
	65973/77		3-6-1.977		Japón

47	FECHA DE PUBLICIDAD	51	CLASIFICACION INTERNACIONAL	62	PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
			C07D/A01N		

64	TITULO DE LA INVENCION
	"PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR N-BENZOILANTRANILATO"

71	SOLICITANTE (S)	(A2671-16) SUMITOMO
	SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED	

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
15, Kitahama-5-chome, Higashi-ku, Osaka, Japón

72	INVENTOR (ES)
	Osamu KIRING, Toshiro KATO y Shigeo YAMAMOTO

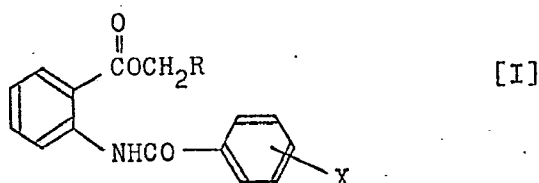
73	TITULAR (ES)

74	REPRESENTANTE	(P.- 67.670)
	DON FERNANDO DE ELZABURU MARQUEZ	

lfg

POOR QUALITY

1 La presente invención se refiere a una composición fungicida que comprende como ingrediente activo un compuesto de N-benzoilantranilato de fórmula:



10 donde X es un átomo de hidrógeno o 3-halógeno (por ejemplo fluor, cloro, bromo, yodo) o un grupo 3-metoxi, 4-metoxi, 2,4-dimetoxi, 3,4-dimetoxi, 3-halo-4-metoxi (por ejemplo 3-cloro-4-metoxi, 3-fluoro-4-metoxi), 3,4-metilendioxi ó 3,5-dimetoxi, y R es un átomo de hidrógeno o un grupo alcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalcoholo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> (por ejemplo clorometilo), alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o N,N-dialcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-aminoalcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y un vehículo inerte, y a su preparación y uso como fungicida.

15 Algunos de los compuestos de N-benzoilantranilato (I) son conocidos por sí mismos (véase J. Am. Chem. Soc. 62 3136 (1940); J. Chem. Soc., 2471 (1954); J. Chem. Soc., 20 4420 (1956); Bull. Soc. Chim. France, 337 (1960)). Sin embargo, nunca se ha intentado estudiar la actividad fungicida de los compuestos de N-benzoilantranilato (I) contra un hongo fitopatógico.

25 Se ha hallado ahora que los compuestos de N-benzoilantranilato (I) tienen efectos prominentes sobre una gama tan amplia de hongos como Piricularia oryzae, Alternaria kikuchiana, Alternaria mali, Venturia inaequalis, Diaporthe citri, Botrytis cinerea, Glomerella cingulate, Sclerotinia cinerea y Phytophthora infestans. Son especialmente eficaces para controlar las enfermedades de mildiú pulverulento

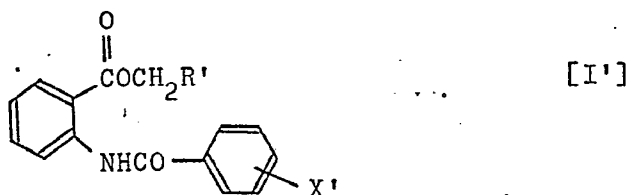
1 en cosechas agrícolas y hortícolas, tales como cereales, co-  
sechas frutales, vegetales y plantas ornamentales, que es-  
tán causadas por hongos fitopatógenos, tales como Podosphe  
ra leucotricha, Phyllactinia pyri, Phyllactinia kakicola,  
5 Uncinula necator, Sphaerotheca fuliginea, Erysiphe cichora-  
cearum, Sphaerotheca pannosa, Sphaerotheca humuli, Erysiphe  
graminis f. sp. hordei y Erysiphe graminis f. sp. tritici.  
Recientemente se ha observado en los campos el brote de pa-  
tógenos de plantas resistentes a los fungicidas, convirtién-  
dose en un serio problema práctico en la protección de cose-  
10 chas por aplicación de fungicidas. Se halló que los compues-  
tos de N-benzoilantranilato (I) presentan fuerte toxicidad  
fungicida, contra esos patógenos resistentes a los fungici-  
das. Por ejemplo, tienen la misma actividad tóxica fungici-  
15 da sobre la cepa resistente al Benomyl de Sphaerotheca fuli-  
ginea y Erysiphe cichoracearum (Ann. Rev. Phytopathology,  
14, 405 (1976)) que sobre las respectivas cepas salvajes  
(cepas susceptibles). Por tanto, se puede esperar que los  
compuestos de N-benzoilantranilato (I) ejerzan un prominen-  
20 te efecto de represión sobre enfermedades de plantas en los  
campos donde ya han brotado patógenos resistentes a los fun-  
gicidas. Ventajosamente, tienen una toxicidad extremadamen-  
te baja, y tienen pocas acciones perjudiciales sobre mamífe-  
ros y peces.

25 Los compuestos de N-benzoilantranilato (I) de la  
presente invención están relacionados estructuralmente con  
algunos de los compuestos expuestos en la bibliografía (J.  
Med. Chem., 11, 369 (1968)), pero su eficacia para reprimir  
las enfermedades de mildiú pulverulento es superior a la de  
30 estos últimos compuestos, y los compuestos de N-benzoilan-

1 - tranilato (I) son todavía eficaces por aplicación a dosis  
menores.

5 Un objeto principal de la presente invención es proporcionar composiciones fungicidas que contienen tales compuestos de N-benzoilantranilato (I), que son útiles como fungicidas. Otro objeto de esta invención es proporcionar nuevos compuestos de N-benzoilantranilato (I'), de la fórmula que se muestra a continuación, que son un ingrediente activo de dichas composiciones fungicidas. Otro objeto más de esta invención es proporcionar un procedimiento para producir tales compuestos de N-benzoilantranilato (I'). Estos y otros objetos y ventajas de la invención serán evidentes por las descripciones anterior y subsiguiente.

15



20

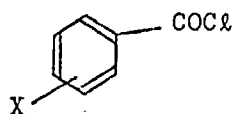
donde X' es un átomo de hidrógeno o de 3-halógeno (por ejemplo fluor, cloro, bromo, yodo), o un grupo 4-metoxi, 2,4-dimetoxi, 3,4-dimetoxi, 3,4-metilendioxi ó 3,5-dimetoxi, y R' es un alcoholo C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalcoholo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> (por ejemplo clorometilo) o N,N-dialcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-aminoalcoholo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

25

Los compuestos de N-benzoilantranilato (I) se pueden preparar haciendo reaccionar un antranilato de fórmula:



1 — donde R es según se ha definido antes, con un cloruro de  
benzoílo de fórmula:



[III]

donde X es según se ha definido antes.

