

MINISTERIO DE INDUSTRIA Y ENERGIA  
Registro de la Propiedad Industrial



AH

ESPAÑA

Concedida al B. de acuerdo  
con los datos que se han presentado  
en la descripción y según el con-  
tenido de la Memoria adjunta.

PATENTE DE INVENCION

ES

11

21

22

NUMERO

479.624/1

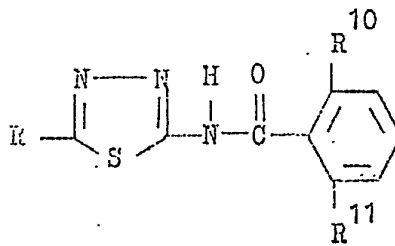
FECHA DE PRESENTACION

16-4-79

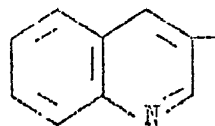
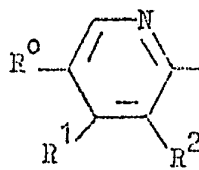
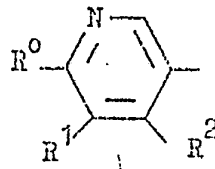
A1

<b>30</b> PRIORIDADES:		
<b>31</b> NUMERO	<b>32</b> FECHA	<b>33</b> PAIS
824.687	15-8-77	Estados Unidos
<b>47</b> FECHA DE PUBLICIDAD	<b>51</b> CLASIFICACION INTERNACIONAL	<b>62</b> PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07D285/08 // B01N 9/12, 9/22	472.537
<b>64</b> TITULO DE LA INVENCION		
UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVAS TIADIAZOLILBENZAMI- DAS.		
<b>71</b> SOLICITANTE (S)		
ELI LILLY AND COMPANY		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
307 East McCarty Street, INDIANAPOLIS, INDIANA, ESTADOS UNIDOS		
<b>72</b> INVENTOR (ES)		
John Stanley Ward, de nacionalidad estadounidense.		
<b>73</b> TITULAR (ES)		
<b>74</b> REPRESENTANTE		
DON BERNARDO UNGRIA GOIBURU		

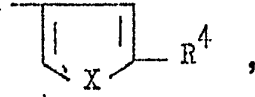
1                    Esta es una patente relacionada con la Patente  
 española nº 455.409, presentada el 27 de enero de 1.977.  
 Esta patente describe una invención que proporciona nuevas  
 tiadiazolilbenzamidias insecticidas de fórmula:



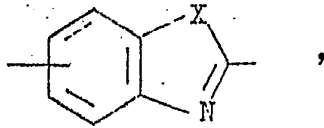
10                    donde R representa



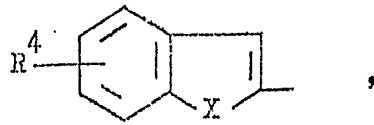
1



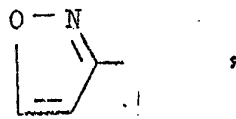
5



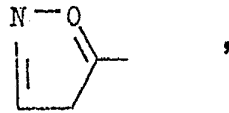
10



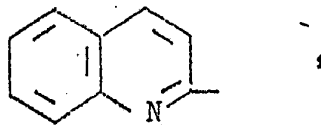
15



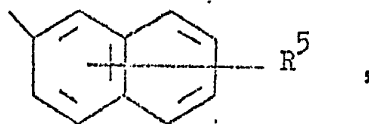
20

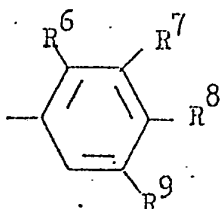
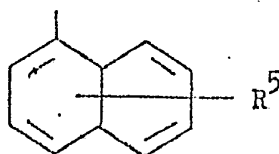


25



30





donde

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

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;

$R^5$  representa hidrógeno, cloro, bromo flúor o trifluorometilo;

y o bien

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, trifluorometilo, metilo, hidroxilo, fenilo o fenilo monosustituído 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

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

4)  $R^7$  y  $R^9$  representan hidrógeno y  $R^6$  y  $R^8$  repre-

1

tan 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

5

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;

con la condición de que:

10

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

15

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;

20

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;

