

- 5 OCT. 1978



ESPAÑA

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

11	NUMERO	10	A1
21	467.061		
22	FECHA DE PRESENTACION		
	16 febrero 1.978		

PATENTE DE INVENCION

50	PRIORIDADES:	52	FECHA	53	PAIS
51	NUMERO				
	656.552		9.2.1976	Reivs. 3,5,16	Estados Unidos
	740.166		10.11.1976	Reivs. 1,2 y 4	Estados Unidos.

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

54	TITULO DE LA INVENCION
	UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN COMPUESTO DE TIADIAZOLIL BENZAMIDA.

71	SOLICITANTE (S)
	ELI LILLY AND COMPANY.

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
307 East McCarty Street Indianapolis, Indiana 46206 Estados Unidos.

72	INVENTOR (ES)
	John Stanley Ward. Estadounidense.

73	TITULAR (ES)
	El mismo solicitante.

74	REPRESENTANTE
	DON BERNARDO UNGRIA GOIBURU.

1           Esta invención se refiere a un procedimiento para la  
preparación de una serie de nuevas N-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-  
benzamidas, con un grupo fenilo, naftilo o heteroarilo en  
5           la posición 5 del anillo de tiadiazol y 2,6-sustitución en  
el anillo bencílico, que son útiles como insecticidas.

          El control de los insectos fue uno de los primeros  
problemas estudiados por la investigación química agrícola y  
continúa prevaleciendo intensamente en este campo. Insectos  
de muchos órdenes asaltan a los cultivos de todo tipo y tam  
10           bién producen condiciones insalubres y molestias por conta-  
minación de los alimentos. El daño causado por los insectos  
es incalculable y el control de los insectos dañinos necesa-  
riamente es de la máxima prioridad.

          Recientemente la búsqueda de nuevos y mejores insec-  
15           ticias ha sido estimulada por la retirada de uso de los in-  
secticidas residuales antiguos.

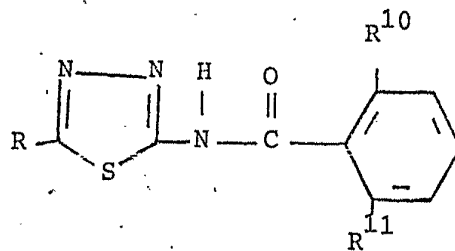
          Los compuestos de Fórmula I son nuevos en química or-  
gánica. Sin embargo, algunos temas de la técnica anterior  
son de interés. Por ejemplo, Cebalo, patente estadounidense  
20           3.726.892, describe las 1,3,4-tiadiazol-2-il-ureas herbici-  
das.

          Rao, Indian J. Chem. 8, 509-13 (1970) enseña un méto-  
do de síntesis de 2-amino-1,3,4-tiadiazoles que son produc-  
tos intermedios para los compuestos de esta invención.

25           Wellinga y Mulder, patente estadounidense 3.748.356  
demuestran la eficacia herbicida e insecticida de las N-ben-  
zoil-N'-fenilureas.

          Esta invención pertenece al campo de la química agrí-  
cola y proporciona un procedimiento para la preparación de  
30           nuevas tiadiazolilbenzamidas de fórmula:

1

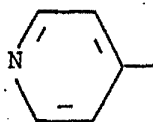


I

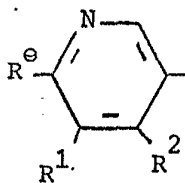
5

donde R representa

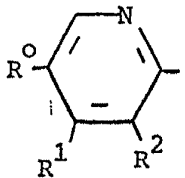
10



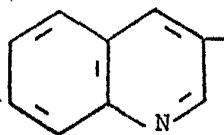
15



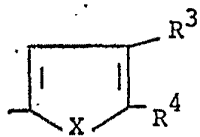
20



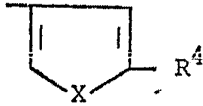
25



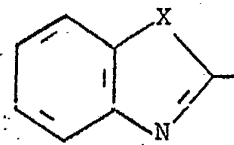
30



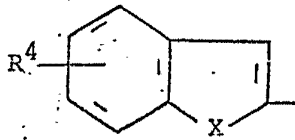
1



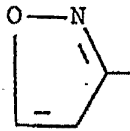
5



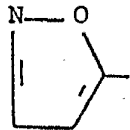
10



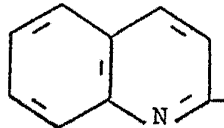
15



20



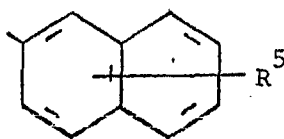
25



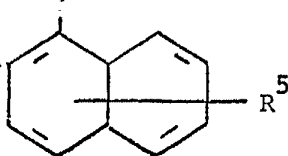
30



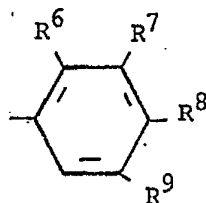
1



5



10



15

donde

$R^0$ ,  $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente hidrógeno, cloro o bromo, con la condición de que por lo menos uno de los grupos  $R^0$ ,  $R^1$  y  $R^2$  representa cloro o bromo;

20

X representa oxígeno o azufre;

$R^3$  y  $R^4$  representan independientemente hidrógeno, cloro, bromo o metilo, con la condición de que  $R^3$  representa hidrógeno cuando X representa oxígeno;

25

$R^5$  representa hidrógeno, cloro, bromo, flúor o tri-fluormetilo;

y o bien

30

1)  $R^6$  y  $R^7$  representan hidrógeno, uno de los grupos  $R^8$  y  $R^9$  representa hidrógeno y el otro representa hidrógeno, cloro, metoxi, bromo, yodo, flúor, tri-fluormetilo, metilo, hidroxilo, fenilo o fenilo mo-

