

312023



PATENTE DE INVENCION

O.Z. 22.995/23.567

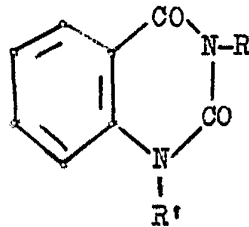
Memoria Descriptiva
sobre

"Procedimiento para la obtención de mezclas herbicidas"

Solicitante: BADISCHE ANILIN- & SODA-FABRIK AKTIENGESELLSCHAFT,
entidad alemana, residente en
Ludwigshafen/Rhein,
República Federal Alemana.

Encontróse que resulta ventajoso, para
la destrucción de malas hierbas, el empleo de mez-
clas herbicidas que contienen 2,4-dioxotetrahydro-
quinazolininas (=2,4-quinazolindionas = ureas de
5. benzoileno) de la fórmula

312023 -2-



- en la cual R significa un grupo inferior alquilo o alquenoilo de cadena lineal o cíclica, eventualmente substituído por cloro, un grupo hidroxí o un grupo alcoxi, y R' representa hidrógeno ó el grupo
5. $-(CO)_n-A$; en este grupo, n es una de las cifras 0 ó 1 y A representa un grupo lineal o cíclico de alquilo, alquenoilo o cicloalquilo, eventualmente substituído por cloro, metilo o fenoxi, o un grupo fenilo eventualmente substituído por cloro, bromo o
10. NO_2 , o el grupo ciclohexilo o decahidronaftilo.

Entre las sustancias activas apropiadas para los efectos de la presente invención figuran por ejemplo:

- 3-metil-, 3-etil-, 3-n-propil-, 3-isopropil-,
15. 3-n-butil-, 3-sec.-butil-, 3-alil-, 3-(β -cloroetil)-, 3-(γ -cloro-propil)-, 3-(α -clorometil-propil)-, 3-(γ -metoxipropil)-, 3-(β -hidroxietil)-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina, 1-metil-, 1-etil-, 1-acetil-, 1-propionil-, 1-butiril-, 1-isobutiril-, 1-metil-
20. etil-acetil-, 1-metil-propil-acetil-, 1-etil-butil-acetil-, 1-(2,2,4,4-tetrametilvaleroil)-, 1-dimetil-etil-acetil-, 1-dimetilpropil-acetil-, 1-metil-etil-butil-acetil-, 1- ω -clorocaproil-, 1-ciclopropanoil-,



- 1-caprooil-, 1-caprilil-, 1-laurooil-, 1-crotonil-,
1-dimetil-acril-, 1-ciclopentanoil-, 1-(1-metil-
ciclopentanoil)-, 1-ciclohexanoil-, 1-(1-metilciclo-
hexanoil)-, 1-ciclohexen-1-oil-, 1-decahidronaftil-
5. 9-oil-, 1-benzoil-, 1-o-, m- y p-clorobenzoil-, 1-p-
bromobenzoil-, 1-(2,4-diclorobenzoil)-, 1-p-nitro-
benzoil-, 1-(2-cloro-5-nitrobenzoil)-, 1-fenoxi-
acetil-3-isopropil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina,
1-acetil-, 1-butilil-, 1-isobutilil-3-sec.-butil-2,4-
10. dioxo-tetrahidro-quinazolina, 1-acetil-, 1-isobutilil-
3-W-cloroetil-2,4-dioxo-tetrahidroquinazolina,
1-acetil-, 1-propionil-, 1-butilil-, 1-isobutilil-,
1-metil-etil-acetil-, 1-etil-butil-acetil-, 1-metil-
etil-butil-acetil-, 1-crotonil-3-propil-2,4-dioxo-
15. tetrahidro-quinazolina, 1-acetil-, 1-propionil-,
1-butilil-, 1-isobutilil-, 1-metiletil-acetil-,
1-etil-butil-acetil-3-W-metoxipropil-2,4-dioxo-
tetrahidro-quinazolina, 1-acetil-, 1-propionil-,
1-isobutilil-3-alil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina,
20. 1-butilil-, 1-isobutilil-, 1-metil-etil-acetil-,
1-crotonil-3-isobutil-2,4-dioxo-tetrahidroquinazolina.

- Existen publicaciones acerca de algunas
substancias del tipo indicado, por ejemplo la 3-metil-,
3-etil-, 3-n-propil-, 3-isopropil-, 3-n-butil- y
25. 3-alil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina.