La reacción se efectúa usualmente agitando una  
mezcla del compuesto de antranilato (II) de partida con  
una cantidad equivalente, o en exceso molar, del cloruro  
de benzoílo (III), a temperatura ambiente (0-35°C), en pre  
10 sencia o ausencia de un disolvente inerte (por ejemplo ben  
ceno, tolueno, xileno, tetrahidrofurano, dioxano, cloroben  
ceno, cloroformo, tetracloruro de carbono, nitrobenzeno,  
agua, metanol, etanol, metil-isobutil-cetona, acetona, di  
15 cloruro de metileno, dicloroetano). Cuando se desee, la  
reacción se puede efectuar con calentamiento (hasta a re  
flujo) y/o en presencia de un agente de deshidrocloración  
(por ejemplo piridina, trietilamina, quinoleína, N,N-dime  
tilanilina, N,N-dietilanilina, N-metilmorfolina, metilato  
20 sódico, etilato sódico, hidróxido sódico, amida sódica), de  
manera que se consiga la producción del compuesto buscado,  
suavemente. El compuesto de N-benzoilantranilato (I) así  
producido se puede purificar, si es necesario, por un méto  
do usual por sí mismo, tal como recristalización destila  
25 ción y/o cromatografía en columna.

Los compuestos de N-benzoilantranilato (I) prefe  
ribles como ingrediente activo de la composición fungicida  
de la presente invención son aquellos que tienen la fórmu  
la general (I), donde X es un átomo de hidrógeno, 3-fluor,  
3-cloro, 3-bromo ó 3-yodo, o un grupo 3-metoxi, 4-metoxi,

30

10018

1 2,4-dimetoxi, 3,4-dimetoxi, 3-fluoro-4-metoxi, 3-cloro-4-me  
toxi, 3,4-metilendioxi ó 3,5-dimetoxi, y R es un átomo de  
hidrógeno o un grupo alcoholo  $C_1-C_7$ , ciclopropilo, vinilo,  
2-metilvinilo, clorometilo, metoximetilo o N,N-dimetilamino  
5 metilo; y los compuestos de N-benzoilantranilato (I) más  
preferibles son aquellos que tienen la fórmula general (I),  
donde X es un átomo de hidrógeno y R es un átomo de hidróge  
no o un grupo metilo o vinilo; aquellos que tienen la fórmu  
la general (I), donde X es un átomo de 3-yodo y R es un gru  
10 po metilo, etilo, n-propilo, vinilo, clorometilo o N,N-dime  
tilaminometilo; aquellos que tienen la fórmula general (I),  
donde X es un grupo 4-metoxi y R es un grupo etilo, i-propi  
lo o vinilo; aquellos que tienen la fórmula general (I),  
donde X es un grupo 3,4-dimetoxi y R es un átomo de hidróge  
15 no o un grupo metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, vinilo,  
metoximetilo o N,N-dimetilaminometilo; y aquellos que tie  
nen la fórmula general (I), donde X es un grupo 3,4-metilen  
dioxo y R es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, eti  
lo, n-propilo o metoximetilo.

20 En aplicaciones reales como fungicidas, los com  
puestos de N-benzoilantranilato (I) se pueden usar solos,  
sin incorporación de cualquier otro ingrediente tal como ve  
hículos y diluyentes, o, para más fácil aplicación, en mez  
clas con vehículos o diluyentes sólidos, tales como talco,  
25 arcilla y similares, o con vehículos o diluyentes líquidos,  
tales como disolventes orgánicos y similares. Las composicio  
nes fungicidas se pueden formular en cualquiera de las for  
mas ordinariamente adoptadas, tales como, por ejemplo, pol  
vos finos, polvos humectables, pulverizaciones de aceite,  
aerosoles, tabletas, concentrados emulsificables y gránulos.

1 Las preparaciones anteriores contienen generalmen  
te 1,0 a 95,0% en peso, preferiblemente 2,0 a 80,0% en pe-  
so, del ingrediente activo (incluyendo otros ingredientes  
mezclados). Una cantidad adecuada de las preparaciones apli  
5 cadas es generalmente 10 g a 1.000 g/10 áreas, y la concen-  
tración de las preparaciones aplicadas está preferiblemente  
comprendida entre 0,01 y 0,5% en peso. Sin embargo, dado  
que la cantidad y concentración dependen de las formas de  
preparación, tiempos de aplicación, métodos de aplicación,  
10 puntos de aplicación, enfermedades y cosechas, se pueden  
aumentar o disminuir apropiadamente, con independencia de  
los intervalos antes mencionados.

Además, los compuestos de N-benzoilantranilato  
(I) se pueden usar en mezcla con otros fungicidas tales co  
15 mo, por ejemplo, N-(3,5-diclorofenil)-1,3-dimetilciclopropa-  
no-1,2-dicarboximida, S-n-butyl-S'-p-terc-butylbencil-N-3-  
-piridilditiocarbonimidato, O,O-dimetil-O-2,6-dicloro-4-me-  
tilfenilfosforotioato, 1-(butylcarbamoil)-2-bencimidazolcar-  
bamato de metilo, N-triclorometiltio-4-ciclohexeno-1,2-di-  
20 carboximida, cis-N-(1,1,2,2-tetracloroetiltio)-4-ciclohexe-  
no-1,2-dicarboximida, Polyoxin, estreptomina, etilen-bis-  
(ditiocarbamato) de cinc, dimetiltiocarbamato de cinc,  
etilen-bis(ditiocarbamato) de manganeso, disulfuro de bis-  
(dimetiltiocarbamoilo), tetracloroisofaltonitrilo, 8-hidro-  
25 xiquinolina, acetato de dodecilguanidina, 5,6-dihidro-2-me-  
til-1,4-oxazolin-3-carboxanilida, N'-diclorofluorometiltio-  
-N,N-dimetil-N'-fenilsulfamida, 1-(4-clorofenoxi)-3,3-dime-  
til-1-(1,2,4-triazol-1-il)-2-butanona, 1,2-bis(3-metoxicar-  
bonil-2-tioureido)-benceno, y similares; y los compuestos  
de N-benzoilantranilato (I) también se pueden usar en mez-

30

10018

1 - cla con insecticidas tales como, por ejemplo, O,O-dimetil-  
-O-(4-nitro-m-tolil)-fosforotioato, O-p-cianofenil-O,O-di-  
metilfosforotioato, O-p-cianofenil-O-etilfenilfosfonotioa-  
to, O,O-dimetil-S-(N-metilcarbamoil-metil)-fosforoditioato,  
5 2-metoxi-4H-1,3,2-benzodioxafosforin-2-sulfuro, O,O-dime-  
til-S'-(1-etoxicarbonil-1-fenilmetil)-fosforoditioato,  
 $\alpha$ -ciano-3-fenoxibencil-2-(4-clorofenil)-isovalerato, 3-fe-  
noxibencil-2,2-dimetil-3-(2,2-diclorovinil)-ciclopropano-  
carboxilato, crisantemato de 3-fenoxibencilo, y similares;  
10 y en ningún caso se disminuyen los efectos de represión de  
los productos químicos individuales. Por tanto, es posible  
la represión simultánea de dos o más hongos e insectos da-  
ñinos. Además, se pueden usar en mezcla con productos quí-  
micos agrícolas tales como nematocidas y acaricidas, y con  
15 abonos.

Algunas realizaciones prácticas y actualmente  
preferidas de la presente invención se muestran ilustrati-  
vamente en los ejemplos siguientes, donde las partes y %  
son en peso.

