



PATENTE DE INVENCION

O.7. 27 836.

409324

*Memoria Descriptiva*

*sobre:*

PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR ANILIDAS SULFONILGLICOLICAS

N-SUBSTITUIDAS.-

-----

*Solicitante:* BADISCHE ANILIN- & SODA-FABRIK AKTIENGESELLSCHAFT,  
entidad alemana, residente en 6700 Ludwigshafen,  
República Federal Alemana.-

-----

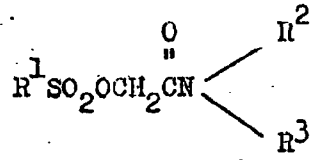
La presente invención se refiere a un procedimiento para preparar anilidas sulfonilglucólicas N-sustituidas, nuevas y valiosas para combatir el crecimiento de plantas indeseadas.

5. Es conocido el empleo de anilidas de ácido subs-



tituidas como herbicidas, por ejemplo la N-isopropilanilida del ácido cloroacético, la N-propargilanilida del ácido cloroacético o la N-isobutinilanilida del ácido cloroacético, pero su efecto no es satisfactorio.

5. Se ha encontrado que producen un buen efecto herbicida las anilidas sulfonilglicólicas N-sustituidas de fórmula



10. en la que R<sup>1</sup> significa un radical alquilo, cicloalquilo, alquilo halogenado, aralquilo, alquenilo o alquenilo halogenado o un radical fenilo en caso dado substituido por alquilo, alquilo halogenado, alcoxi, halógeno o el grupo nitro,  
15. R<sup>2</sup> representa un radical fenilo en caso dado substituido por alquilo, R<sup>3</sup> es un radical alquilo con más de dos átomos de carbono, un radical cicloalquilo, un radical alquenilo o alquinilo.

20. Por consiguiente, R<sup>1</sup> puede significar, por ejemplo metilo, clorometilo, etilo, 2-cloroetilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, sec.-butilo, terc.-butilo, pentilo, ciclopentilo, hexilo, ciclohexilo, benzilo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, fenilo, 4-metilfenilo, 4-clorofenilo, 4-bromo-fenilo, 4-nitrofenilo, 4-flúorfenilo, 4-yodofenilo, 4-etilfenilo, 2-nitrofenilo, 3-nitrofenilo, 3,4-diclorofenilo, etc.

25. R<sup>2</sup> puede significar, por ejemplo: fenilo 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 4-etilfenilo, 2,6-dimetilfenilo, 2,6-dietilfenilo, 2,5-dimetilfenilo, 3,5-dimetilfenilo, 3,4-dimetilfenilo, 2,4-dimetilfeni-

30.



lo, 2,3-dimetilfenilo, 2,4,6-trimetilfenilo, 2,4,5-trimetilfenilo, 4-isopropilfenilo, 2-isopropilfenilo, 2-metil-6-etilfenilo, 2,6-diisopropilfenilo, etc.

5.  $R^3$  puede representar, por ejemplo, los radicales siguientes: n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, sec.-butilo, terc.-butilo, pentilo, ciclopentilo, hexilo, ciclohexilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, propargilo, butinilo, pentinilo, hexinilo.

10. Los compuestos conforme a la presente invención se pueden obtener haciendo reaccionar una anilida de ácido glicólico substituída con un cloruro de sulfonilo substituído en presencia de un aceptor de ácido, por ejemplo trietilamina.