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

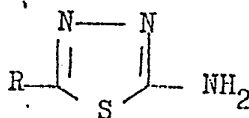
25

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

30

La patente española 455.409 también proporciona un procedimiento para preparar los compuestos anteriores, donde R,  $R^{10}$  y  $R^{11}$  son los definidos anteriormente, cuyo procedimiento consiste en 1) acilar un 2-amino-5-R-1,3,4-

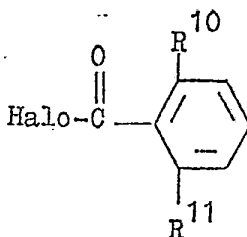
1 tiadiazol de fórmula:



5

donde R es el definido anteriormente, a excepción de que R no representa amino ni acetamidofenilo, con un haluro de benzoílo de fórmula

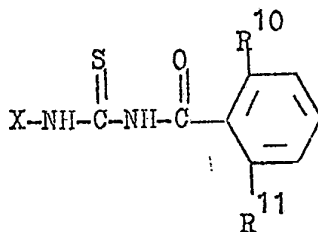
10



donde Halo se refiere a cloro o bromo y R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> son los definidos en la fórmula I, o bien

15

2) ciclar un compuesto de fórmula



20

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



25

donde R es el definido anteriormente, con un agente deshidratante cuando X representa R-C-NH-, o con un agente oxidante cuando X representa R-CH=N-, y opcionalmente reducir

30

un compuesto donde R<sup>8</sup> representa nitro para obtener un compuesto donde R<sup>8</sup> representa amino y también opcionalmente acilar el compuesto donde R<sup>8</sup> representa amino para preparar

1 un compuesto donde R<sup>8</sup> representa acetamido.

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

10 El control de insectos fué uno de los primeros problemas emprendidos por la investigación química agrícola y continúa siendo intensamente proseguido. Insectos de muchos órdenes asaltan a los cultivos de todo tipo y también producen condiciones insalubres y molestias por contaminación de los alimentos. El daño causado por los insectos es incalculable y el control de insectos perjudiciales es necesariamente de la máxima prioridad.

15 Recientemente la búsqueda de nuevos y mejores insecticidas ha sido fomentada por la retirada del uso de los antiguos insecticidas residuales.

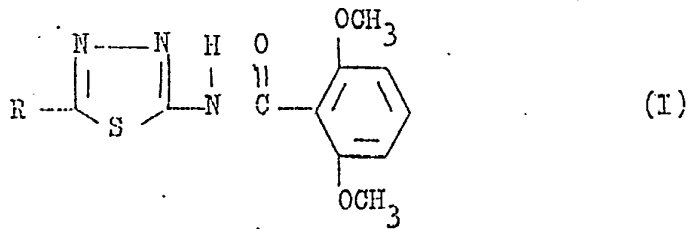
20 Los compuestos de fórmula I son nuevos en la química orgánica. Sin embargo, algunos artículos de la técnica anterior son de interés. Por ejemplo, la patente estadounidense 3.726.892 de Cebalo describe 1,3,4-tiadiazol-2-ilureas herbicidas.

25 Rao, Indian J. Chem. 8, 509-13 (1.970), describe un método de síntesis de 2-amino-1,3,4-tiadiazoles, que son intermediarios para los compuestos de esta invención.

Wellinga y Mulder, patente estadounidense 3.748.356, indican la eficacia herbicida e insecticida de las N-benzoil-N'-fenilureas.

30 Esta invención pertenece al campo de la química agrícola y proporciona nuevas tiadiazolilbenzamidas de fór-

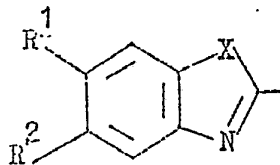
1 mula:



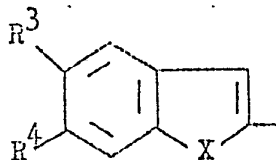
5

donde R representa

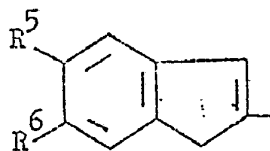
10



15



20



25

X representa oxígeno o azufre;

uno de los grupos  $R^1$  y  $R^2$  representa hidrógeno y el otro representa flúor, cloro, bromo, trifluormetilo o metoxi;