20 Ejemplo 1

Preparación de los compuestos de N-benzoil-antra-  
nilato (I):

25 Un décimo de mol de un antranilato de fórmula  
(II) y 0,11 moles de trietilamina se disolvieron en 200 ml  
de benceno, y se le añadieron 0,1 moles de cloruro de ben-  
zoílo de fórmula (III), gota a gota, lentamente, a tempera-  
tura ambiente, con agitación. Una vez acabada la adición,  
la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla  
de reacción se filtró, y el filtrado se concentró bajo pre-  
30 sión reducida. El residuo obtenido se recristalizó con eta

1 -nol, obteniendo los compuestos de N-benzoilantranilato bus-  
cados, de fórmula (I), con gran rendimiento.

5 Según el método anterior se prepararon los com-  
puestos de N-benzoilantranilato (I) que se muestran en la  
tabla 1.

10

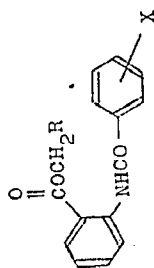
15

20

25

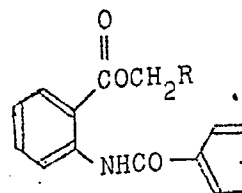
10018

TABLA 1

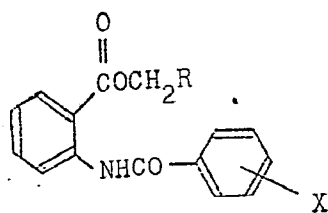


Compuesto nº	X	R	Constante física	Análisis elemental									
				Calc. (%) /					Hallado (%)				
				C	H	N	Halógeno	C	H	N	Halógeno		
1	H	H	pf 101 - 102°C	70,53	5,13	5,49	-	70,47	5,02	5,61	-		
2	3-F	"	pf 104 - 105,5°C	65,93	4,43	5,13	-	65,91	4,43	5,04	-		
3	3-Cl	"	pf 98 - 99°C	62,19	4,18	4,83	12,24 (Cl)	62,18	4,17	4,80	12,43 (Cl)		
4	3-Br	"	pf 90 - 91°C	53,91	3,62	4,19	23,91 (Br)	53,89	3,52	4,18	24,00 (Br)		
5	3-I	"	pf 86 - 87°C	47,27	3,17	3,67	33,29 (I)	47,16	3,07	3,71	33,11 (I)		
6	3-CH <sub>3</sub>	"	pf 86 - 87°C	67,36	5,30	4,91	-	67,42	5,34	4,85	-		
7	4-CH <sub>3</sub>	"	pf 113,5 - 114,5°C	67,36	5,30	4,91	-	67,39	5,35	4,89	-		
8	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	pf 98 - 99°C	64,75	5,43	4,44	-	64,64	5,50	4,35	-		
9	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	pf 109 - 110°C	64,75	5,43	4,44	-	64,80	5,52	4,27	-		
10	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	"	pf 157 - 158°C	62,28	4,18	4,84	-	62,35	4,07	4,67	-		
11	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	"	pf 134 - 135°C	60,11	4,41	4,38	11,09 (Cl)	59,86	4,25	4,23	11,25 (Cl)		
12	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 164 - 165°C	64,21	4,38	4,68	-	64,25	4,43	4,64	-		
13	H	-CH <sub>3</sub>	pf 103 - 104°C	71,36	5,61	5,20	-	71,32	5,64	4,07	-		
14	3-I	"	pf 116,5 - 117,5°C	48,63	3,57	3,54	32,11 (I)	48,59	3,54	3,71	31,95 (I)		
15	4-CH <sub>3</sub>	"	pf 117 - 118°C	68,22	5,72	4,68	-	68,01	5,73	4,70	-		
16	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	pf 91 - 92°C	65,64	5,81	4,25	-	65,55	5,82	4,31	-		
17	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"	pf 110 - 111°C	65,64	5,81	4,25	-	65,68	5,93	4,20	-		
18	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 108 - 109°C	65,17	4,83	4,47	-	64,99	4,78	4,53	-		
19	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	pf 84 - 85°C	72,07	6,05	4,94	-	72,26	6,01	4,80	-		
20	3-I	"	pf 95,5 - 97°C	49,90	3,94	3,42	31,01 (I)	49,71	3,83	3,27	31,22 (I)		

TABLA 1



Compuesto n°	X	R	Constante física	Calc. (%)		
				C	H	N
1	H	H	pf 101 - 102°C	70,53	5,13	5,49
2	3-F	"	pf 104 - 105,5°C	65,93	4,43	5,13
3	3-Cl	"	pf 98 - 99°C	62,19	4,18	4,83
4	3-Br	"	pf 90 - 91°C	53,91	3,62	4,19
5	3-I	"	pf 86 - 87°C	47,27	3,17	3,67
6	3-CH <sub>3</sub> O	"	pf 86 - 87°C	67,36	5,30	4,91
7	4-CH <sub>3</sub> O	"	pf 113,5 - 114,5°C	67,36	5,30	4,91
8	2,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 98 - 99°C	64,75	5,43	4,44
9	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 109 - 110°C	64,75	5,43	4,44
10	3-F, 4-CH <sub>3</sub> O	"	pf 157 - 158°C	62,28	4,18	4,84
11	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub> O	"	pf 134 - 135°C	60,11	4,41	4,38
12	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 164 - 165°C	64,21	4,38	4,68
13	H	-CH <sub>3</sub>	pf 103 - 104°C	71,36	5,61	5,20
14	3-I	"	pf 116,5 - 117,5°C	48,63	3,57	3,54
15	4-CH <sub>3</sub> O	"	pf 117 - 118°C	68,22	5,72	4,68
16	2,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 91 - 92°C	65,64	5,81	4,25
17	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 110 - 111°C	65,64	5,81	4,25
18	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 108 - 109°C	65,17	4,83	4,47
19	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	pf 84 - 85°C	72,07	6,05	4,94
20	3-I	"	pf 95,5 - 97°C	49,90	3,94	3,42



Análisis elemental							
Calc. (%)				Hallado (%)			
C	H	N	Halógeno	C	H	N	Halógeno
70,53	5,13	5,49	-	70,47	5,02	5,61	-
65,93	4,43	5,13	-	65,91	4,43	5,04	-
62,19	4,18	4,83	12,24 (Cl)	62,18	4,17	4,80	12,43 (Cl)
53,91	3,62	4,19	23,91 (Br)	53,89	3,52	4,18	24,00 (Br)
47,27	3,17	3,67	33,29 (I)	47,16	3,07	3,71	33,11 (I)
67,36	5,30	4,91	-	67,42	5,34	4,85	-
67,36	5,30	4,91	-	67,39	5,35	4,89	-
64,75	5,43	4,44	-	64,64	5,50	4,35	-
64,75	5,43	4,44	-	64,80	5,52	4,27	-
62,28	4,18	4,84	-	62,35	4,07	4,67	-
60,11	4,41	4,38	11,09 (Cl)	59,86	4,25	4,23	11,25 (Cl)
64,21	4,38	4,68	-	64,25	4,43	4,64	-
71,36	5,61	5,20	-	71,32	5,64	4,07	-
48,63	3,57	3,54	32,11 (I)	48,59	3,54	3,71	31,95 (I)
68,22	5,72	4,68	-	68,01	5,73	4,70	-
65,64	5,81	4,25	-	65,55	5,82	4,31	-
65,64	5,81	4,25	-	65,68	5,93	4,20	-
65,17	4,83	4,47	-	64,99	4,78	4,53	-
72,07	6,05	4,94	-	72,28	6,01	4,80	-
49,90	3,94	3,42	31,01 (I)	49,71	3,83	3,27	31,22 (I)