Los ejemplos que siguen aclaran la preparación de los compuestos:

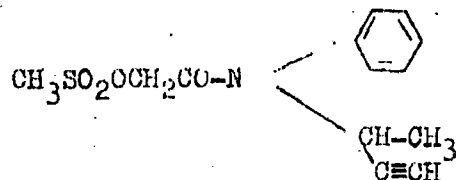
15. Ejemplo 1:

Preparación de N-butin-1-il-3-anilida O-metilsulfonilglicólica:

20. Una solución de 30,5 partes en peso de N-butin-1-il-3-anilida de ácido glicólico y 27,6 partes en peso de trietilamina en 920 partes en peso de diclorometano se mezcló, a 0°C en el transcurso de 20 minutos, con una solución de 21 partes de cloruro metanosulfónico en 26 partes en peso de diclorometano. Después de otros 45 minutos se lavó la mezcla de reacción con agua glacial, con ácido clorhídrico frío al 5 % y finalmente con solución fría, saturada, de bicarbonato de sodio. La fase orgánica se secó con sulfato de magnesio y se concentró en el vacío. Al enfriar, el residuo aceitoso se volvió cristalino después de agregar un poco de éter. El producto en bruto se recristalizó en éter. Punto de fusión:
30. 58 hasta 60°C. El compuesto así obtenido tiene la fórmula es-



structural siguiente:



5.

De manera correspondiente se pueden obtener, entre otros, por ejemplo los compuestos siguientes:

- N-propargil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,  
N-propargil-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico,  
10. N-propargil-anilida de ácido O-propilsulfonilglicólico,  
N-propargil-anilida de ácido O-i-propilsulfonilglicólico,  
N-propargil-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico,  
N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico,  
pf. 76 hasta 78°C,  
15. N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-propilsulfonilglicólico,  
p.f. 50 hasta 52°C,  
N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-i-propilsulfonilglicólico,  
p.f. 83 hasta 85°C,  
N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico,  
20. p.f. 69 hasta 71°C,  
N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-ciclohexilsulfonilglicólico,  
pf. 99 hasta 100°C,  
N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-clorometilsulfonilglicólico,  
p.f. 80 hasta 81°C,  
25. N-3-metilbutin-1-il-3-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,  
p.f. 89 hasta 90°C,  
(N-3-metilbutin-1-il-3-)-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico,  
p.f.-  
N-3-metilbutin-1-il-3-anilida de ácido O-propilsulfonilglicólico,  
30. lico,



- N-3-metilbutin-1-il-3-anilida de ácido O-i-propilsulfonilglicólico,
- N-3-metilbutin-1-il-3-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico,
5. N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-fenilsulfonilglicólico, p.f. 86 hasta 87°C,
- N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-4-metilfenilsulfonilglicólico, p.f. 67 hasta 69°C,
10. N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-4-clorofenilsulfonilglicólico, aceite,
- N-i-propil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico, p.f. 92 hasta 93°C,
- N-i-butil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico, p.f. 70 hasta 71°C,
15. N-terc.-butil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,
- N-i-propil-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico, p.f. 60 hasta 61°C,
- N-i-butil-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico,
- N-terc.-butil-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico,
20. N-i-propil-anilida de ácido O-propilsulfonilglicólico, p.f. 56 hasta 57°C,
- N-i-butil-anilida de ácido O-propilsulfonilglicólico,
- N-i-propil-anilida de ácido O-i-propilsulfonilglicólico, p.f. 60 hasta 62°C,
25. N-i-propil-anilida de ácido O-fenilsulfonilglicólico,
- N-i-propil-anilida de ácido O-4-metilfenilsulfonilglicólico,
- N-i-propil-anilida de ácido O-4-clorofenilsulfonilglicólico,
- N-propargil-anilida de ácido O-fenilsulfonilglicólico,
- N-propargilanilida de ácido O-4-metilfenilsulfonilglicólico,
30. N-propargil-anilida de ácido O-4-clorofenilsulfonilglicólico,