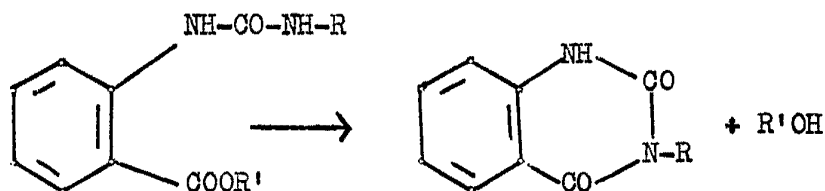
- Los compuestos no descritos en publica-
ciones técnicas pueden obtenerse mediante procedi-
mientos conocidos. Enuméranse a continuación algu-
nos métodos apropiados, los cuales, sin embargo,
30. no constituyen un objeto específico de la presente



-4-
312023

invención:

1. Ciclización de ácidos 2-ureídobenzoicos ω -substituidos o bien de ésteres (= derivados del ácido uramidobenzoico con substitución ω), convenientemente en presencia de agentes de condensación ácidos:



En esta fórmula, R tiene el significado arriba indicado y R' representa hidrógeno o alquilo.

10. Los derivados ω -substituidos del ácido 2-ureídobenzoico se obtienen convenientemente mediante

- a) reacción del ácido antranílico o de ésteres de este ácido, con isocianatos;
15. b) deciclización o sea apertura del anillo del anhídrido isático con aminas primarias (J.Org.Chem. 26, 5238 (1961), J.Org.Chem. 18, 1427 (1953)).

2. Reacción de degradación de Hofmann, de ftalamidas N-substituidas (J.Chem.Soc. 1945, 625).
20. 3. Reacción de anhídrido isático con isocianatos (J.Chem.Eng. Data 8, 454 (1963)).
4. Reacción de compuestos O-sulfonílicos de la N-oxifitalimida con aminas (patente alemana 1 068 263).
5. Reacción del ácido antranílico con monoalquil-



719023

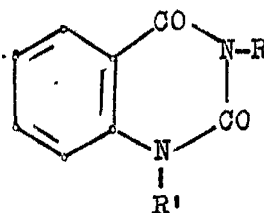
-5-

ureas en fusión (Comunicaciones 38, 131, 1213 (1905).

6. Alquilación de 3-alquil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolinas con halogenuros alquílicos, especialmente bromuros alquílicos y yoduros alquílicos (J. Indian Chem. Soc. 40, 35-38 (1963).

7. Acilación de 3-alquil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolinas con cloruros ácidos, en presencia de agentes ligadores de ácido clorhídrico.

10. Las nuevas 2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolinas sustituidas tienen los siguientes puntos de fusión o de ebullición:



R	R'	Punto de fusión (°C)	n_D
$\text{ClCH}_2\text{-CH}_2\text{-}$	H	194-195°C	
$\text{ClCH}_2\text{-C}_2\text{H}_4\text{-}$	H	178-179°C	
$\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH-}$ Cl	H	222-223°C	
$\text{C}_2\text{H}_5\text{-}$ CH / \	H	131-132,5°C	
$\text{CH}_3\text{-}$ CH / \	H	140-141°C	
$\text{CH}_3\text{O-C}_3\text{H}_6\text{-}$	H	258-259°C	
$\text{HOCH}_2\text{-CH}_2\text{-}$	H		
$\text{CH}_3\text{-}$ CH / \	$\text{CH}_3\text{-}$	104-105°C	
$\text{CH}_3\text{-}$			

712023 -6-



Dr. 1303

R	R'	Punto de fusión (°C)	n _D
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	C ₂ H ₅	79-80°C	
"	CH ₃ -CO-	128-130°C	
"	C ₂ H ₅ -CO-	98-100°C	
"	C ₃ H ₇ -CO-	punto de ebullición 0,1 = 152°C	n _D ²⁵ = 1,5425
"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	punto de eb. 0,2 = 153°C	n _D ²⁵ = 1,5493
"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO} \\ \diagup \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	p.d.eb. 0,2 = 159°C	n _D ²⁵ = 1,5448
"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO-} \\ \diagup \\ \text{C}_3\text{H}_7 \end{array}$	p.de.eb. 0,2 = 180°C	n _D ²⁵ = 1,5438
"	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO-} \\ \diagup \\ \text{C}_3\text{H}_7 \end{array}$	p.d.eb. 0,2 = 178°C	n _D ²⁵ = 1,5312
"	$\begin{array}{c} \text{C}_4\text{H}_9 \\ \diagdown \\ \text{CH}_3-\text{C}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{CO-} \\ \diagup \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$	99°C	
"	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{C-CO-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \\ \diagup \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	79°C	