TABLE 1  
(continuación)

Compuesto n.º	X	R	Constante física	Análisis elemental									
				Calc. (%)					Hallado (%)				
				C	H	N	Halógeno	C	H	N	Halógeno		
21	4-CH <sub>3</sub> O	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	pf 76 - 77°C	69,00	6,11	4,47	-	68,82	6,03	4,36	-		
22	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 89 - 90°C	66,46	6,16	4,08	-	66,41	6,14	3,99	-		
23	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 101 - 102°C	66,05	5,23	4,28	-	65,89	5,27	4,11	-		
24	3-I	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	pf 85 - 86°C	51,08	4,29	3,31	29,98 (I)	51,05	4,17	3,36	30,13 (I)		
25	2,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 55 - 56°C	67,21	6,49	3,92	-	67,00	6,30	4,18	-		
26	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 91 - 92°C	67,21	6,49	3,92	-	67,18	6,45	4,09	-		
27	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 92 - 93°C	66,85	5,61	4,10	-	66,69	5,71	4,33	-		
28	3,5-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 89 - 90°C	67,21	6,49	3,92	-	67,03	6,54	3,98	-		
29	4-CH <sub>3</sub> O	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	pf 76 - 77°C	69,71	6,47	4,28	-	69,65	6,45	4,30	-		
30	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 87,5 - 89°C	67,21	6,49	3,92	-	67,23	6,46	4,00	-		
31	3-I	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	pf 57 - 58,5°C	52,19	4,61	3,20	29,02 (I)	52,03	4,50	3,04	29,31 (I)		
32	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 75,5 - 76,5°C	67,91	6,78	3,77	-	67,87	6,82	3,80	-		
33	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 94,5 - 95,5°C	67,59	5,96	3,94	-	67,58	6,00	3,85	-		
34	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	pf 120 - 121°C	67,91	6,78	3,77	-	67,87	6,79	3,71	-		
35	3-I	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	pf 60 - 61,5°C	53,23	4,91	3,10	28,12 (I)	53,20	4,68	3,05	28,33 (I)		
36	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 90 - 91°C	68,55	7,06	3,63	-	68,64	7,07	3,63	-		
37	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 61 - 62°C	68,28	6,28	3,79	-	68,35	6,25	3,82	-		
38	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>25</sup> ,5 1,5761	69,71	7,56	3,39	-	69,58	7,72	3,21	-		

TABLA 1  
(continuación)

Compuesto n°	X	R	Constante física	Calc. (%)		
				C	H	N
21	4-CH <sub>3</sub> O	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	pf 76 - 77°C	69,00	6,11	4,47
22	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 89 - 90°C	66,46	6,16	4,08
23	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 101 - 102°C	66,05	5,23	4,28
24	3-I	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	pf 85 - 86°C	51,08	4,29	3,31
25	2,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 55 - 56°C	67,21	6,49	3,92
26	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 91 - 92°C	67,21	6,49	3,92
27	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 92 - 93°C	66,85	5,61	4,10
28	3,5-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 89 - 90°C	67,21	6,49	3,92
29	4-CH <sub>3</sub> O	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	pf 76 - 77°C	69,71	6,47	4,28
30	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 87,5 - 89°C	67,21	6,49	3,92
31	3-I	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	pf 57 - 58,5°C	52,19	4,61	3,20
32	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 75,5 - 76,5°C	67,91	6,78	3,77
33	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 94,5 - 95,5°C	67,59	5,96	3,94
34	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	pf 120 - 121°C	67,91	6,78	3,77
35	3-I	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	pf 60 - 61,5°C	53,23	4,91	3,10
36	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 90 - 91°C	68,55	7,06	3,63
37	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 61 - 62°C	68,28	6,28	3,79
38	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\   \\ -\text{CH}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{array}$	n <sub>D</sub> <sup>25,5</sup> 1,5761	69,71	7,56	3,39

TABLA 1  
(continuación)

Análisis elemental							
Calc. (%)				Hallado (%)			
C	H	N	Halógeno	C	H	N	Halógeno
69,00	6,11	4,47	-	68,82	6,03	4,36	-
66,46	6,16	4,08	-	66,41	6,14	3,99	-
66,05	5,23	4,28	-	65,89	5,27	4,11	-
51,08	4,29	3,31	29,98 (I)	51,05	4,17	3,36	30,13 (I)
67,21	6,49	3,92	-	67,00	6,30	4,18	-
67,21	6,49	3,92	-	67,18	6,45	4,09	-
66,85	5,61	4,10	-	66,69	5,71	4,33	-
67,21	6,49	3,92	-	67,03	6,54	3,98	-
69,71	6,47	4,28	-	69,65	6,45	4,30	-
67,21	6,49	3,92	-	67,23	6,46	4,00	-
C 52,19	4,61	3,20	29,02 (I)	52,03	4,50	3,04	29,31 (I)
C 67,91	6,78	3,77	-	67,87	6,82	3,80	-
C 67,59	5,96	3,94	-	67,58	6,00	3,85	-
67,91	6,78	3,77	-	67,87	6,79	3,71	-
C 53,23	4,91	3,10	28,12 (I)	53,20	4,68	3,05	28,33 (I)
68,55	7,06	3,63	-	68,64	7,07	3,63	-
68,28	6,28	3,79	-	68,35	6,25	3,82	-
69,71	7,56	3,39	-	69,58	7,72	3,21	-

TABLA 1  
(continuación)