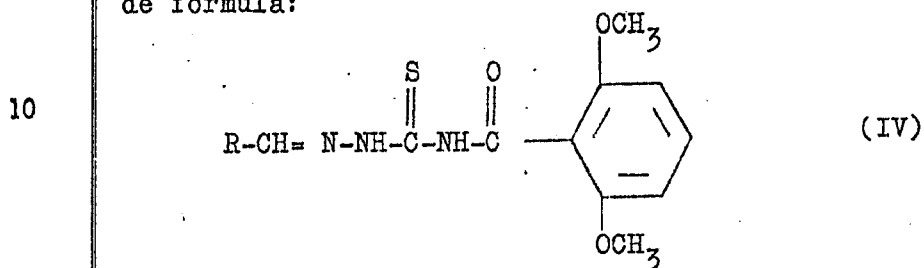
30

uno de los grupos  $R^3$  y  $R^4$  representa hidrógeno y el otro representa metoxi o trifluormetilo;

1 uno de los grupos  $R^5$  y  $R^6$  representa hidrógeno y el otro representa cloro, bromo, flúor, trifluormetilo o hidrógeno;

5 uno de los grupos  $R^7$  y  $R^8$  representa hidrógeno y el otro representa alcoxi  $C_1-C_2$  sustituido con uno o más átomos de flúor;

cuyo procedimiento se caracteriza por ciclar un compuesto de fórmula:



con un agente oxidante.

15 También se proporcionan nuevos métodos insecticidas y nuevas composiciones insecticidas que hacen uso de estos compuestos.

20 En este documento, todas las cantidades se han medido en el sistema métrico y las temperaturas se encuentran en la escala Celsius. Todas las proporciones y porcentajes son en peso. El término halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo y yodo.

25 El agente oxidante preferido es el cloruro férrico. Pueden utilizarse otros agentes oxidantes potentes como el 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 resulta conveniente temperaturas comprendidas entre 50 y 30 100° aproximadamente.

Como reconocerá el químico orgánico, todos los

1 compuestos de partida utilizados en la preparación de los  
compuestos de fórmula I pueden ser obtenidos por los que  
posean la experiencia habitual en este campo.

5 Los siguientes ejemplos muestran la síntesis de  
compuestos típicos y las siguientes preparaciones muestran  
la síntesis de compuestos de partida típicos. En todos los  
ejemplos, los compuestos fueron identificados por análisis  
de resonancia magnética nuclear, microanálisis elemental y,  
en algunos casos, por análisis infrarrojo y espectroscopía  
10 de masas.

Los compuestos de fórmula I han sido probados a  
fondo contra insectos vivos para determinar la gama de su  
eficacia insecticida. Los siguientes ensayos son típicos  
de los experimentos realizados y de los resultados obteni-  
15 dos.

En muchos casos, se han realizado ensayos repeti-  
dos para una cierta proporción de aplicación y los resulta-  
dos de estos ensayos han sido promediados. Los espacios en  
blanco en las tablas de datos dadas a continuación indican  
20 que no se ha realizado ningún ensayo a la proporción de apli-  
cación indicada. Los compuestos están identificados por sus  
números de ejemplo.

25 Ensayo 1: Ensayo del escarabajo mejicano de la judía y de  
la esciara del sur

Cada compuesto a ensayar se formuló disolviendo  
10 mg del compuesto en 1 ml de disolvente constituido por  
una mezcla 1:1 de etanol anhidro y acetona conteniendo 23 g  
de Toximul K y 13 g de Toximul S por litro. (Los Toximules  
30 son marcas registradas de agentes tensoactivos mixtos de  
sulfonatos, agentes no iónicos, producidos por la Stepan

1 Chemical Co., Northfield, Illinois, Estados Unidos). Después  
5 cada muestra se dispersó en 9 ml de agua para dar una  
concentración de 1000 ppm del compuesto de ensayo. Esta  
dispersión se diluyó con agua para producir concentraciones  
menores en caso deseado. La dispersión se roció uniformemente  
sobre plantas de judía de 10 días y las plantas se  
dejaron aparte hasta que se secaron.