32023 -7-



R	R'	Punto de fusión (°C)	n_D^{25}
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{CH} \\ \text{CH}_3 \diagup \end{array}$	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{CH}_3 \text{---} \text{C} \text{---} \text{CO-} \\ \text{C}_3\text{H}_7 \diagup \end{array}$	p.d.eb. 0,3 = 187°C	$n_D^{25} = 1,5368$
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{CH} \\ \text{CH}_3 \diagup \end{array}$	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{C}_2\text{H}_5 \text{---} \text{C} \text{---} \text{CO-} \\ \text{C}_4\text{H}_9 \diagup \end{array}$	p.d.eb. 0,1 = 158°C	$n_D^{25} = 1,5275$
"	$\text{Cl}-(\text{CH}_2)_5\text{-CO-}$	162°C	
"	$\begin{array}{l} \text{H}_2\text{C} \\ \\ \text{CH-CO-} \\ \\ \text{H}_2\text{C} \end{array}$	52-55°C	
"	$\text{CH}_3\text{-CH=CH-CO-}$	p.d.eb. 0,2 = 173°C	$n_D^{25} = 1,5690$
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{C} \text{---} \text{CH} \text{---} \text{CO} \\ \text{CH}_3 \diagup \end{array}$	p.d.eb. 0,2 = 169°C	$n_D^{25} = 1,5688$
"		p.d.eb. 0,1 = 151°C	$n_D^{25} = 1,5503$
"		p.d.eb. 0,1 = 151°C	$n_D^{25} = 1,5520$
"		p.d.eb. 0,1 = 163°C	$n_D^{25} = 1,5485$
"		p.d.eb. 0,3 = 185°C	$n_D^{25} = 1,5721$

312023

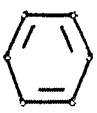
-8-



R	R'	Punto de fusión (°C)	n _D ²⁵
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$		p.d.eb. _{0,1} =165°C	n _D ²⁵ = 1,5616
"	C ₆ H ₅ -CO-	p.d.eb. _{0,05} =155-160°C	
"		p.d.eb. _{0,2} =203°C	n _D ²⁵ = 1,6050
"		p.de eb. _{0,2} =203°C	n _D ⁴⁰ = 1,6010
"		128°C	
"		134°C	
"		p.de eb. _{0,2} =188°C	n _D ⁴⁰ = 1,6112
"		158°C	
"		163°C	



312023 -9-

R	R'	Punto de fusión (°C)	n _D ²⁵
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	 -O-CH ₂ -CO-	p.de eb. 0,2 = 202°C	
$\begin{array}{l} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \diagdown \\ \text{CH-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ -CO-	68°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	p.de eb. 0,1 = 137°C	n _D ²⁵ = 1,5455
"	C ₃ H ₇ -CO-	p.de eb. 0,2 = 154°C	n _D ²⁵ = 1,5448
Cl-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃ -CO-	151°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	97°C	
CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃ -CO-	105°C	
"	C ₂ H ₅ -CO-	122°C	
"	C ₃ H ₇ -CO-	64-66°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH-CO-} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	86-88°C	

312023 -10-



R	R'	Punto de fusión(°C)	n _D ²⁵
CH ₃ -CH ₂ -CH ₂	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \backslash \\ \text{CH-CO-} \\ / \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	60-62°C	
"	$\begin{array}{l} \text{C}_2\text{H}_5 \backslash \\ \text{CH-CO-} \\ / \\ \text{C}_4\text{H}_9 \end{array}$		n _D ²⁵ =1,5181
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \backslash \\ \text{C}_2\text{H}_5 - \text{C-CO-} \\ / \\ \text{C}_4\text{H}_9 \end{array}$		n _D ²⁵ =1,5221
"	CH ₃ -CH=CH-CO	95-96°C	
CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃ -CO	83°C	
"	C ₂ H ₅ -CO	53-55°C	
"	C ₃ H ₇ -CO-	54-56°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \backslash \\ \text{CH-CO} \\ / \\ \text{CH}_3 \end{array}$	60-62°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \backslash \\ \text{CH-CO} \\ / \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	65°C	
"	$\begin{array}{l} \text{C}_2\text{H}_5 \backslash \\ \text{CH-CO} \\ / \\ \text{C}_4\text{H}_9 \end{array}$		n _D ²⁵ = 1,5219
CH ₂ =CH-CH ₂ -	CH ₃ -CO-	85-88°C	
"	C ₂ H ₅ -CO-	56-57°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \backslash \\ \text{CH-CO-} \\ / \\ \text{CH}_3 \end{array}$	91-93°C	



32023-11-

R	R'	Punto de fusión (°C)	n _D
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \text{CH}_3 \diagup \end{array}$	$\text{C}_3\text{H}_7-\text{CO}-$	110°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{CH}-\text{CO} \\ \text{CH}_3 \diagup \end{array}$	58-59°C	
"	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \diagdown \\ \text{CH}-\text{CO}- \\ \text{C}_2\text{H}_5 \diagup \end{array}$	87-88°C	
"	$\text{CH}_3-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$	83-84°C	



3'2023 -12-

Las 2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolininas substituídas se presentan en forma de sustancias sólidas cristalinas o de líquidos viscosos, con buena resistencia al calor y a los agresivos químicos.