1

nosustituído con bromo, cloro o flúor o

2)  $R^6$  y  $R^7$  representan hidrógeno y  $R^8$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor o bromo o

5

3)  $R^6$  y  $R^8$  representan hidrógeno y  $R^7$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o trifluormetilo o

4)  $R^7$  y  $R^9$  representan hidrógeno, y  $R^6$  y  $R^8$  representan independientemente cloro, flúor o bromo o

10

5)  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  representan hidrógeno y  $R^6$  representa cloro, flúor o bromo o

6)  $R^6$ ,  $R^7$  y  $R^9$  representan hidrógeno y  $R^8$  representa acetamido, nitro, amino o ciano;

$R^{10}$  y  $R^{11}$  representan independientemente hidrógeno, cloro, flúor, bromo, metilo o metoxi;

15

con la condición de que:

1) uno de los grupos  $R^{10}$  y  $R^{11}$  puede representar hidrógeno si y solamente si el otro representa metoxi;

2) por lo menos uno de los grupos  $R^{10}$  y  $R^{11}$  debe representar metilo o metoxi a no ser que

20

a)  $R^8$  no represente hidrógeno y  $R^6$ ,  $R^7$  y  $R^9$  representen hidrógeno o

b)  $R^6$  y  $R^8$  representen hidrógeno y uno o los dos grupos  $R^7$  y  $R^9$  represente trifluormetilo;

25

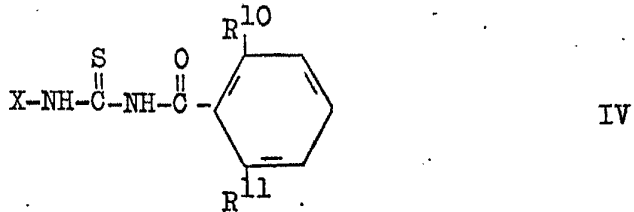
3) ni  $R^8$  ni  $R^9$  representan fenilo, acetamido, metoxi, nitro, amino, ciano o fenilo sustituido a no ser que  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan ambos metoxi;

4) dos de los grupos  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  representan hidrógeno a no ser que  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan ambos metilo o metoxi;

30

5)  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan ambos metoxi o metilo cuando R representa piridilo, naftilo, furilo o tienilo;

1 6) R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan ambos metoxi cuando R representa  
benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzofurilo,  
isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo;  
cuyo procedimiento se caracteriza por ciclar el compuesto  
5 de fórmula



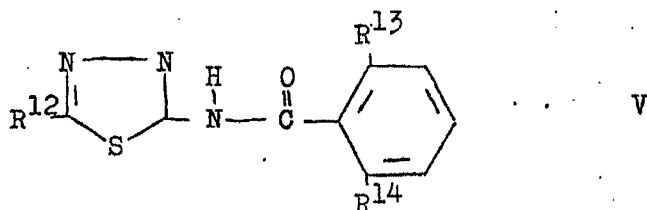
10 donde R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> son los definidos en la fórmula I y X repre  
senta:



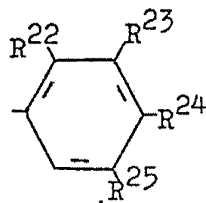
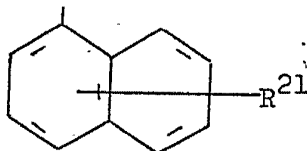
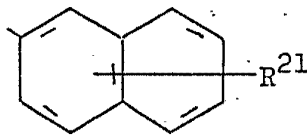
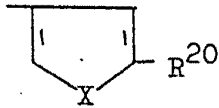
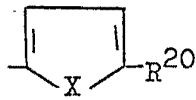
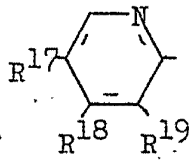
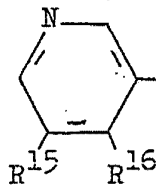
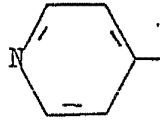
15 donde R es el definido en la Fórmula I, con un agente oxi  
dante, y opcionalmente reducir un compuesto de Fórmula I  
donde R<sup>8</sup> representa nitro para obtener un compuesto donde  
R<sup>8</sup> representa amino y además opcionalmente acilar el compues  
to donde R<sup>8</sup> representa amino para preparar un compuesto don  
20 de R<sup>8</sup> representa acetamido.

En esta memoria, todas las cantidades están medidas  
en el sistema métrico y las temperaturas en la escala Cel  
sius. Todas las proporciones y porcentajes se dan en peso.  
El término halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo y yodo.