Compuesto nº	X	R	Constante física	Análisis elemental									
				Calc. (%)					Hallado (%)				
				C	H	N	Halógeno	C	H	N	Halógeno		
39	3-I	$\triangleleft$	pf 136 - 137°C	51,33	3,83	3,33	30,13 (I)	51,37	3,83	3,40	30,25 (I)		
40	H	-CH = CH <sub>2</sub>	pf 65,5 - 66,5°C	72,58	5,37	4,98	-	72,58	5,24	4,94	-		
41	3-I	"	pf 70 - 71,5°C	50,14	3,47	3,44	31,16 (I)	49,95	3,29	3,46	31,30 (I)		
42	4-CH <sub>3</sub>	"	pf 91 - 92°C	69,45	5,50	4,50	-	69,61	5,45	4,58	-		
43	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 100 - 101°C	66,85	5,61	4,10	-	67,13	5,54	4,38	-		
44	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 115,5 - 116,5°C	66,46	4,65	4,31	-	66,35	4,61	4,43	-		
45	3-I	-CH = CH-CH <sub>3</sub>	pf 79 - 81°C	51,33	3,83	3,33	30,13 (I)	51,08	3,61	3,26	30,42 (I)		
46	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 94 - 95°C	67,25	5,05	4,13	-	67,03	4,95	3,92	-		
47	3-I	-CH <sub>2</sub> Cl	pf 103,5 - 105°C	44,73	3,05	3,26	29,54 (I) 8,25 (Cl)	44,59	2,98	3,34	29,65 (I) 8,37 (Cl)		
48	H	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	pf 105 - 106°C	68,22	5,72	4,68	-	68,25	5,81	4,77	-		
49	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 96,5 - 97,5°C	63,50	5,89	3,90	-	63,75	5,85	4,19	-		
50	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 102 - 104°C	62,97	4,99	4,08	-	63,12	5,20	3,95	-		
51	3-I	-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	pf 65 - 66°C	49,33	4,37	6,39	28,96 (I)	49,35	4,21	6,52	28,77 (I)		
52	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 96 - 97°C	64,50	6,50	7,52	-	64,44	6,43	7,30	-		

TABLA 1  
(continuación)

Compuesto n°	X	R	Constante física	Calc. (%)		
				C	H	N
39	3-I		pf 136 - 137°C	51,33	3,83	3,33
40	H	-CH = CH <sub>2</sub>	pf 65,5 - 66,5°C	72,58	5,37	4,98
41	3-I	"	pf 70 - 71,5°C	50,14	3,47	3,44
42	4-CH <sub>3</sub> O	"	pf 91 - 92°C	69,45	5,50	4,50
43	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 100 - 101°C	66,85	5,61	4,10
44	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 115,5 - 116,5°C	66,46	4,65	4,31
45	3-I	-CH = CH-CH <sub>3</sub>	pf 79 - 81°C	51,33	3,83	3,33
46	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 94 - 95°C	67,25	5,05	4,13
47	3-I	-CH <sub>2</sub> Cl	pf 103,5 - 105°C	44,73	3,05	3,26
48	H	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	pf 105 - 106°C	68,22	5,72	4,68
49	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 96,5 - 97,5°C	63,50	5,89	3,90
50	3,4-OCH <sub>2</sub> O-	"	pf 102 - 104°C	62,97	4,99	4,08
51	3-I	-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	pf 65 - 66°C	49,33	4,37	6,39
52	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	"	pf 96 - 97°C	64,50	6,50	7,52

TABLA 1  
(continuación)

ca	Análisis elemental							
	Calc. (%)				Hallado (%)			
	C	H	N	Halógeno	C	H	N	Halógeno
3	51,33	3,83	3,33	30,13 (I)	51,37	3,83	3,40	30,25 (I)
5 <sup>º</sup> C	72,58	5,37	4,98	-	72,58	5,24	4,94	-
5 <sup>º</sup> C	50,14	3,47	3,44	31,16 (I)	49,95	3,29	3,46	31,30 (I)
3	69,45	5,50	4,50	-	69,61	5,45	4,58	-
3	66,85	5,61	4,10	-	67,13	5,54	4,38	-
5 <sup>º</sup> C	66,46	4,65	4,31	-	66,35	4,61	4,43	-
3	51,33	3,83	3,33	30,13 (I)	51,08	3,61	3,26	30,42 (I)
2 <sup>º</sup> C	67,25	5,05	4,13	-	67,03	4,95	3,92	-
3	44,73	3,05	3,26	29,54 (I) 8,25 (Cl)	44,59	2,98	3,34	29,65 (I) 8,37 (Cl)
3	68,22	5,72	4,68	-	68,25	5,81	4,77	-
5 <sup>º</sup> C	63,50	5,89	3,90	-	63,75	5,85	4,19	-
3	62,97	4,99	4,08	-	63,12	5,20	3,95	-
3	49,33	4,37	6,39	28,96 (I)	49,35	4,21	6,52	28,77 (I)
3	64,50	6,50	7,52	-	64,44	6,43	7,30	-

## 1 Ejemplo 2

## Formulación de composiciones:

a) Polvo fino

5 2 partes del compuesto (14) y 98 partes de arcilla se pulverizaron a fondo y se mezclaron entre ellos, obteniendo un polvo fino que contenía 2% del ingrediente activo. En la aplicación, el polvo fino se espolvoreó como tal.

b) Polvo

10 3 partes del compuesto (27) y 97 partes de talco se pulverizaron a fondo y se mezclaron entre ellos, obteniendo un polvo fino que contenía 3% del ingrediente activo. En la aplicación, el polvo fino se espolvoreó como tal.

c) Polvo humectable

15 50 partes del compuesto (1), 5 partes de un agente humectante del tipo de alcoholbencenosulfonato, y 45 partes de tierra de diatomeas, se pulverizaron a fondo y se mezclaron entre ellos, obteniendo un polvo humectable que contenía 50% del ingrediente activo. En la aplicación, el polvo humectable se diluyó con agua, y la solución resultante se pulverizó.

d) Polvo humectable

20 80 partes del compuesto (17), 8 partes de un agente humectante del tipo de alcoholbencenosulfonato, y 12 partes de tierra de diatomeas, se pulverizaron a fondo y se mezclaron entre ellos, obteniendo un polvo humectable que contenía 80% del ingrediente activo. En la aplicación, el polvo humectable se diluyó con agua, y la solución resultante se pulverizó.

e) Concentrado emulsificable

30 10 partes del compuesto (49), 40 partes de sulfó-

1 xido de dimetilo, 40 partes de xileno y 10 partes de un  
emulgente del tipo de éter de polioxietilendodecifenol, se  
mezclaron entre ellos, obteniendo un concentrado emulsifica  
ble que contenía 10% del ingrediente activo. En la aplica  
5 ción, el concentrado emulsificable se diluyó con agua, y la  
emulsión resultante se pulverizó.

f) Gránulos

5 partes del compuesto (43), 93,5 partes de arcilla y 1,5 partes de un adhesivo del tipo de poli(alcohol vi  
10 nílico), se pulverizaron a fondo y se mezclaron entre ellos,  
se amasaron con agua y luego se granularon y secaron, obteniendo unos gránulos que contenían 5% del ingrediente activo.

Los siguientes ejemplos muestran algunos datos de  
15 ensayo típicos en soporte de la excelente actividad de los  
compuestos de N-benzoilntranilato (I). En estos ejemplos,  
los números de los compuestos corresponden a los de la tabla 1.