10 A continuación se arrancaron las hojas de las plantas  
y los extremos cortados de las hojas se envolvieron en  
algodón empapado en agua. Se colocaron 2 hojas en cada una  
de varias placas Petri de plástico de 100 mm y después se  
colocaron en cada placa 5 larvas del escarabajo mejicano  
de la judía en el segundo o tercer instar (Epilachna vari-  
15 vestis) y 5 larvas de la esciara del sur en el segundo o  
tercer instar (Spodoptera eridania). Se utilizaron tres  
placas repetidas para cada compuesto de ensayo. Las placas  
se mantuvieron a unos 25% y 51 % de humedad relativa durante  
4 días, realizándose entonces la primera evaluación de  
la eficacia insecticida. Algunas de las placas se mantuvieron  
20 en el recinto controlado durante 3 días más, realizándose  
entonces otras evaluaciones.

25 La eficacia insecticida se clasificó mediante la  
siguiente escala, en comparación con disolventes de control  
y controles no tratados.

0 = ningún control

1 = 1-7 larvas muertas

2 = 8-14 larvas muertas

3 = 15 larvas muertas.

30 La siguiente tabla contiene los resultados de los  
ensayos de compuestos típicos.

1	Compuesto	Proporción de aplicación, ppm	Escarabajo mejicano de la judía		Escalara del sur	
			4 días	7 días	4 días	7 días
5	N-[5-(4-pentafluorotifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	2	3	3	3
		100	2	3	3	3
	N-[5-(6-metoxi-2-benzo[b]fural)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	2	2	2	2
		100	1	2	1	2
10	N-[5-(2-indenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	0	1	3	3
		100	0	0	2	3
	N-[5-(5-metoxi-2-benzo[b]fural)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	0	0	0	0
		100	0	0	0	0
15	N-[5-(5-trifluorometil-2-benzo[b]fural)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	0	3	3	3
		100	0	2	3	3
	N-[5-(6-trifluorometil)-2-benzo[b]fural)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	0	2	3	3
		100	0	2	2	3
20	N-[5-(5-fluor-2-benzo[b]fural)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000	2	2	3	3
		100	1	1	3	3

1	Compuesto	Proporción de aplicación, ppm
5	N-[5-(4-pentafluoretóxifenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
10	N-[5-(6-metoxi-2-benzo[b]furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
10	N-[5-(2-indenil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
15	N-[5-(5-metoxi-2-benzo[b]furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
20	N-[5(5-trifluormetil-2-benzo[b]furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
20	N-[5-(6-trifluormetil)-2-benzo[b]furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
25	N-[5-(5-fluor-2-benzo[b]furil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida.	1000 100
30		

Proporción de aplicación, ppm	Escarabajo mejicano de la judía		Esciara del sur	
	4 días	7 días	4 días	7 días
-tia-				
1000	2	3	3	3
100	2	3	3	3
3,4-tia-				
1000	2	2	2	2
100	1	2	1	2
il]-2,6-				
1000	0	1	3	3
100	0	0	2	3
3,4-tia-				
1000	0	0	0	0
100	0	0	0	0
il)-1,3,4-				
1000	0	3	3	3
100	0	2	3	3
iril)-1,3,4-				
1000	0	2	3	3
100	0	2	2	3
3,4-tiadiazol-				
1000	2	2	3	3
100	1	1	3	3

1 El compuesto N-[5-(4-trifluormetoxifenil)-1,3,4-  
tiadiazol-2-il]-2,6-dimetoxibenzamida, fué ensayado median-  
te el mismo método pero a diferentes proporciones de apli-  
cación y el número de larvas de insectos muertas se evaluó  
5 como porcentaje en lugar de utilizar la escala de 0 a 3.  
En un ensayo de 4 días contra larvas de la esciara del sur,  
el compuesto produjo 100 % de muertes a 5 ppm y un 100 % de  
muertes a 2,5 ppm en un ensayo de 7 días. En un ensayo con-  
tra el escarabajo mejicano de la judía, el compuesto produ-  
10 jo un 100 % de muertes en 4 días a una proporción de apli-  
cación de 5 ppm y un 80 % de muertes en 7 días a 2,5 ppm.

Los datos ilustrativos anteriores ponen de manifies-  
to el potente efecto insecticida de los compuestos de fór-  
mula I. Los entomólogos comprenderán que los compuestos son  
15 muy útiles para el control de insectos de diversos órdenes  
que afectan adversamente a la humanidad y a sus empresas  
económicas.