25 Varias clases y tipos específicos de compuestos de  
Fórmula I constituyen clases preferidas. Una clase especial  
mente preferida de compuestos son los de fórmula:



1 donde R<sup>12</sup> representa



1 donde

5  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$  y  $R^{19}$  representan independientemente hidrógeno, cloro o bromo, con la condición de que por lo menos uno de los grupos  $R^{15}$  y  $R^{16}$  o por lo menos uno de los grupos  $R^{17}$ ,  $R^{18}$  y  $R^{19}$  representa cloro o bromo;

X representa oxígeno o azufre;

$R^{20}$  representa hidrógeno, cloro, bromo o metilo;

10  $R^{21}$  representa hidrógeno, cloro, bromo, flúor o trifluormetilo; y o bien

1)  $R^{22}$  y  $R^{23}$  representan hidrógeno, uno de los grupos  $R^{24}$  y  $R^{25}$  representa hidrógeno y el otro representa hidrógeno, cloro, bromo, flúor, trifluorometilo, metilo, hidroxilo, fenilo o fenilo monosustituído con bromo, cloro o flúor o

15 2)  $R^{22}$  y  $R^{23}$  representan hidrógeno y  $R^{24}$  y  $R^{25}$  representan independientemente cloro, flúor o bromo o

20 3)  $R^{22}$  y  $R^{24}$  representan hidrógeno y  $R^{23}$  y  $R^{25}$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o trifluormetilo o

4)  $R^{23}$  y  $R^{25}$  representan hidrógeno y  $R^{22}$  y  $R^{24}$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o

25 5)  $R^{23}$ ,  $R^{24}$  y  $R^{25}$  representan hidrógeno y  $R^{22}$  representa cloro, flúor o bromo;

$R^{13}$  y  $R^{14}$  representan independientemente hidrógeno, cloro, flúor, bromo, metilo o metoxi; con la condición de que:

30 1) uno de los grupos  $R^{13}$  y  $R^{14}$  puede representar

1 hidrógeno, si y solamente si el otro representa metoxi;

2) por lo menos uno de los grupos  $R^{13}$  y  $R^{14}$  debe representar metilo o metoxi a no ser que

5 a)  $R^{24}$  no representa hidrógeno y  $R^{22}$ ,  $R^{23}$  y  $R^{25}$  representan hidrógeno o

b)  $R^{22}$  y  $R^{24}$  representan hidrógeno y uno o los dos grupos  $R^{23}$  y  $R^{25}$  representan trifluormetilo;

10

3) ni  $R^{24}$  ni  $R^{25}$  representan fenilo o fenilo sustituido a no ser que  $R^{13}$  y  $R^{14}$  representen ambos metoxi;

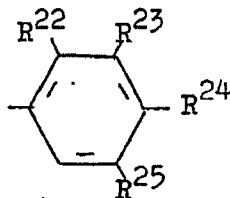
15

4) dos de los grupos  $R^{23}$ ,  $R^{24}$  y  $R^{25}$  representan hidrógeno a no ser que  $R^{13}$  y  $R^{14}$  representen ambos metilo o metoxi;

5)  $R^{13}$  y  $R^{14}$  representan ambos metoxi cuando R representa piridilo, naftilo, furilo o tienilo.

20

Dentro de la clase anterior, una clase más preferida son los compuestos donde  $R^{12}$  representa:



25

y otra clase preferida son los compuestos donde  $R^{13}$  y  $R^{14}$  representan ambos metoxi.

30

Se sobreentiende que este procedimiento también permite preparar otros diferentes tipos de clases de compuestos y también incluyen métodos insecticidas y composiciones

1 que hacen uso de las diversas clases de compuestos. Por ejemplo, se consideran las siguientes clases preferidas de compuestos. Cada subpárrafo numerado más adelante describe una clase independiente de compuestos; en cada clase, los sustituyentes variables tienen los significados generales de la  
5 Fórmula I, salvo indicación en contrario. En los subpárrafos siguientes, cada término general, como fenilo, incluye las formas sustituidas del grupo a que se refiere.

Compuestos donde:

- 10 1) R representa fenilo,  
2) R representa fenilo o piridilo,  
3) R representa piridilo, tienilo, furilo, benzotienilo, benzofurilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,  
15 4) R representa fenilo o naftilo,  
5) R representa piridilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,  
6) R representa tienilo, furilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzotienilo, benzofurilo, isoxazolilo, quinolilo  
20 o tiazolilo,  
7) uno de los grupos  $R^8$  y  $R^9$  representa hidrógeno, y el otro representa halógeno o trifluorometilo,  
8)  $R^8$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor o bromo,  
25 9)  $R^7$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o trifluorometilo,  
10) uno de los grupos  $R^8$  y  $R^9$  representa hidrógeno y el otro representa halógeno, trifluorometilo, metilo o metoxi,  
11)  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan metoxi,  
30 12)  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan independientemente metilo o metoxi,

- 1 13) R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan independientemente cloro, flúor o bromo.

Compuestos del subpárrafo 11 anterior donde:

- 14) R representa fenilo,  
5 15) R representa fenilo o piridilo,  
16) R representa piridilo, tienilo, furilo, benzotienilo, benzofurilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,  
17) R representa fenilo o naftilo,  
10 18) R representa piridilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinólilo o tiazolilo,  
19) R representa tienilo, furilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzotienilo, benzofurilo, isoxazolilo, quinólilo o tiazolilo,  
15 20) uno de los grupos R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representa hidrógeno y el otro representa halógeno o trifluormetilo,  
21) R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representan independientemente cloro, flúor o bromo,  
22) R<sup>7</sup> y R<sup>9</sup> representan independientemente cloro, flúor,  
20 bromo o trifluormetilo,  
23) uno de los grupos R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representa hidrógeno, y el otro representa halógeno, trifluormetilo, metilo o metoxi.