5. Para obtener las mezclas herbicidas de la presente invención, las sustancias activas se mezclan con los agentes auxiliares usuales, sólidos o líquidos, como diluyentes, disolventes, agentes de emulsión y de dispersión, etc. Empléase en este respecto por ejemplo agua o agua y humectantes o líquidos orgánicos o abonos sólidos o arcilla o tierra de infusorios.

10. Las mezclas herbicidas de la presente invención son muy indicadas como herbicidas selectivos para cereales y para la destrucción total de malas hierbas, por ejemplo en terraplenes de ferrocarriles, carreteras y caminos.

15. No hay tampoco inconveniente en añadir insecticidas, fungicidas, bactericidas y otros herbicidas, en vez de mezclar las sustancias activas con abonos.

20. En los siguientes ejemplos se explicará en detalle la aplicación de los productos de la presente invención.

25. EJEMPLO 1 -

30. En el invernáculo, una cantidad equivalente a la aplicación de 3 kg de sustancia activa/hectárea de 3-isopropil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolinina emulsionada en 1000 l de agua/hectárea mediante adición de sulfonato de lignina sódica se rocía so-

3-2023 -13-



bre la tierra sembrada poco antes de las plantas a continuación enumeradas:

- Cebada (*hordeum vulgare*), trigo (*triticum sativum*), avena (*avena sativa*), mostaza (*sinapis alba*), poa anual (*poa annua*), ballico perenne (*lolium perenne*) manzanilla loca (*matricaria chamomilla*), cenizo blanco (*chenopodium album*), lino (*linum usitatissimum*), lepidio (*lepidium sativum*) mijo común (*panicum miliaceum*), ortiga menor (*urtica urens*), acedera común (*rumex acetosa*) y llantén menor (*Plantago lanceolata*).

- A las 4 semanas de aplicación, no se observa sino una ligera alteración en la cebada (*hordeum vulgare*), el trigo (*triticum sativum*) y la avena (*avena sativa*). En cambio, resultaron fuertemente atacadas las hierbas monocotiledóneas, como la *poa annua* y el *lolium perenne*, y completamente destruidas las plantas dicotiledóneas.

EJEMPLO 2 -

- En el invernáculo, una cantidad equivalente a la aplicación de 5 kg de sustancia activa sobre una hectárea, de 3-isopropil-2,4-dioxotetrahydro-quinazolina dispersada en 1000 l de agua por hectárea, mediante adición de sulfonato de lignina sódica, se rocía sobre las siguientes plantas de una altura de crecimiento comprendida entre 4 y 8 cm:

- Mostaza (*sinapis alba*), poa anual (*poa annua*), ballico perenne (*lolium perenne*), amor de hortelano (*galium aparine*), manzanilla loca (*matri-*



342023 -14-

caria chamomilla) cenizo blanco (*chenopodium album*), lino (*linum usitatissimum*), lepidio (*lepidium sativum*), perejil (*petroselinum sativum*), acedera común (*rumex acetosa*), mijo (*panicum miliaceum*) y ortiga menor (*urtica urens*).

5.

A las 4 semanas de aplicación, todas las plantas resultan completamente destruidas.

Son de eficacia análoga a la de la 3-isopropil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina:

10.

3-metil-, 3-etil-, 3-n-propil-, 3-n-butil-, 3-sec.butil-, 3-(2-etilhexil)-, 3-alil-, 3-bencil-, 3- β -fenetil-, 3- β -cloroetil-, 3- γ -cloropropil-, 3- γ -metoxipropil-, y 3- γ -etoxipropil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina.

15.

EJEMPLO 3 -

En macetas de plástico (diámetro = 8 cm, colocadas en el invernáculo se introducen semillas de cebada (*hordeum vulgare*), trigo (*triticum vulgare*), maíz (*zea mays*), patatas (*solanum tuberosum*), poa

20.

anual (*poa annua*), alopecuro (*alopecurus myosuroides*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matricaria chamomilla*) y amor de hortelano (*galium aparine*), tratándose las plantas el mismo día del sembrado con

25.

3-isopropil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina (I) y, para obtener una comparación adecuada, con ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético (II), ascendiendo las cantidades de aplicación en cada caso a las equivalentes a 2 kg de sustancia activa/hectárea, dispersada en 500 l de agua/hectárea. Al cabo de 4 semanas, se

30.

3-2023

-15-



pudo constatar que I ejerce mayor acción herbicida que la substancia activa II.