Ejemplo 3

20 Ensayo de actividad protectora sobre el mildiú  
polverulento del pepino (Sphaerotheca fuliginea)

Quando se cultivó pepino (var.: Sagami-hanjiro)  
hasta la etapa de primera hoja verdadera, en un tiesto de 9  
cm de diámetro, se cortaron las hojas verdaderas y se pulve  
25 rizó sobre el cotiledón una solución acuosa de cada concentrado emulsificable, en cantidad de 10 ml por tiesto. Tras  
1 día se inoculó el pepino por pulverización de una suspensión de esporas de Sphaerotheca fuliginea. Tras otros 14  
días se observó el estado de infección. La severidad de la  
30 enfermedad se calculó por el siguiente método: las hojas

1 examinadas se midieron para determinar el tanto por ciento  
de área infestada, y se clasificaron en los correspondien-  
tes índices de enfermedad, 0, 1, 2, 3, 4, 5; se sumaron las  
5 hojas que pertenecían a los mismos índices de enfermedad; y  
la severidad de la enfermedad se calculó según la ecuación  
siguiente:

Índice de enfermedad	Estado de infección
0	Ninguna colonia sobre la superficie de la hoja
10 1	Colonia menor del 10% sobre la superficie de la hoja
2	Id. menor del 30% íd. íd.
3	Id. menor del 60% íd. íd.
4	Id. menor del 95% íd. íd.
5	Id. no menor del 95% íd. íd.

15	Severidad de la enfermedad	=	$\frac{\sum (\text{índice de enfermedad} \times \text{número de hojas})}{5 \times (\text{número total de hojas examinadas})} \times 100$
----	----------------------------------	---	--

Los resultados del ensayo se muestran en la tabla  
2. Los compuestos de la presente invención mostraron una ac-  
tividad protectora superior que los compuestos testigo, co-  
mo es evidente por los resultados de ensayo.

1

TABLA 2

Compuesto nº	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
1	50	0,0
2	"	2,0
3	"	0,0
4	"	1,0
5	"	0,0
6	"	1,0
7	"	0,0
8	"	0,0
9	"	0,0
10	"	0,0
11	"	0,0
12	"	0,0
13	"	1,0
14	"	0,0
15	"	0,0
16	"	0,0
17	"	0,0
18	"	0,0
19	"	2,0
20	"	0,0
21	"	1,0
22	"	0,0
23	"	0,0
24	"	0,0
25	"	1,0

5

10

15

20

25

30

10018

1

TABLA 2  
(continuación)

5

Compuesto nº	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
26	50	0,0
27	"	0,0
28	"	1,0
29	"	1,0
30	"	1,0
31	"	2,0
32	"	0,0
33	"	0,0
34	"	2,5
35	"	1,0
36	"	0,0
37	"	0,0
38	"	3,0
39	"	1,0
40	"	0,0
41	"	0,0
42	"	1,0
43	"	0,0
44	"	0,0
45	"	2,0
46	"	1,0
47	"	0,0
48	"	1,0
49	"	0,0

10

15

20

25

30

TABLA 2  
(continuación)

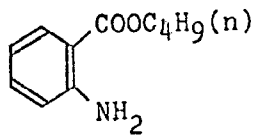
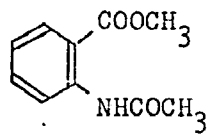
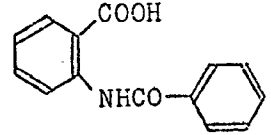
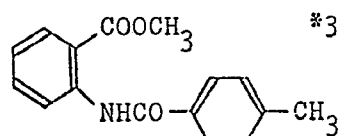
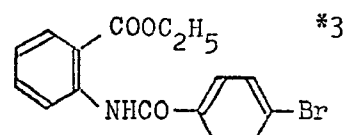
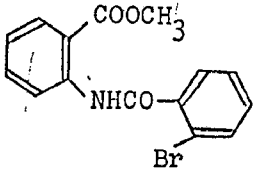
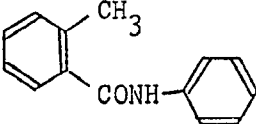
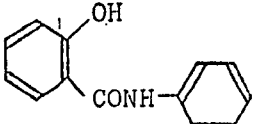
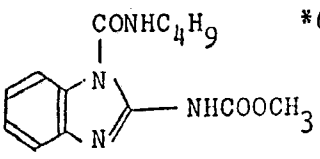
Compuesto n <sup>o</sup>	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
50	50	0,0
51	"	0,0
52	"	0,0
 <chem>CCCCCCCCCOC(=O)c1cccc(N)c1</chem> *1	"	100,0
 <chem>CC(=O)Nc1ccccc1C(=O)OC</chem> *2	"	100,0
 <chem>O=C(O)c1ccccc1NC(=O)c2ccccc2</chem> *3	"	100,0
 <chem>CC(=O)Nc1cccc(C)c1C(=O)OC</chem> *3	"	100,0
 <chem>CCOC(=O)c1ccccc1NC(=O)c2ccccc2Br</chem> *3	"	100,0

TABLA 2  
(continuación)

Compuesto n°	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
 *3	50	98,0
 *4	"	100,0
 *5	"	100,0
 *6	"	7,5
Sin tratamiento	-	100,0

## Notas:

\*1 Compuesto expuesto en J.Med.Chem., vol. 11, 369 (1968)

\*2 Compuesto expuesto en Can.J.Chem., vol. 46, 2589 (1968)

\*3 Compuestos expuestos en Bull.Soc.Chim.France, 337 (1960)

\*4 Fungicida disponible en el comercio: mebenil

\*5 Fungicida disponible en el comercio: salicilanilida

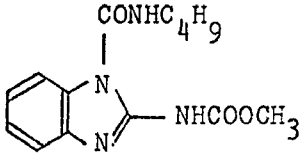
\*6 Fungicida disponible en el comercio: benomyl

1 Ejemplo 4. Ensayo de actividad protectora con patógenos re  
sistentes a los pesticidas

Se efectuó un ensayo de actividad protectora con  
tra el mildiú pulverulento del pepino (Sphaerotheca fuligi  
5 nea de la misma manera que en el ejemplo 3, usando Sphaero  
theca fuliginea resistente al 1-(butilcarbamoil)-2-bencimi  
dazolcarbamato de metilo. La investigación de la infección  
y el cálculo de la severidad de la enfermedad se efectua-  
ron de la misma manera que en el ejemplo 3.

10 Los resultados de ensayo se muestran en la tabla  
3. Como es evidente por comparación entre los resultados  
de ensayo de este ejemplo y el ejemplo 3, el compuesto tes  
tigo, benomyl (1-(butilcarbamoil)-2-bencimidazolcarbamato  
de metilo) presenta un efecto de represión sobre las cepas  
15 salvajes (cepas susceptibles), pero tiene poco o ningún  
efecto de represión sobre las cepas resistentes a los pes  
ticidas. Sin embargo, los compuestos de la presente inven  
ción presentan fuerte efecto de represión sobre las cepas  
resistentes a los pesticidas, así como sobre las cepas sus  
20 ceptibles.