Por ejemplo, los compuestos controlan coleópteros  
20 como Anthonomus grandis, Crambus caliginosellus, Oulema me-  
lanopus, Leptinotarsa decemlineata, Hypera postica, Anthrenus  
scrophulariae, Tribolium confusum, Lyctidae esp., Agriotes  
esp., Sitophilus oryzae, Nodonota puncticollis y Conotrache-  
lus neruphar; dípteros como Musca domestica, Stomoxys calci-  
trans, Haematobia irritans, Phormia regina, Hylemya brassi-  
cae y Psila rosae; lepidópteros como Laspeyresia pomonella,  
25 Euxoa esp., Plodia interpunctella, Tartriciidae esp., Helio-  
this zea, Ostrinia nubilalis, Hellula rogatalis, Trichoplu-  
sia ni, Thyrodopteryx ephemeraeformis, Malacosoma americanum  
y Spodoptera frugiperda; y ortópteros como Blattella germa-  
nica y Periplaneta americana.  
30

1            Los compuestos son útiles para reducir las pobla-  
ciones de insectos y se utilizan en un método de reducción  
de una población de insectos que consiste en aplicar una  
cantidad insecticidamente efectiva de uno de los compuestos  
5 a una sustancia que ha de ser ingerida por los insectos.

Puede hacerse que los insectos ingieran el com-  
puesto aplicando este último a cualquier sustancia que ellos  
ingieran. Por ejemplo, los insectos que infestan las plan-  
tas son fácilmente controlados aplicando un compuesto a las  
10 partes de la planta que comen los insectos, especialmente  
el follaje. Los insectos que infestan y consumen textiles,  
papel, productos de madera y similares, se controlan fácil-  
mente aplicando un compuesto a dichos productos. Los com-  
puestos pueden utilizarse eficazmente de forma similar para  
15 proteger granos o semillas almacenados.

Es notable que los compuestos interfieran con la  
formación de las fases sucesivas de los insectos que los  
ingieren. Por ejemplo, cuando los insectos adultos ingieren  
los compuestos, los adultos en general no son afectados pe-  
20 ro depositan huevos estériles. Cuando una larva consume un  
compuesto, muere sin metamorfosearse a la siguiente fase  
larval. Las larvas de la última fase que consumen un com-  
puesto forman pupas pero mueren en forma de pupa.

Los entomólogos comprenderán que no se deduce que  
25 el uso de un compuesto de fórmula I dé lugar necesariamente  
a la extinción de una población de insectos. En algunos ca-  
sos, naturalmente, es destruída toda la población. En otros  
casos, parte de los insectos mueren y otros sobreviven al  
tratamiento con el compuesto. La porción de la población que  
30 muere depende de la especie del insecto, del compuesto par-

1 ticular utilizado, de la proporción de aplicación, del vi-  
gor de los insectos, de las condiciones atmosféricas y otros  
factores conocidos por los entomólogos. Así, el término "re-  
5 ducción de una población de insectos" se refiere a una dis-  
minución del número de insectos vivos, que en algunos pero  
no en todos los casos, llega a la desaparición de la pobla-  
ción de insectos tratados.

El grado de reducción de la población conseguido  
mediante un compuesto depende naturalmente de la proporción  
10 de aplicación del mismo. Debe utilizarse en todos los casos  
por lo menos una cantidad insecticidamente efectiva. El ter-  
mino "cantidad insecticidamente efectiva" se utiliza para  
describir la cantidad que es suficiente para producir una  
reducción mensurable en la población de insectos tratada.  
15 En general, las cantidades insecticidamente efectivas se  
encuentran comprendidas aproximadamente entre 1 y 1000 ppm.

Se sobreentiende que las proporciones de aplica-  
ción de los insecticidas se miden habitualmente en función  
de la concentración del insecticida en la dispersión en la  
20 que se aplica. La proporción de aplicación se mide de esta  
manera porque lo más conveniente es aplicar una cantidad de  
la dispersión suficiente para cubri el follaje u otra sus-  
tancia a tratar con una delgada película de la dispersión.  
Por lo tanto, la cantidad de dispersión aplicada depende de  
25 la superficie de la sustancia ingerible a tratar y la can-  
tidad de compuesto depende de su concentración en la dis-  
persión.