- N-alil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,  
N-alil-anilida de ácido O-etilsulfonilglicólico,  
N-alil-anilida de ácido O-propilsulfonilglicólico,  
N-alil-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico,  
5. N-alil-anilida de ácido O-fenilsulfonilglicólico,  
N-alil-anilida de ácido O-4-metilfenilsulfonilglicólico,  
N-alil-anilida de ácido O-4-clorofenilsulfonilglicólico,  
N-i-propil-anilida de ácido O-butilsulfonilglicólico, p.f.  
76 hasta 78°C,  
10. N-i-propil-anilida de ácido O-pentilsulfonilglicólico, p.f.  
50 hasta 52°C,  
N-i-propil-anilida de ácido O-ciclohexilsulfonilglicólico,  
p.f. 110 hasta 112°C,  
N-i-propil-anilida de ácido O-benzilsulfonilglicólico, p.f.  
15. 107 hasta 108°C,  
N-sec-butil-anilida de ácido O-i-propilsulfonilglicólico, p.f.  
55 hasta 56°C,  
N-sec-butil-anilida de ácido O-butilsulfonilglicólico, p.f.  
44 hasta 46°C,  
20. N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-pentilsulfonilglicólico,  
p.f. 49 hasta 50°C,  
N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-benzilsulfonilglicólico,  
p.f. 65 hasta 66°C,

25. Mediante hidrogenación parcial o bien completa del triple enlace carbono-carbono de anilidas O-sulfonil-N-alquil-glicólicas apropiadas se pueden obtener las correspondientes anilidas O-sulfonil-N-alquenil- o bien O-sulfonil-N-alquil-glicólicas.

Ejemplo 2:

30. Preparación de N-buten-1-il-3-anilida de ácido O-me



tilsulfonilglicólico:

5. Una solución de 28,1 partes en peso de N-butil-1-il-3-anilida O-metilsulfonilglicólica en 180 partes en peso de acetato de etilo se mezcla con 1 parte de catalizador (0,7 % en peso de paladio sobre carbonato de calcio, mezclado con cinc) y se hidrogena a temperatura ambiente y 0,02 atmósferas de sobrepresión hasta absorber 2350 partes por volumen de hidrógeno. A continuación se separa el catalizador, se concentra la solución, al vacío, hasta quedar seca

10. y se recristaliza el residuo en éter.

Punto de fusión: 54 hasta 55°C.

15. Procediendo de manera correspondiente y empleando un catalizador de paladio sobre carbón (al 10 %) se obtiene mediante hidrogenación completa la N-sec.-butil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico del punto de fusión 68 hasta 70°C.

20. Los compuestos conforme a la presente invención pueden aplicarse en forma de soluciones, emulsiones, suspensiones o agentes de espolvoreo. Las formas de aplicación vienen determinadas por las finalidades del empleo, pero en todo caso es necesario que esté asegurada la fina repartición de la sustancia activa.

25. Para obtener soluciones directamente pulverizables se pueden emplear como líquidos de pulverización hidrocarburos con puntos de ebullición superiores a los 150°C, por ejemplo tetrahidronaftalina o naftalinas alquiladas, o líquidos orgánicos con puntos de ebullición superiores a los 150°C y uno o múltiples grupos funcionales tales como por ejemplo el grupo ceto, el grupo éter, el grupo éster o el

30. grupo amida, pudiendo este grupo encontrarse como sustitu-



yente en una cadena de hidrocarburo o ser componente de un anillo heterocíclico.

5. Las formas de aplicación acuosas se pueden preparar mediante la adición de agua a concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables). Para obtener emulsiones, las sustancias se pueden homogeneizar en agua o disolventes orgánicos, empleando las sustancias activas como tales o disueltas en un disolvente, mediante agentes de humectación o dispersión, por ejemplo productos de adición de óxido de polietileno. Existe también la posibilidad de preparar, partiendo de la sustancia activa, un agente de emulsión o de dispersión y en caso dado un disolvente, concentrados diluibles con agua. Además, se pueden agregar aceites o agentes adherentes.

10. Los agentes de espolvoreo se obtienen mezclando o moliendo las sustancias activas junto con un soporte sólido, por ejemplo kieselguhr, talco, arcilla o abonos.