Compuestos del subpárrafo 12 anterior donde:

- 24) R representa fenilo,  
25 25) R representa fenilo o piridilo,  
26) R representa piridilo, tienilo, furilo, benzotienilo, benzofurilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,  
27) R representa fenilo o naftilo,  
30 28) R representa piridilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo,

- 1 Los isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,
- 29) R representa tienilo, furilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzotienilo, benzofurilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,
- 5 30) Uno de los grupos  $R^8$  y  $R^9$  representa hidrógeno y el otro representa halógeno o trifluorometilo,
- 31)  $R^8$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor o bromo,
- 32)  $R^7$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o trifluorometilo,
- 10 33) Uno de los grupos  $R^8$  y  $R^9$  representa hidrógeno y el otro representa halógeno, trifluorometilo, metilo o metoxi;
- Compuestos del subpárrafo 13 anterior donde:
- 34) R representa fenilo,
- 15 35) R representa fenilo o piridilo,
- 36) R representa piridilo, tienilo, furilo, benzotienilo, benzofurilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,
- 37) R representa fenilo o naftilo,
- 20 38) R representa piridilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,
- 39) R representa tienilo, furilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzotienilo, benzofurilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo,
- 25 40) uno de los grupos  $R^8$  y  $R^9$  representa hidrógeno y el otro representa halógeno o trifluorometilo,
- 41)  $R^8$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor o bromo,
- 42)  $R^7$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o trifluorometilo,
- 30

1 43) uno de los grupos R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representa hidrógeno y el otro representa halógeno, trifluormetilo, metilo o metoxi.

Aunque la fórmula general anterior describe claramente los compuestos de Fórmula I, incluimos los siguientes -  
5 ejemplos típicos para estar seguros de que los químicos agrícolas comprenden completamente la invención.

N-{5-(6-cloro-3-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}2,6-dimetoxibenzamida,

10 N-{5-(4-cloro-3-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

N-{5-(4,5-dibromo-3-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida,

N-{5-(5-bromo-2-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

15 N-{5-(4-cloro-2-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida,

N-{5-(5-bromo-3-cloro-2-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

20 N-{5-(3,4,5-tricloro-2-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

N-{5-(3-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,  
N-{5-(5-cloro-2-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

25 N-{5-(5-bromo-3-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

N-{5-(5-metil-2-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

N-{5-(3-cloro-1-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,

30 N-{5-(2-bromo-1-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-

- 1 benzamida.  
N-{5-(4-fluor-2-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6 dimetoxi-  
benzamida.
- 5 N-{5-(3-trifluormetil-2-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-  
dimetoxibenzamida.  
N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-bromo-6-fluor-  
benzamida.  
N-{5-(3-bromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-fluor-6-metil-  
benzamida.
- 10 N-{5-(3-yodofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-fluor-6-metoxi-  
benzamida.  
N-{5-(3-metilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-cloro-6-metil-  
benzamida.  
N-{5-(3-hidroxifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-bromo-6-metil-  
benzamida.
- 15 N-{5-(3-fenilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenza-  
mida.  
N-{5-[3-(3-fluorfenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dime-  
toxibenzamida.
- 20 N-{5-[4-(3-bromofenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dime-  
toxibenzamida.  
N-{5-[4-(2-clorofenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dime-  
toxibenzamida.  
N-{5-[3-(4-clorofenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dime-  
toxibenzamida.
- 25 N-{5-(3,4-dibromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetil-  
benzamida.  
N-{5-(3-bromo-4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-  
6-metilbenzamida.
- 30 N-{5-(3,4-difluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-

- 1 benzamida.  
N-{5-(3,5-difluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetil-  
benzamida.  
N-{5-(3,5-dibromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-  
5 benzamida.  
N-{5-(3-cloro-5-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-  
2,6-dimetoxibenzamida.  
N-{5-(3-bromo-5-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-  
6-metilbenzamida.  
10 N-{5-(2,4-dibromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetil-  
benzamida.  
N-{5-(4-fluorfenil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-2,6-difluorbenzami-  
da.  
N-{5-(2-bromo-4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dime-  
15 toxibenzamida.  
N-{5-(4-bromo-2-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-  
benzamida.  
N-{5-(4-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-diclo-  
robenzamida.  
20 N-{5-(2-bromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-6-metil-  
benzamida.  
N-{5-(6-cloro-1-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-  
benzamida.  
N-{5-(5-fluor-2-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-  
25 benzamida.  
N-{5-(7-trifluormetil-1-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-  
dimetoxibenzamida.  
N-{5-(4,5,6-tricloro-3-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-  
dimetoxibenzamida.  
30 N-{5-bromo-4,6-dicloro-3-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-

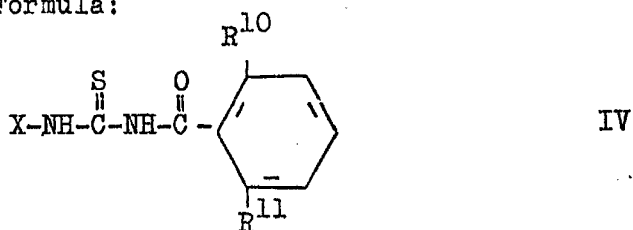
- 1 dimetilbenzamida.
- N-{5-(3,4,5-tribromo-2-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-6-metilbenzamida.
- 5 N-{5-(3-bromo-4,6-dicloro-2-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(4-metil-2-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.
- N-{5-(4-bromo-5-metil-2-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-6-metilbenzamida.
- 10 N-{5-(4,5-dicloro-2-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(2-benzoxazolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(2-benzo{b}tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- 15 N-{5-(2-benzo{b}furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(5-isoxazolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- 20 N-{5-(2-tiazolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(4-yodofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-cloro-6-metoxibenzamida.
- N-{5-(4-yodofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-diclorobenzamida.
- 25 N-{5-(3-yodofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-bromo-6-metilbenzamida.
- N-{5-(5-trifluormetil-2-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.
- 30 N-{5-(4-cloro-1-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-6-me-

- 1                   tilbenzamida.
- N-{5-(2-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.
- N-{5-(5-bromo-3-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxi-6-metilbenzamida.
- 5                   N-{5-(6-bromo-2-benzo{b}tlenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(4-metil-2-benzo{b}tlenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(5-cloro-2-benzo{b}furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- 10                   N-{5-(7-metil-2-benzo{b}furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- Los compuestos preferidos de Fórmula I son:
- 15                   N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.
- N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.
- 20                   N-{5-(4-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.
- N-{5-(4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(3-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- 25                   N-{5-(3-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.
- N-{5-(3,5-bis(trifluormetil)fenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida y
- 30                   N-{5-(4-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dime-

1 toxibenzamida.