Las dispersiones en las que se aplican los compues-  
tos se preparan a partir de composiciones insecticidas tí-  
30 picas que, sin embargo, son nuevas debido a la presencia

1 de los nuevos compuestos de esta invención. Las de mayor  
utilidad son las dispersiones acuosas preparadas mezclando  
una pequeña cantidad de una composición insecticida concen-  
5 trada con una cantidad apropiada de agua para dar la con-  
centración deseada del compuesto. Estas composiciones dis-  
persables en agua concentradas, que contienen en general  
alrededor de 5 a 90 % del compuesto, se encuentran habitual-  
mente en forma de concentrados emulsionables, polvos moja-  
bles o suspensiones.

10 Los polvos mojables están constituidos por una mez-  
cla íntima del compuesto activo en un vehículo inerte que  
es una mezcla de un polvo inerte fino y agentes tensoacti-  
vos. La concentración del compuesto activo es habitualmente  
alrededor del 10 al 90 % en peso. El polvo inerte está se-  
15 leccionado habitualmente entre las arcillas atapulgíticas,  
las arcillas montmorilloníticas, las tierras de diatomeas  
o los silicatos purificados. Se encuentran agentes tensoac-  
tivos efectivos, que constituyen alrededor del 0,5 al 10 %  
del polvo mojable, entre las ligninas sulfonadas, los naf-  
20 talensulfonatos condensados, los naftalensulfonatos, los  
alquilbencenosulfonatos, los alquilsulfatos y los agentes  
tensoactivos no iónicos como aductos de óxido de etileno de  
alquifenoles.

25 Los concentrados emulsionables típicos de los com-  
puestos contienen una concentración conveniente del compues-  
to por ejemplo alrededor de 50 a 500 g por litro de líquido  
equivalente aproximadamente al 5-50 %, disuelto en un vehí-  
culo inerte que es una mezcla de disolvente orgánico no mis-  
30 cible con agua y emulgentes. Los disolventes orgánicos úti-  
les son los aromáticos, especialmente los xilenos y las

1 fracciones de petróleo, especialmente las porciones nafta-  
lénicas y olefínicas de alto punto de ebullición del petró-  
leo, tal como la nafta aromática pesada. También pueden uti-  
lizarse otros disolventes orgánicos como los disolventes  
5 terpénicos, incluidos los derivados de colofonia y los al-  
coholes complejos como 2-etoxietanol. Los emulgentes adecua-  
dos para los concentrados emulsionables se seleccionan en-  
tre los mismos tipos y concentraciones de agentes tensoac-  
tivos utilizados para los polvos mojables.

10 Las suspensiones de los compuestos están consti-  
tuídas por una concentración del compuesto similar a la de  
un concentrado emulsionable, en forma de un polvo finamente  
dividido suspendido en un líquido no disolvente adecuado.  
El líquido no disolvente más adecuado es una mezcla de agua  
15 y agentes tensoactivos. Se utilizan para las suspensiones  
los mismos tipos de agentes tensoactivos empleados para los  
polvos mojables. En muchos casos se emplea una pequeña can-  
tidad de un diluyente inerte para mejorar las propiedades  
de suspensión. Entre estos diluyentes inertes se encuentran  
20 las arcillas hinchables como atapulgita y montmorillonita,  
los almidones y especialmente los silicatos purificados.

25 Cuando se considere conveniente por cualquier ra-  
zón, es igualmente práctico aplicar el compuesto en forma  
de una solución en un disolvente orgánico apropiado, habitual-  
mente un aceite de petróleo blando tal como aceite de pulve-  
rización que son ampliamente utilizados en química agrícola.

30 Además, los compuestos pueden ser aplicados como  
composiciones en forma de polvos finos o de preparados en  
aerosol. Los polvos finos están constituidos por un compues-  
to en forma finamente pulverizada, dispersado en un vehícu-

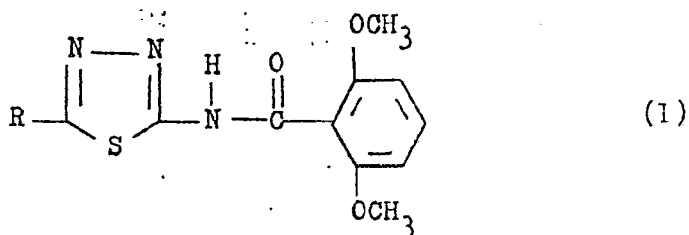
1 lo inerte pulverizado. El vehículo es habitualmente una ar-  
cilla pulverizada, como pirofilita, bentonita, un depósito  
volcanico o montmorillonita. Los polvos finos habitualmente  
5 contienen unas concentraciones del compuesto comprendidas  
entre 0,1 y 10 % aproximadamente.