Obtuvieronse los siguientes resultados:

	Substancia activa		
	I	II	
5.			
	Cebada	0 - 10	10
	Trigo	0	15
	Maiz	0	40
	Patatas	0	10-15
10.	Poa anual	70-80	10-20
	Alopecuro	50-60	20
	Mostaza silvestre	90-100	80-100
	Hierba pajarera	90-100	30
	Manzanilla	70-80	50-60
15.	Amor de hortelano	70-80	0

0 = Sin efecto

100 = Destrucción total.

Presentan eficacia biológica comparable con la del compuesto I:

- 20.
- 3-etil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-propil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-butil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-isobutil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-alil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 25.
- 3-metoxipropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-cloroetil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-cloropropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

EJEMPLO 4 -

Tratáronse las plantas a continuación enumeradas, de una altura de crecimiento comprendida entre 4 y 17 cm, con 3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (I) y, comparativamente, con ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético (II):

5. Trigo (*triticum vulgare*), cebada (*hordeum vulgare*), maíz (*zea mays*), patatas (*solanum tuberosum*), poa anual (*poa annua*), alopecuro (*alopecurus myosuroides*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), cenizo blanco (*chenopodium album*), manzanilla loca (*matricaria chamomilla*), amor de hortelano (*galium aparine*).

10. Aplicóse en cada caso una cantidad equivalente de 2 kg. de sustancia activa/hectárea, dispersada en 500 l de agua/hectárea. A las tres semanas de aplicación, se puso de manifiesto el hecho de que la acción herbicida de I supera en mucho a la del compuesto II.

15. En cuanto a los resultados obtenidos, véase la siguiente tabla:

	Sustancia activa	
	I	II
Trigo	0	0 - 10
25. Cebada	0 - 10	10
Maíz	0	30 - 40
Patatas	0	30 - 40
Poa anual	70 - 80	0
Alopecuro	60	10
30. mostaza silvestre	100	100



30023 -17-

	Substancia activa	
	I	II
Hierba pajarera	90 - 100	20 - 30
Cenizo blanco	90 - 100	100
5. Manzanilla	70 - 80	20
Amor de hortelano	80	0
0	= Sin efecto	
100	= Destrucción total	

Presentan eficacia análoga a la del

- 10. compuesto I:
 - 3-etil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-propil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-butil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-isobutil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 15. 3-alil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-metoxipropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-cloroetil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 - 3-cloropropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina.

EJEMPLO 5 -

- 20. El mismo día de sembrar las plantas mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matri-caria chamomilla*), galinsoga (*galinsoga parviflora*), ortiga menor (*urtica urens*), cenizo blanco (*cheno-podium album*), amor de hortelano (*galium aparine*)
- 25. y poa anual (*poa annua*), la tierra se trató con 3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina (I) y, comparativamente, con 2-cloro-4,6-bis-(etilamino)-s-



3-2023 -18-

5. triacina (II), Aplicóse una cantidad de 4 kg de substancia activa/hectárea, dispersada en 500 l de agua/hectárea. Después de brotar las malas hierbas, se constató que produce mayor efecto herbicida el compuesto I.

Son de eficacia biológica análoga a la del compuesto I:

- 3-etil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 3-propil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 10. 3-butil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 3-isobutil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 3-alil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 3-metoxipropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 3-cloroetil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
- 15. 3-cloropropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina.

EJEMPLO 6 -

Un área agrícola útil cubierta de mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matricaria chamomilla*), acedera (*rumex sp.*), galinsoga (*galinsoga parviflora*), ortiga menor (*urtica urens*), cenizo blanco (*chemopodium album*), amor de hortelano (*galium aparine*) y poa anual (*poa annua*), se trató con 3-isopropil-2,4-dioxo-tetrahidro-quinazolina (I), y, comparativamente, con 2-cloro-4,6-bis-(etilamino)-s-triacina (II), ascendiendo la cantidad de aplicación a la equivalente de 3 kg de substancia activa/hectárea. Las substancias activas se emplearon en forma dispersada en una cantidad de agua de 500 l /hectárea. En el momento del tratamiento, las malas hierbas tuvie-

20.

25.

30.



1965

312023 -19-

ron una altura de crecimiento comprendida entre 5 y 10

cm. Algunos días después, observáronse alteraciones considerables en las plantas tratadas con la sustancia activa I, mientras que las malas hierbas del área tratada con el compuesto II experimentaron todavía crecimiento normal. Transcurrido un período de unas 3 a 4 semanas, casi todas las malas hierbas dicotiledóneas resultaron completamente destruídas.

5.