15. Se obtienen granulados uniendo las sustancias activas a soportes sólidos.

20. Ejemplo 3:

En tiestos experimentales se llena arena arcillosa para luego sembrar semillas de zea mays (maíz), soja hispida (soja), gossypium hirsutum (algodón), echinocloa crus galli (especie de mijo común), setaria spp. (especies de mijo setiforme, setaria), poa trivialis (poa común), lolium multiflorum (lolio italiano) y sinapis arvensis (mostaza silvestre).

25. A continuación se trata el suelo con N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico (I), con N-sec.-butil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico (II) y con 30. los compuestos comparativos N-propargil- $\alpha$ -cloroacet-anilida



(III) y N-butin-(1)-il-(3)-anilida de ácido cloroacético (VII), siempre con cantidades de aplicación de 2 kg de sustancia activa por hectárea, en dispersión en 500 litros de agua por hectárea.

5.

Después de 4 hasta 5 semanas los compuestos I y II mostraron un efecto herbicida más fuerte en las malas hierbas mono y dicotiledóneas que los compuestos III y VII, siendo igual de buena la compatibilidad con las plantas de cultivo.

El resultado obtenido se indica en la tabla que

10.

sigue:

	Substancia activa			
	I	II	III	VII
Zea Mys (Maíz)	0	0	0	0
Soja hispida (Soja)	0	0	0	10
15. Gossypium hirsutum (algodón)	0	0	0	0
Echinochloa crus galli (esp. de mijo común)	100	100	70	95
Setaria spp. (esp. de setaria)	100	95	70	85
Poa trivialis (espiguilla común)	100	75	40	65
20. Lolium multiflorum (lolo italiano)	95	75	40	70
Sinapis arvensis (mostaza silvestre)	75	40	20	20
0 = Sin daño				
100 = Destrucción total				

25.

Mostraron una eficacia biológica igual que I y II en este experimento los compuestos:

N-i-propil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,  
N-isobutil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico.

Ejemplo 4:

30.

Las plantas zea mays (maíz), triticum aestivum (tri



5. go), *Echinochloa crus galli* (especie de mijo común), *Setaria* spp. (especie de mijo setiforme) y *Panicum* spp. (especie de mijo panicular) se trataron, ascendiendo su altura de crecimiento a 5 hasta 15 cm, con los compuestos N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico (I), N-sec-butyl-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico (II) y los agentes comparativos N-propargil- $\alpha$ -cloroacet-anilida (III) y N-butin-1-il-3- $\alpha$ -cloroacet-anilida (VII). Las cantidades de aplicación ascendieron siempre a 3 kg de sustancia activa por hectárea, en dispersión en 500 litros de agua por hectárea.

10. Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas I y II, de buena selectividad frente a *Zea mays*, producen un efecto herbicida más fuerte en las malas hierbas mono y dicotiledóneas que los compuestos de comparación III y VII.

15. El resultado se indica en la tabla que sigue:

		Substancia activa			
		I	II	III	VII
	Sea mays (maíz)	0	0	0	0
20.	<i>Triticum aestivum</i> (trigo)	0	0	10	30
	<i>Echinochloa crus galli</i> (especie de mijo común)	95	80	65	70
	<i>Setaria</i> spp. (especie de setaria) (esp. de mijo setiforme)	80	70	55	50
	<i>Panicum</i> spp. (especie de mijo panicular)	85	75	60	50
25.	<i>Matricaria chamomilla</i> (camomila)	90	80	60	70

0 = Sin daño

100 = Destrucción total

30. Mostraron una eficacia biológica correspondiente a I y II en este experimento los compuestos:



N-i-propil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,  
N-isobutil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico.

Ejemplo 5:

5. Después de llenar arena arcillosa en tiestos de experimento se sembraron semillas de zea mays (maíz), soja hispida (soja), gossypium hirsutum (algodón), beta vulgaris (remolacha), echinocloa crus galli (especie de mijo común), setaria spp. (especie de mijo setiforme), poa trivialis (espiguilla común), bromus tectorum (bromo) y alopecurus myosuroides (alopeuro).