TABLA 3

Compuesto n°	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
1	50	0,0
5	"	0,0
8	"	1,0
14	"	0,0
18	"	0,0
21	"	2,0
22	"	1,0
23	"	0,0
24	"	0,0
26	"	0,0
27	"	0,0
40	"	0,0
43	"	1,0
49	"	1,0
50	"	0,0
 <chem>CCCC(=O)Nc1nc2ccccc2n1C(=O)OC</chem> *1	"	95,0
Sin tratamiento	-	100,0

Nota:

\*1 Fungicida disponible en el comercio: benomyl

1 Ejemplo 5. Ensayo de actividad protectora con mildiú pulve-  
 5 rulento de la cebada (Erysiphe graminis)

Cuando se cultivó cebada (var.: Akashinriki) has-  
 ta una etapa de primera hoja verdadera, en un tiesto de 9  
 5 cm de diámetro, se pulverizó sobre las hojas una solución  
 acuosa de cada concentrado emulsificable, en cantidad de 10  
 ml por tiesto. Tras haber secado al aire la solución, la ce-  
 bada se inoculó con Erysiphe graminis y se cultivó durante  
 10 días bajo luz fluorescente, a 18°C. Después se observó  
 el estado de la infección. La investigación de la infección  
 y el cálculo de la severidad de la enfermedad se hicieron  
 de la misma manera que en el ejemplo 3.

Los resultados del ensayo se muestran en la Tabla  
 4. Como es evidente por los resultados, los compuestos de  
 15 la presente invención mostraron una actividad protectora  
 más superior que los compuestos testigo.

TABLA 4

Compuesto nº	Concentración de ingredien- te activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
1	50 10	0,0 0,0
5	50 10	0,0 0,5
7	50 10	1,0 2,0
8	50 10	0,0 0,5

TABLA 4  
(continuación)

Compuesto nº	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
9	50 10	0,0 1,0
12	50 10	0,0 1,0
14	50 10	0,0 0,0
17	50 10	0,0 0,0
18	50 10	0,0 0,0
20	50 10	0,0 0,5
22	50 10	0,0 1,0
23	50 10	0,0 0,0
24	50 10	0,0 0,0
25	50 10	1,5 3,0
26	50 10	0,0 0,0
27	50 10	0,0 0,0
28	50 10	0,5 3,0

TABLA 4  
(continuación)

Compuesto nº	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
29	50 10	1,0 2,0
30	50 10	1,0 1,5
36	50 10	0,0 0,5
37	50 10	0,0 0,0
40	50 10	0,0 0,0
42	50 10	1,0 3,0
43	50 10	0,0 0,0
44	50 10	0,0 0,0
45	50 10	2,5 6,5
47	50 10	0,0 0,5
48	50 10	1,0 2,5
49	50 10	0,0 0,0
50	50 10	0,0 0,5

30

10018

TABLA 4  
(continuación)

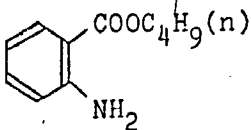
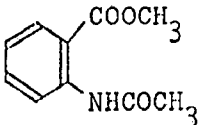
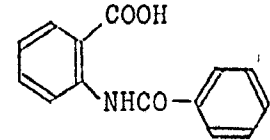
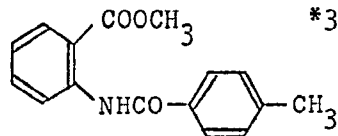
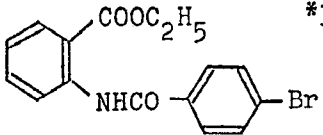
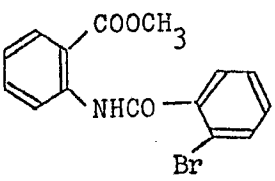
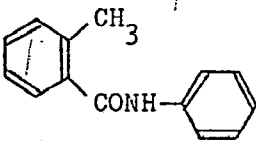
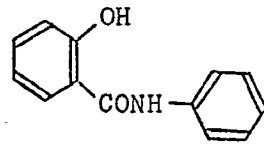
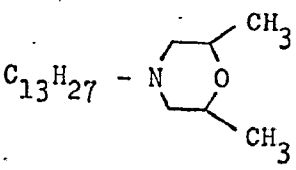
Compuesto nº	Concentración de ingredien- te activo (ppm)	Severidad de la enfermedad
 <chem>CCCCOC(=O)c1cccc(N)c1</chem> *1	50	100,0
 <chem>CC(=O)Nc1ccccc1C(=O)OC</chem> *2	"	100,0
 <chem>O=C(O)c1ccccc1NC(=O)c2ccccc2</chem> *3	"	100,0
 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2ccccc2C(=O)OC</chem> *3	"	100,0
 <chem>CCOC(=O)c1ccccc1NC(=O)c2ccc(Br)cc2</chem> *3	"	100,0
 <chem>COC(=O)c1ccccc1NC(=O)c2ccccc2Br</chem> *3	"	95,0

TABLA 4  
(continuación)

Compuesto n°	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
 #4	50	100,0
 #5	"	100,0
 #6	50 10	1,0 37,5
Sin tratamiento	-	100,0

Notas:

\*1 Compuesto expuesto en J.Med.Chem., vol. 11, 369 (1968)

\*2 Compuesto expuesto en Can.J.Chem., vol. 46, 2589 (1968)

\*3 Compuestos expuestos en Bull.Soc.Chim.France, 337 (1960)

\*4 Fungicida disponible en el comercio: mebenil

\*5 Fungicida disponible en el comercio: salicilanilida

\*6 Fungicida disponible en el comercio: tridemorph

1 Ejemplo 6. Ensayo de actividad protectora con mildiú pulve  
 rulento de la manzana (Podospaera leucotricha)  
 Brotes de manzana (var. Kougyoku) se sometieron a  
 pulverización con una solución acuosa de cada concentrado  
 5 emulsificable, en cantidad de 40 ml por planta. Tras haber  
 secado al aire la solución, las plantas de ensayo se inocu-  
 laron con Podospaera leucotricha y se cultivaron durante  
 14 días bajo luz fluorescente, a 20°C. Después se determina-  
 ron las magnitudes de infección y los tantos por ciento de  
 10 severidad de la enfermedad se calcularon de la misma manera  
 que en el ejemplo 3.

Los resultados de ensayo se muestran en la tabla  
 5. Como es evidente por los resultados, los compuestos de  
 la presente invención mostraron una actividad de protección  
 15 más superior que los compuestos testigo.

TABLA 5

20 Compuesto nº	Concentración de ingredien- te activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
1	100	0,0
9	"	2,5
14	"	0,0
25 23	"	5,0
24	"	0,0
30 40	"	0,0

TABLA 5  
(continuación)

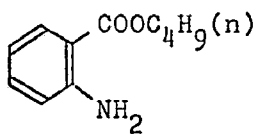
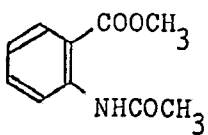
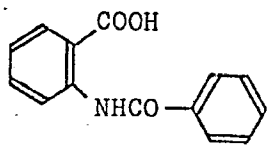
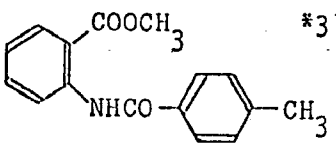
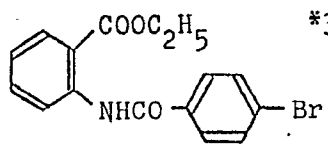
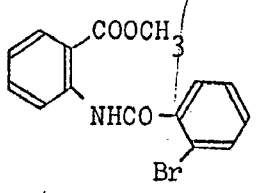
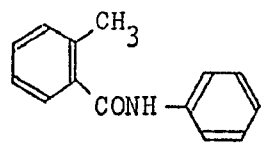
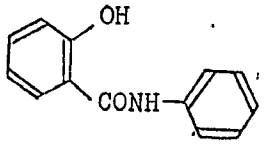
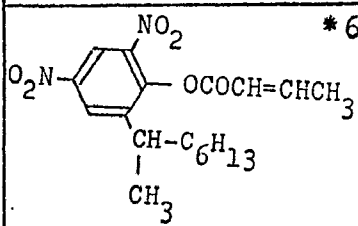
Compuesto nº	Concentración de ingredien- te activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
48	100	2,5
51	"	5,0
10  *1	"	72,5
15  *2	"	85,0
20  *3	"	70,0
25  *3	"	80,0
 *3	"	75,0