Son de eficacia biológica análoga a

10.

la del compuesto I:

3-etil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

3-propil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

3-butil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

3-isobutil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

15.

3-alil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

3-metoxipropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

3-cloroetil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

3-cloropropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina.

EJEMPLO 7 -

20.

Introduécense en macetas de plástico

(diámetro = 8 cm) colocadas en el invernáculo se-

millas de cebada (*hordeum vulgare*), trigo (*triticum*

vulgare), maíz (*zea mays*), patatas (*solanum tuberosum*),

poa anual (*poa annua*), alopecuro (*alopecurus myosuroides*),

25.

mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba

pajarera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matri-*

caria chamomilla) y amor de hortelano (*galium aperi-*

ne). El mismo día del sembrado, la tierra se trata

con 1-acetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazo-

30.

lina (I) 1-butiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-

312023-20-



quinazolina (II) y, comparativamente, con la sal potásica del ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético (III). Aplicase en cada caso una cantidad equivalente a 1,5 kg de sustancia activa/hectárea, con dispersión o solución de la sustancia activa en 500 l de agua/hectárea. A las 4 semanas de aplicación, se pudo constatar que la eficacia herbicida de los compuestos I y II supera en mucho a la de la sustancia activa III.

10. Obtuvoéronse los siguientes resultados:

		<u>Substancia activa</u>		
		I	II	III
	Cebada	0	0	10
	Trigo	0	0	10
15.	Maíz	0	0	30-40
	Patatas	0	0	10
	Poa anual	60	80	10
	Alopecuro	50-60	70-80	10-20
	Mostaza	100	100	80-90
20.	Hierba pajarera	80	90-100	10-20
	Manzanilla	80	70-80	40-50
	Amor de hortelano	50	70-80	0
		0 = Sin efecto		
		100 = Destrucción total de las plantas		

25. Presentan eficacia biológica análoga a la de los compuestos I y II:

1-propionil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
 1-isobutiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina



312023 -21-

- 1-crotonil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
1-metiletilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
5. 1-butiletilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
1-metiletilbutilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
1-(2,4-diclorobenzoil)-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina
10. 1-dimetilacril-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
1-ciclopropanoil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
1-benzoil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
15. 1-fenoxiacetil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina

EJEMPLO 8 -

- Tratáronse las plantas (altura de crecimiento comprendida entre 4 y 17 cm) trigo (*tritium vulgare*), maíz (*zea mays*), patatas (*solanum tuberosum*), poa anual (*poa annua*), alopecuro (*alopecurus myosuroides*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matricaria chamomilla*), cenizo blanco (*chenopodium album*), amor de hortelano (*galium aparine*) con 1-acetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (I), 1-butiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (II) y, comparativamente, con la sal potásica del ácido 2-metil-4-cloro-fenoxiacético (III). Empleóse en cada caso una cantidad equivalente a 1,5 kg de substancia
20.
25.
30.



312023 -22-

5. activa/hectárea, con dispersión o solución de la sustancia activa en 500 l de agua/hectárea. Al cabo de 3 semanas, se pudo constatar que la eficacia herbicida de I y II supera en mucho a la del compuesto III, especialmente en el caso de la hierba pajarera, la manzanilla loca, amor de hortelano, poa anual y alopecuro.

En cuanto a los resultados obtenidos, véase la siguiente tabla:

101		Substancia activa		
		I	II	III
	Trigo	0	0-10	0
	Maíz	0	0-10	30
	Patatas	0	0	30-40
15.	Poa anual	40-50	70-80	0
	Alopecuro	40	60-70	0-10
	Mostaza silvestre	100	100	90-100
	Hierba pajarera	80	90-100	10-20
	Genizo blanco	90-100	100	90-100
20.	Manzanilla	40-50	80	10-20
	Amor de hortelano	60	80	0

0 = Sin efecto

100 = Destrucción total de las plantas.

Son de eficacia biológica análoga a

25. la de los compuestos I y II:

1-propionil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

1-isobutiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina

30. 1-crotonil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidro-quinazolina



312023⁻²³⁻

- 1-metiletetilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-butiletetilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
5. 1-metiletetilbutilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-(2,4-diclorobenzoil)-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
10. 1-dimetilacril-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-ciclopropanoil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-benzoil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-fenoxiacetil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
15. EJEMPLO 9 -
- El mismo día de sembrar las plantas mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarrera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matricaria chamomilla*), galinsoga (*galinsoga parviflora*),
20. ortiga menor (*urtica urens*), cenizo blanco (*chenopodium album*), amor de hortelano (*galium aparine*) y poa anual (*poa annua*), el área de experimentación se trató con 1-butiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (I) y, comparativamente, con
25. 2-cloro-4,6-bis-(etilamino)-s-triazina (II). Empleáronse en cada caso cantidades equivalentes a 4 kg de sustancia activa/hectárea, con dispersión de la misma en 500 l de agua/hectárea. Después de brotar las malas hierbas, se pudo constatar que el compuesto
30. I produce mayor efecto que la sustancia ac-



-24- 312023

tiva II.