Las composiciones en aerosol comprenden un compues-  
to de fórmula I disuelto o dispersado en un vehículo inerte  
que es una mezcla propelente generadora de presión y enva-  
sado en un contenedor del que es dispersada la mezcla a -  
10 través de una válvula atomizadora. Las mezclas propelentes  
están constituidas por halocarburos de bajo punto de ebulli-  
ción, que pueden estar mezclados con disolventes orgánicos  
o por suspensiones acuosas presurizadas con gases inertes  
o con hidrocarburos gaseosos.

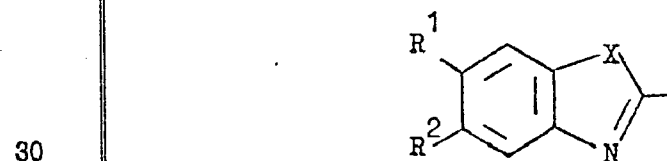
15 En resumen, la Patente de Invención que se solici-  
ta deberá recaer sobre las siguientes:

REIVINDICACIONES

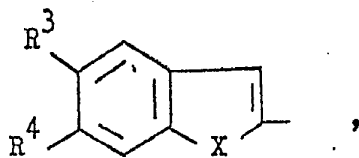
1.- Un procedimiento para la preparación de nuevas  
20 tiadiazolilbenzamidas de fórmula:



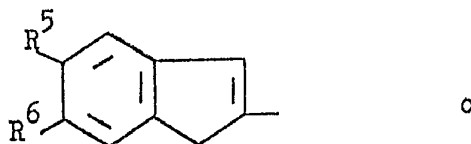
25 donde R representa



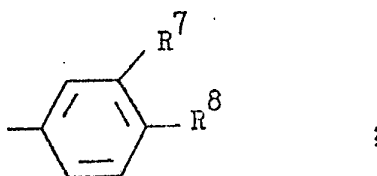
1



5



10



15

X representa oxígeno o azufre;  
uno de los grupos R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representa hidrógeno y el otro representa flúor, cloro, bromo, trifluormetilo o metoxi;

uno de los grupos R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representa hidrógeno y el otro representa metoxi o trifluormetilo;

20

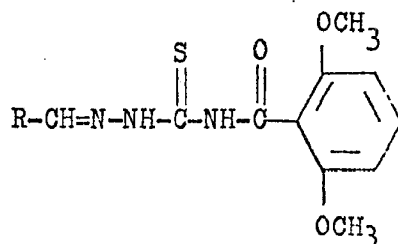
uno de los grupos R<sup>5</sup> o R<sup>6</sup> representa hidrógeno y el otro representa cloro, bromo, flúor, trifluormetilo o hidrógeno;

25

uno de los grupos R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> representa hidrógeno y el otro representa alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> sustituido con uno o más átomos de flúor;

cuyo procedimiento se caracteriza por ciclar un compuesto de fórmula:

30



V

1 con un agente oxidante.

2. Un procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque la temperatura está comprendida entre 50 y 100º.

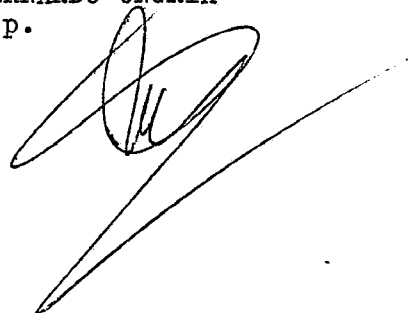
5 3. Un procedimiento según la reivindicación 2, caracterizado porque el agente oxidante es cloruro férrico.

4. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita:  
UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVAS TIADIAZOLIL-  
10 BENZAMIDAS.

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

15

Madrid, 16 de abril de 1.979  
BERNARDO UNGRIA  
P.P.



20

25

30