Los compuestos de Fórmula I se preparan por procedimientos que son actualmente conocidos o son análogos a los procedimientos conocidos.

5 Los compuestos de Fórmula I donde R, R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> son los definidos anteriormente, se preparan por ciclación de un compuesto de Fórmula:



donde R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> son los definidos en la Fórmula I y X representa

15  $R=CH=N-$

donde R es el definido en la Fórmula I, con un agente oxidante y opcionalmente reduciendo un compuesto de Fórmula I donde R<sup>8</sup> representa nitro para obtener un compuesto donde R<sup>8</sup> representa amino y también opcionalmente acilación del compuesto donde R<sup>8</sup> representa amino para preparar un compuesto donde R<sup>8</sup> representa acetamido.

25 El agente oxidante preferido es el cloruro férrico. Pueden emplearse otros agentes oxidantes fuertes, por ejemplo, ferricianuro cálcico. Las ciclaciones oxidativas se realizan preferiblemente en alcoholes inferiores, por ejemplo, etanol o propanol, a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. En general, sin embargo, pueden utilizarse si es conveniente temperaturas de unos 50 a unos 100°.

30 Se prefiere preparar compuestos con un grupo amino o

1 acetamido sobre un grupo fenilo R preparando primero el co-  
rrespondiente compuesto nitrado y reduciendo el grupo nitro  
por hidrogenación, empleando un catalizador de hidrogenación,  
preferiblemente un catalizador de metal noble, para formar  
5 el compuesto amínico. El grupo amino es acilado con anhídri-  
do acético o haluro de acetilo para preparar el compuesto  
acetamido.

Como observarán los químicos orgánicos, todos los com-  
puestos de partida utilizados en la preparación de los com-  
puestos de Fórmula I pueden ser obtenidos por los expertos  
10 en este campo.

Los siguientes ejemplos muestran la síntesis de com-  
puestos típicos y las siguientes preparaciones muestran la  
síntesis de compuestos de partida típicos. En todos los ejem-  
15 plos, los compuestos fueron identificados por análisis de re-  
sonancia magnética nuclear, microanálisis elemental y, en al-  
gunos casos, por análisis infrarrojo y espectroscopía de ma-  
sas.

EJEMPLO 1

20 N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenza-  
mida.

Se añaden 3,78 g de 4-clorobenzaldehído, 4-(2,6-dime-  
toxibenzoil)tiosemicarbazida, a 400 ml de etanol y después  
se agregan 10,8 g de hexahidrato de cloruro férrico. La mez-  
25 cla se agita a la temperatura de reflujo durante 1 hora y  
después se enfría y concentra a vacío. El residuo se lava con  
ácido clorhídrico y el sólido se suspende en agua y se neu-  
traliza. El sólido se separa por filtración y se recoge en  
etanol. Se evapora el disolvente a vacío y el residuo se re-  
30 cristaliza en acetato de etilo para obtener 2,1 g de N-{5-

1 (4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida,  
p.f. 246-248º.

	<u>Teórico</u>	<u>Encontrado</u>
C	54,33%	54,19%
5 H	3,75%	3,47%
N	11,18%	11,27%

Los siguientes compuestos están también hechos por el  
procedimiento anteriormente descrito. Primero se nombrarán  
los compuestos y, después, sus características serán expues-  
tas en tablas.

10 La síntesis de los siguientes compuestos ilustrativos  
sigue en general el procedimiento de los ejemplos anteriores.  
Primero serán nombrados los compuestos ilustrativos y des-  
pués se tabularán sus puntos de fusión y sus análisis elemen-  
tales.

EJEMPLO 2

N-{5-(1-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 3

20 N-{5-(2,4-diclorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-  
benzamida.

EJEMPLO 4

N-{5-(4-hidroxifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxiben-  
zamida.

EJEMPLO 5

25 N-{5-(3,5-diclorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-  
benzamida.

EJEMPLO 6

N-{5-(3-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenza-  
mida.

30

EJEMPLO 7

1 N-{5-(4-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida

EJEMPLO 8

N-{5-(4-cianofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

5

EJEMPLO 9

N-{5-(3,5-bis(trifluormetil)fenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 10

10

N-{5-(2-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 11

N-(5-fenil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-2,6-diclorobenzamida.

EJEMPLO 12

15

N-{5-(4-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-diclorobenzamida.

EJEMPLO 13

N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-cloro-6-metilbenzamida.

EJEMPLO 14

20

N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-difluorbenzamida.

EJEMPLO 15

N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

25

EJEMPLO 16

N-{5-(4-bromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-diclorobenzamida.

EJEMPLO 17

30

N-{5-(4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-diclorobenzamida.

EJEMPLO 18

N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 19

N-{5-(3,4-diclorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 20

N-{5-(4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 21

N-{5-(4-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,5-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 22

N-{5-(4-bromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 23

N-(5-fenil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-2,6-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 24

N-{5-(4-fluorfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 25

N-{5-(2-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 26

N-{5-(2-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 27

N-{5-(4-metilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 28

N-{5-(4-fenilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 29

1

N-{5-(3-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 30

5

N-{5-(3-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 31

N-{5-(4-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

10

EJEMPLO 32

N-(5-fenil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 33

N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2-metoxibenzamida.