Presentan eficacia biológica comparable con la del compuesto I:

- 5. 1-propionil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-isobutiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-crotonil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-metiletilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 10. 1-butiletilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-metiletilbutilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 15. 1-(2,4-diclorobenzoil)-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-dimetilacril-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-ciclopropanoil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 20. 1-benzoil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-fenoxiacetil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
- 1-acetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina

EJEMPLO 10 -

- Un área agrícola útil cubierta de mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), manzanilla loca (*matricaria chamomilla*), acedera común (*rumex sp.*), galinsoga (*galinsoga parviflora*), ortiga menor (*urtica urens*), cenizo blanco (*chenopodium album*), amor de hortelano (*galium aparine*) y poa anual (*poa annua*) se trata con
- 25.
 - 30.



20

-25-312023

- 1-butiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (I) y, comparativamente, con 2-cloro-4,6-bis-(etilamino)-s-triazina (II), ascendiendo la cantidad de aplicación a la equivalente de 3 kg de sustancia activa/hectárea. Las
5. sustancias activas se emplean en forma dispersada en 500 l de agua/hectárea. En el momento del tratamiento, las malas hierbas presentaron una altura de crecimiento comprendida entre 5 y 10 cm. Algunos días después, las plantas tratadas con el compuesto I mostraron señales
10. de la acción del herbicida, mientras que las malas hierbas del área tratada con el compuesto II experimentaron todavía crecimiento normal. Transcurrido un período de 3 a 4 semanas, casi todas las malas hierbas dicotiledóneas resultaron completamente destruidas.
15. Son de efecto biológico análogo al compuesto I:
- 1-propionil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-isobutiril-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-crotonil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-metiletilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
20. 1-butiletilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-metiletilbutilacetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
25. 1-(2,4-diclorobenzoil)-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-dimetilacril-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-ciclopropanoil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-benzoil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
30. 1-fenoxiacetil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina
 1-acetil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina.



312023

EJEMPLO 11 -

Introdúcense en macetas de plástico (diámetro = 8 cm) colocadas en el invernáculo semillas de cebada (*hordeum vulgare*), trigo (*triticum vulgare*), maíz (*zea mays*), patatas (*solanum tuberosum*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), ortiga menor (*urtica urens*), amor de hortelano (*galium aparine*), poa anual (*poa annua*). El mismo día del sembrado, se aplican los compuestos 1-metil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahydroquinazolina (I), 1-etil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahydroquinazolina (II) y, comparativamente, la sal potásica del ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético (III), ascendiendo las cantidades en cada caso a las equivalentes de 2 kg de sustancia activa/hectárea y empleándose los compuestos en dispersión o en solución en 500 l de agua/hectárea. A las 4 semanas de aplicación, pudo constatarse que la eficacia herbicida de I y II es mayor que la del compuesto III.

Obtuvieronse los siguientes resultados:

20.		Substancia activa		
		I	II	III
	Cebada	0	0	10
	Trigo	0	10	15
	Maíz	0	0	40
	Patatas	0	0	10-15
25.	Mostaza silvestre	80-100	100	80-100
	Hierba pajarera	70	80-90	30
	Ortiga menor	80	80-90	60-70
	Amor de hortelano	50-60	70-80	0
	Poa anual	50-60	60-70	10-20

30. 0 = Sin efecto
 100 = Destrucción total de las plantas



3'2023

-27-

Son de eficacia biológica análoga a la de los compuestos I y II:

1-metil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina

1-etil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina.

5. EJEMPLO 12 -

- Tratáronse las plantas (altura de crecimiento de 4 a 17 cm) trigo (*triticum vulgare*), cebada (*hordeum vulgare*), maíz (*zea mays*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), amor de hortelano (*galium aparine*) y poa anual (*poa annua*) con 1-metil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (I), 1-etil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (II) y, comparativamente, con la sal potásica del ácido 2-metil-4-cloro-fenoxiacético (III). Empleáronse cantidades equivalentes a 2 kg de substancia activa/hectárea, en dispersión o solución en 500 l de agua/hectárea. Después de 3 semanas, se puso de manifiesto la acción considerablemente más elevada de los compuestos I y II, en comparación con la substancia activa III.