TABLA 5  
(continuación)

Compuesto n°	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
 *3	100	70,0
 *4	"	77,5
 *5	"	85,0
 *6	"	22,5
Sin tratamiento	-	85,0

## Notas:

\*1 Compuesto expuesto en J.Med.Chem., vol. 11, 369 (1968)

\*2 Compuesto expuesto en Can.J.Chem., vol. 46, 2589 (1968)

\*3 Compuesto expuesto en Bull.Soc.Chim.France, 337 (1960)

\*4 Fungicida disponible en el comercio: mebenil

\*5 Fungicida disponible en el comercio: salicilanilida

\*6 Fungicida disponible en el comercio: dinocap

1 Ejemplo 7. Ensayo de actividad protectora sobre el mildiú  
polverulento de la rosa (Sphaerotheca pannosa)

5 Brotes de rosa (var. Peace) en tiestos se sometie  
ron a pulverización con una solución acuosa de cada concen-  
trado emulsificable, en cantidad de 30 ml por planta. Tras  
haber secado al aire la solución, las plantas de ensayo se  
inocularon con Sphaeroteca pannosa y se cultivaron durante  
14 días en invernadero. Después se determinaron las magnitu-  
des de infección, y los tantos por ciento de severidad de  
10 la enfermedad se calcularon de la misma manera que en el  
ejemplo 3.

15 Los resultados de ensayo se muestran en la tabla  
6. Como es evidente por los resultados, los compuestos de  
la presente invención mostraron una actividad de protección  
más superior que los compuestos testigo.

TABLA 6

20

Compuesto nº	Concentración de ingredien- te activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
1	100	0,0
12	"	5,0
17	"	0,0
31	"	0,0
45	"	0,0
51	"	0,0

25

30

TABLA 6  
(continuación)

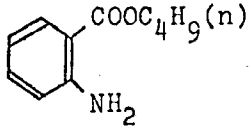
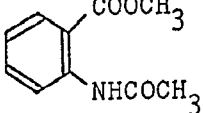
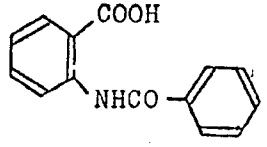
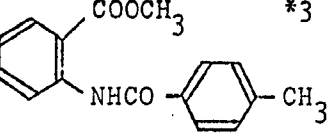
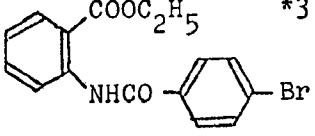
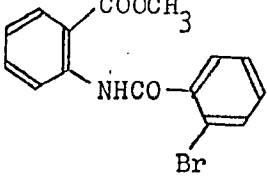
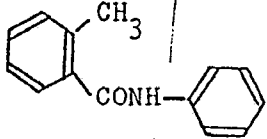
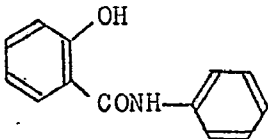
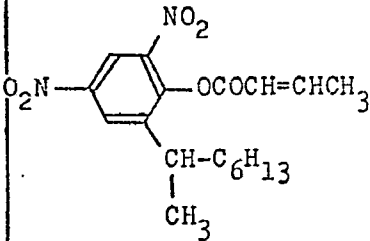
Compuesto n.º	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
 <chem>CCCCOC(=O)c1ccccc1N</chem> *1	100	65,0
 <chem>CCOC(=O)c1ccccc1NC(=O)C</chem> *2	"	62,5
 <chem>O=C(O)c1ccccc1NC(=O)c2ccccc2</chem> *3	"	60,0
 <chem>CCOC(=O)c1ccccc1NC(=O)c2ccc(C)cc2</chem> *3	"	70,0
 <chem>CCOC(=O)c1ccccc1NC(=O)c2ccc(Br)cc2</chem> *3	"	75,0
 <chem>CCOC(=O)c1ccccc1NC(=O)c2ccccc2Br</chem> *3	"	67,5

TABLA 6  
(continuación)

Compuesto n.º	Concentración de ingrediente activo (ppm)	Severidad de la enfermedad (%)
<div style="display: flex; align-items: center; justify-content: center;">  <div style="margin-left: 20px;">*4</div> </div>	100	72,5
<div style="display: flex; align-items: center; justify-content: center;">  <div style="margin-left: 20px;">*5</div> </div>	"	70,0
<div style="display: flex; align-items: center; justify-content: center;">  <div style="margin-left: 20px;">*6</div> </div>	"	17,5
Sin tratamiento	-	72,5

**Notas:**

- \*1 Compuesto expuesto en J.Med.Chem., vol. 11, 369 (1968)
- \*2 Compuesto expuesto en Can.J.Chem., vol. 46, 2589 (1968)
- \*3 Compuesto expuesto en Bull.Soc.Chim.France, 337 (1960)
- \*4 Fungicida disponible en el comercio: mebenil
- \*5 Fungicida disponible en el comercio: salicilanilida
- \*6 Fungicida disponible en el comercio: dinocap

1

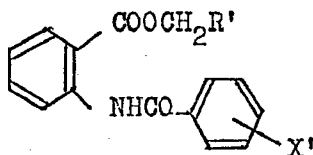
REIVINDICACIONES

5

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

10

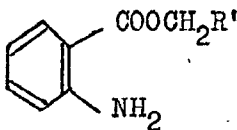
1ª.- Procedimiento para preparar N-benzoil-antranilato de fórmula:



15

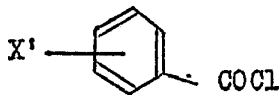
donde X' es un grupo 2,4-dimetoxi, 3,4-dimetoxi o 3,4-metilendioxi, y R' es un grupo alcohilo C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>, que comprende hacer reaccionar un antranilato de fórmula:

20



donde R' es según se ha definido antes, con un cloruro de benzoilo de fórmula:

25



donde X' es según se ha definido antes.

30

2ª.- Procedimiento para preparar N-benzoil-antranilato.

1

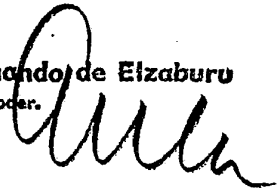
Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y para los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de TREINTA Y TRES hojas escritas a máquina por una sola cara.

5

Madrid, 05. ABR. 1978  
P.A.

Fernando de Elizaburu  
Por Poder.



10

15

20

25



30

220378