EJEMPLO 34

15

N-{5-(3-trifluormetilfenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 35

N-{5-[4-(4-bromofenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

20

EJEMPLO 36

N-{5-[4-(4-clorofenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 37

25

N-{5-(4-bromofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 38

N-{5-[4-(4-fluorfenil)fenil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 39

30

N-{5-(2-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

1

EJEMPLO 40

N-{5-(3,4-diclorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-benzamida.

5

EJEMPLO 41

N-{5-(3-hidroxifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxiben-zamida.

10

EJEMPLO 42

N-{5-(4-metoxifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxiben-zamida.

15

EJEMPLO 43

N-{5-(4-nitrofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenza mida.

EJEMPLO 44

N-{5-(3-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenza mida.

20

EJEMPLO 45

N-{5-(2-naftil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

EJEMPLO 46

N-{5-(3,5-bis(trifluormetil)-fenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetilbenzamida.

25

EJEMPLO 47

N-{5-(3-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 48

N-{5-(3-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

30

EJEMPLO 49

N-{5-(5-bromo-2-furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-benzamida.

EJEMPLO 50

N-{5-(4-yodofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenza mida.

1

EJEMPLO 51

N-{5-(5-bromo-3-piridil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 52

5

N-{5-(5-cloro-2-tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 53

N-{5-(3-isoxazolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

10

EJEMPLO 54

N-{5-(5-cloro-2-benzo{b} tienil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 55

15

N-{5-(2-benzotiazolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 56

N-{5-(2-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 57

20

N-{5-(2-quinolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

EJEMPLO 58

N-{5-(3-quinolil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

25

EJEMPLO 59

N-{5-(4-clorofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-diclorobenzamida.

EJEMPLO 60

30

N-{5-(3-hidroxifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

1

EJEMPLO 61

N-{5-(5-cloro-2-benzo {b} furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

5

EJEMPLO 62

N-{5-(2-benzo {b} furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida.

Ej. No.	p.f., °C	C %	H %	N %	
2	209-210	64,24	4,58	10,88	
3	> 260	49,56	3,17	10,30	
10	4	> 260	57,38	4,45	11,55
5	249-251	49,89	3,25	10,49	
6	216-218	57,00	4,07	11,75	
7	241-243	55,89	4,11	16,06	
8	> 260	58,82	3,85	15,09	
15	9	236-237	48,01	2,81	9,07
10	248-249	57,12	3,74	11,77	
11	232-237	51,22	2,59	11,99	
12	> 260	45,96	1,90	9,96	
13	258-260	52,61	2,91	11,58	
20	14	> 260	50,97	2,57	11,86
15	247-249	59,42	4,22	11,94	
16	> 260	42,27	2,13	9,58	
17	254-256	47,84	4,55	11,24	
18	238-240	54,12	4,07	11,11	
25	19	> 260	54,35	3,66	11,16
20	231-233	62,16	4,52	12,70	
21	240-242	57,19	4,04	11,30	
22	250-252	52,23	3,80	11,11	
23	248-250	65,72	4,77	13,28	
30	24	248-251	57,11	3,95	11,53

	<u>Ej. No.</u>	<u>p.f., °C</u>	<u>C %</u>	<u>H %</u>	<u>N %</u>
1	25	256-259	52,06	3,92	11,74
	26	233-235	54,39	4,12	12,52
	27	228-230	60,63	4,77	11,66
5	28	236-239	66,02	4,92	10,39
	29	183-185	52,59	3,43	10,49
	30	213-214	54,60	4,02	11,38
	31	217-220	52,56	3,37	10,37
	32	253-255	60,09	4,77	11,99
10	33	214-216	55,40	3,63	11,91
	34	> 260	57,10	3,82	11,19
	35	259-261	55,45	3,53	8,84
	36	259-261	61,02	3,84	9,36
	37	240-243	48,36	3,55	10,29
15	38	255-257	63,08	4,19	10,00
	39	230-232	64,43	4,66	11,01
	40	255-257	50,04	3,24	10,25
	41	243-245	57,38	4,36	12,01
	42	239-241	58,29	4,88	11,46
20	43	> 260	53,07	3,51	14,36
	44	> 260	59,24	4,27	12,17
	45	235-237	69,91	4,95	11,43
	46	230-232	51,16	2,68	9,36
	47	> 260	52,13	3,82	12,06
25	48	255-257	54,23	4,22	12,44
	49	207-209	43,72	3,10	10,18
	50	180-182	43,85	3,12	8,85
	51	259-261	45,89	3,21	13,02
	52	259-260	47,46	3,36	11,14
30	53	228-229	50,39	3,85	16,62

	<u>Ej. No.</u>	<u>p.f., °C</u>	<u>C %</u>	<u>H %</u>	<u>N %</u>
1	54	>260	52,62	3,48	9,78
	55	>260	54,38	3,72	13,81
	56	235-237	54,57	3,95	11,19
5	57	>260	61,09	4,30	13,95
	58	242-243	60,97	4,17	14,01
	59	>260	46,60	1,90	10,75
	60	243-245	57,38	4,36	12,01
	61	-	54,80	3,27	9,59
10	62	219-221	59,92	4,14	10,83

Los siguientes ejemplos ilustran la preparación de compuestos sustituidos con grupos amino y acetamido.