En cuanto a los resultados obtenidos, véase la siguiente tabla:

312023 -28-

20



Substancia activa

	I	II	III
Trigo	0-10	0	0-10
Cebada	10	10	10
5. Maíz	0	0	30-40
Mostaza	100	100	100
Hierba pajarera	70-80	90-100	20-30
Amor de hortelano	60	70-80	0
Poa anual	50-60	70-80	0

10. 0 = Sin efecto

100 = Destrucción total de las plantas.

Son de efecto análogo a I y II:

1-metil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahydroquinazolina

1-etil-3-alil-2,4-dioxotetrahydroquinazolina.

15. EJEMPLO 13 -

El mismo día de sembrar las plantas cenizo blanco (*chenopodium album*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), ortiga menor (*urtica urens*), amor de hortelano (*galium aparine*), poa anual (*poa annua*), el área de experimentación se trató con 1-etil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahydroquinazolina (I) y, comparativamente, con 2-cloro-4,6-bis-(etilamino)-s-triazina (II). Aplicóse en cada caso una cantidad equivalente a 5 kg de substancia activa/hectárea, con dispersión de los compuestos en 500 l de agua/hectárea. 8 días después del brote de las malas hierbas, se pudo constatar que el compuesto I pro-

312023-29-



duce mayor efecto que la substancia activa II.

Son de eficacia biológica análoga a la del compuesto I:

1-metil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina

5. 1-etil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina

EJEMPLO 14 -

- Sobre un área agrícola útil cubierta de cenizo blanco (*chenopodium album*), mostaza silvestre (*sinapis arvensis*), hierba pajarera (*stellaria media*), ortiga menor (*urtica urens*), amor de hortelano (*galium aparine*), poa anual (*poa annua*), se rociaron los compuestos 1-etil-3-isopropil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina (I) y, comparativamente, 2-cloro-4,6-bis-(etilamino)-s-(triazina) (II), ascendiendo la cantidad de aplicación a la equivalente a 5 kg de substancia activa/hectárea. Los compuestos se emplearon en forma dispersada, en 500 l de agua/hectárea. En el momento del tratamiento, las malas hierbas presentaron una altura de crecimiento comprendida entre 5 y 10 cm. Transcurridos algunos días, las plantas tratadas con I mostraron señales de la acción del herbicida, mientras que las malas hierbas tratadas con el compuesto II experimentaron todavía crecimiento normal. Al cabo de 3 a 4 semanas, casi todas las malas hierbas dicotiledóneas resultaron completamente destruídas.
- 10.
- 15.
- 20.
- 25.

Son de eficacia análoga a I;

1-metil-3-isobutil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina

1-etil-3-alil-2,4-dioxotetrahidroquinazolina.

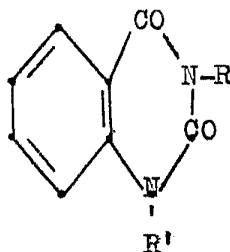
312023 - 30 -

N O T A



- Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a las solicitudes de Patentes presentadas en Alemanias: B 76.408 de 20 de abril de 1964 y B 81.248 de 31 de marzo de 1965, acogiéndose por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España: "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCIÓN DE MEZCLAS HERBICIDAS"; caracterizándose por lo siguiente:

1ª.- Procedimiento para la obtención de mezclas herbicidas, caracterizado porque comprende la mezcla de humectantes o diluyentes sólidos con las quinazolinonas substituídas de fórmula



20. en la cual R significa un grupo alquilo o alqueniilo inferior de cadena lineal o cíclica, eventualmente substituído por cloro, un grupo hidroxilo o un grupo

312023

-31-



- alcoxi, y R' representa hidrógeno o el grupo $-(CO)_n-A$, siendo en este grupo n una de las cifras 0 ó 1 y representando A un grupo alquilo, alquenilo o cicloalquilo de cadena lineal o cíclica, eventualmente substituído por cloro, metilo o fenoxi, o un grupo fenilo eventualmente substituído por cloro, bromo o NO_2 , o el grupo ciclohexilo o decahidronaftilo.
5. 2ª - Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la mezcla se efectúa a temperatura ambiente y al pH del agua cuando ésta se emplea como humectante o diluyente.
10. 3ª - Procedimiento según las reivindicaciones anteriores caracterizado porque a la mezcla se le agregan agentes de reticulación.
15. 4ª - Procedimiento según las reivindicaciones anteriores caracterizado porque a la mezcla se le pueden agregar otros herbicidas fungicidas o insecticidas.
20. 5ª - Procedimiento para la obtención de mezclas herbicidas tal y como queda substancialmente descrito en la presente Memoria.

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

Madrid, 20 ABR. 1965

BADISCHE ANILIN- & SODA-FABRIK
AKTIENGESELLSCHAFT,

J. GÓMEZ ACEBO Y MODESTO
7ª