EJEMPLO 63

N-(4-Aminofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida

15 Se hidrogenan 3,6 g del compuesto nitrofenílico preparado en el Ejemplo 43, en tetrahidrofurano y en presencia de catalizador de paladio al 5% en carbón. Después de la hidrogenación, el disolvente se evapora a sequedad a vacío y el residuo se recristaliza en acetato de etilo. El catalizador se lava con etanol y dimetilformamida y los disolventes se evaporan a sequedad. El residuo se recristaliza en acetato de etilo y los productos recristalizados convenientes se identifican como 1,8 g de N-(4-aminofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida, p.f. 232-234°.

	<u>Teórico</u>	<u>Encontrado</u>
C	57,30%	56,95%
H	4,49%	4,67%
N	15,73%	15,41%

EJEMPLO 64

30 N-{5-(4-acetamidofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxi-

1 benzamida

Se disuelven 0,5 g del producto del Ejemplo 63 en 20 ml de piridina y se añaden 0,2 ml de anhídrido acético en 5 ml de tetrahidrofurano mientras la mezcla de reacción se enfría para mantener la temperatura por debajo de 35°. Una vez terminada la adición, la mezcla se agita durante 16 horas a la temperatura ambiente y se evapora a sequedad a vacío. El residuo se recristaliza en acetato de etilo para dar 0,25 g de N-{5-(4-acetamidofenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il}-2,6-dimetoxibenzamida, p.f. 211-213°.

10

	<u>Teórico</u>	<u>Encontrado</u>
C	57,42%	57,70%
H	4,31%	4,61%
N	14,10%	13,80%

15

Los compuestos de Fórmula I se han ensayado a fondo frente a insectos vivos para determinar la gama de su eficacia insecticida.

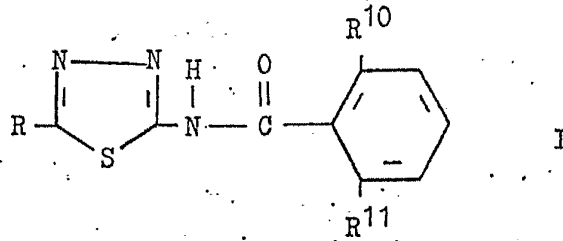
20

25

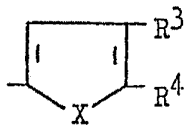
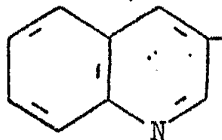
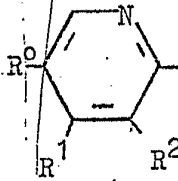
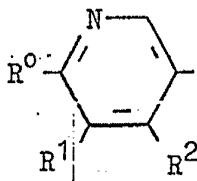
30

REIVINDICACIONES

1.-Un procedimiento para la preparación de un compuesto de tiadiazolilbenzamida de fórmula:



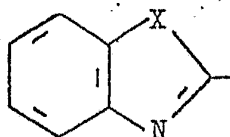
en donde R representa



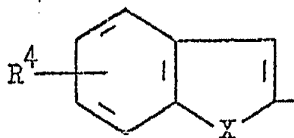
1



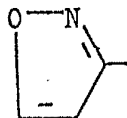
5



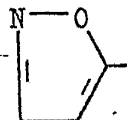
10



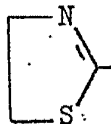
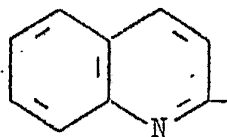
15



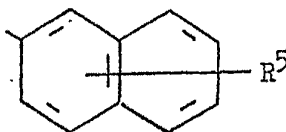
20



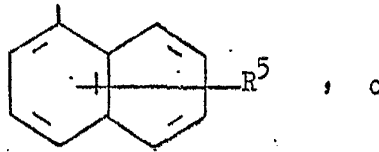
25



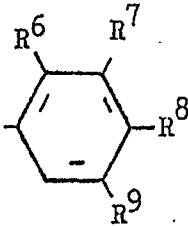
30



1



5



10

donde

R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan independientemente hidrógeno, cloro o bromo, con la condición de que por lo menos uno de los grupos R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representa cloro o bromo;

15

X representa oxígeno o azufre;

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan independientemente hidrógeno, cloro, bromo o metilo, con la condición de que R<sup>3</sup> representa hidrógeno cuando X representa oxígeno;

20

R<sup>5</sup> representa hidrógeno, cloro, bromo, fluor o trifluorometilo;

y o bien.

25

1) R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan hidrógeno, uno de los grupos R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representa hidrógeno y el otro representa hidrógeno, cloro, metoxi, bromo, yodo, flúor, trifluormetilo, metilo, hidroxí, fenilo o fenilo monosustituído con bromo, cloro o flúor o

30

2) R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan hidrógeno y R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representan independientemente cloro, flúor o bromo o

1

3)  $R^6$  y  $R^8$  representan hidrógeno y  $R^7$  y  $R^9$  representan independientemente cloro, flúor, bromo o trifluormetilo o

5

4)  $R^7$  y  $R^9$  representan hidrógeno y  $R^6$  y  $R^8$  representan independientemente cloro, flúor o bromo o

5)  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  representan hidrógeno y  $R^6$  representa cloro, flúor o bromo o

6)  $R^6$ ,  $R^7$  y  $R^9$  representan hidrógeno y  $R^8$  representa acetamido, nitro, amino o ciano;

10

$R^{10}$  y  $R^{11}$  representan independientemente hidrógeno, cloro, fluor, bromo, metilo o metoxi;

con las condiciones de que:

15

1) uno de los grupos  $R^{10}$  y  $R^{11}$  puede representar hidrógeno, si y solamente si el otro representa metoxi;

2) por lo menos uno de los grupos  $R^{10}$  y  $R^{11}$  debe representar metilo o metoxi, a no ser que

20

a)  $R^8$  no represente hidrógeno y  $R^6$ ,  $R^7$  y  $R^9$  representen hidrógeno o

b)  $R^6$  y  $R^8$  representan hidrógeno y uno o los dos grupos  $R^7$  y  $R^9$  representan trifluormetilo;

25

3) ni  $R^8$  ni  $R^9$  representan fenilo, acetamido, metoxi, nitro, amino, ciano o fenilo sustituido, a no ser que  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representen ambos metoxi;

4) dos de los grupos  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  representan hidrógeno a no ser que  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representen ambos metilo o metoxi;

30

5)  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan ambos metoxi o metilo cuan-

1

do R representa piridilo, naftilo, furilo o tienilo;

5

6)  $R^{10}$  y  $R^{11}$  representan ambos metoxi cuando R representa benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzofurilo, isoxazolilo, quinolilo o tiazolilo;

y además con la condición de que por lo menos se cumple una de las siguientes condiciones:

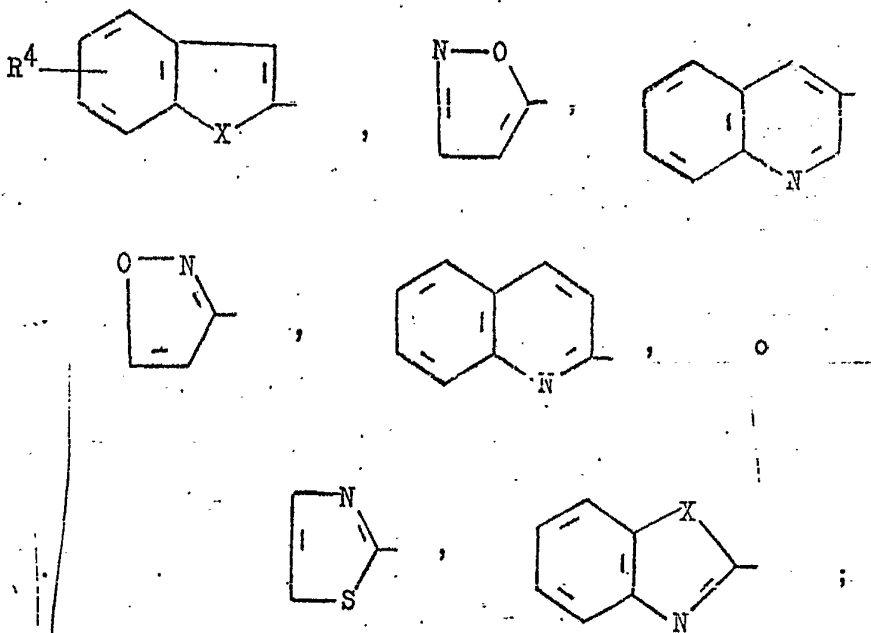
10

A.  $R^0$  sobre un grupo R 3-piridilo representa cloro o bromo;

B.  $R^3$  representa cloro, bromo o metilo;

C. R representa

15



20

25

D.  $R^8$  y  $R^9$  representan metoxi o yodo;

E.  $R^8$  representa nitro, amino, ciano o acetamido;

F.  $R^6$ ,  $R^7$  o  $R^9$  representa cloro y  $R^{10}$  o  $R^{11}$  representa cloro

30

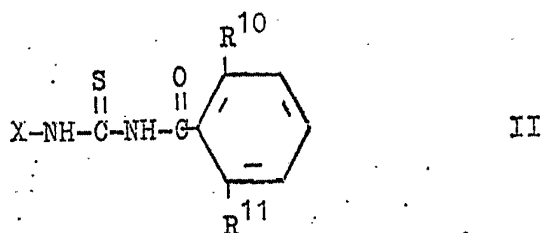
1

o  
G. R<sup>10</sup> o R<sup>11</sup> representa metilo cuando R representa piridi  
lo, naftilo, furilo o tienilo;

5

cuyo procedimiento se caracteriza por hacer reaccionar un  
compuesto de fórmula:

10



donde R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> son los definidos en la fórmula I y X re-  
presenta



15

donde R es el definido en la fórmula I, a excepción de que  
R no representa amino o acetamidofenilo, con un agente oxi-  
dante, de preferencia cloruro férrico, en un disolvente or-  
gánico inerte, de preferencia un alcano inferior, a una tem-  
peratura entre 50°C y 100°C, y opcionalmente reducir un com-  
puesto de fórmula I donde R<sup>8</sup> representa nitro para obtener  
un compuesto donde R<sup>8</sup> representa amino y además acilar op-  
cionalmente el compuesto donde R<sup>8</sup> representa amino para pre-  
parar un compuesto donde R<sup>8</sup> representa acetamido.

20

25

2.- Se reivindica por último como objeto sobre el  
que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita  
por: UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN COMPUESTO  
DE TIADIAZOLILBENZAMIDA.

30

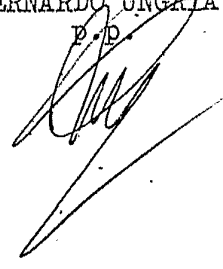
Todo conforme queda descrito y reivindicado en la  
presente memoria descriptiva, que consta de treinta y siete

1 páginas mecanografiadas.

Madrid, 16 febrero 1.978

BERNARDO UNGRIA

P.P.



5

10

15

20

25

30