10. El suelo así preparado se trató a continuación con las sustancias activas N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-etil sulfonilglicólico (IV), N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico (V) y con las sustancias activas comparativas N-isopropil- $\alpha$ -cloroacet-anilida (VI) y N-butin-1-il-3- $\alpha$ -cloro.-acet-anilida (VII), siempre con cantidades de aplicación de 2 kg de sustancia activa por hectárea, en dispersión en 500 litros de agua por hectárea.

15. Al cabo de 4 a 5 semanas las sustancias activas IV y V mostraban, con una compatibilidad igual de buena con las plantas de cultivo, un efecto herbicida más fuerte que las sustancias activas VI y VII.

20. El resultado de este experimento se indica en la tabla que sigue:

	Sustancia activa			
	IV	V	VI	VII
25. Sea mays (maíz)	0	0	0	0
Soja hispida (soja)	0	0	0	10
Gossypium hirsutum (algodón)	0	0	0	0
Beta vulgaris (remolacha)	0	0	0	10
Echinocloa crus galli	100	100	70	95
Setaria spp.	100	100	70	85
Poa trivialis	95	95	40	65
Bromus tectorum	95	95	40	45
30. Alopecurus myosuroides	100	70	50	60



0 = Sin daño

100 = Destrucción total

Ejemplo 6:

5. Las plantas *Zea mays* (maíz), *Gossypium hirsutum* (algodón), *Beta vulgaris* (remolacha), *Echinochloa crus galli* (especie de mijo común), *Poa annua* (espiguilla anual), *Panicum spp.* (especie de mijo panicular) y *Avena fatua* (avena loca), de entre 3 y 15 cm de altura de crecimiento, se trataron con las sustancias activas N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-etil

10. sulfonilglicólico (IV), N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico (V), y los compuestos activos comparativos N-isopropil- $\alpha$ -cloroacet-anilida (VI) y N-butin-1-il-3-

15.  $\alpha$ -cloroacet-anilida (VII), en cada caso con cantidades de aplicación de 4 kg de sustancia activa por hectárea, dispersada en 500 litros de agua por hectárea.

Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas IV y V; de buena selectividad frente a las plantas de cultivo, producen un efecto herbicida más fuerte en las malas hierbas que los compuestos activos comparativos VI y VII.

El resultado del experimento se indica en la siguiente tabla:

	Sustancia activa			
	IV	V	VI	VII
25. <i>Zea mays</i>	0	0	5	10
<i>Gossypium hirsutum</i>	0	0	25	25
<i>Beta vulgaris</i>	10	0	20	30
<i>Echinochloa crus galli</i>	90	85	70	80
<i>Poa annua</i>	90	90	30	60
<i>Panicum spp.</i>	95	90	65	70
<i>Avena fatua</i>	80	80	40	45

30. 0 = Sin daño



100 = Destrucción total.

Ejemplo 7:

5. 90 partes en peso del compuesto I se mezclan con 10 partes en peso de N-metil- $\alpha$ -pirrolidona obteniéndose así una solución apropiada para ser aplicada en forma de gotas minúsculas.

Ejemplo 8:

10. 20 partes en peso del compuesto II se disuelven en una mezcla que se compone de 80 partes en peso de xilol, 10 partes en peso del producto de adición de 3 a 10 moles de óxido de etileno a 1 mol de N-monoetanolamida de ácido oléico, 5 partes en peso de la sal cálcica del ácido dodecilbenceno-sulfónico y 5 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Vertien  
15. do y distribuyendo la solución finamente en 100.000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

Ejemplo 9:

20. 20 partes en peso del compuesto IV se disuelven en una mezcla compuesta de 40 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 20 partes en peso del producto de adición de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol y 10 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino.  
25. Vertiendo y distribuyendo finamente la solución en 100.000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

Ejemplo 10:

30. 20 partes en peso del compuesto V se disuelven en una mezcla compuesta de 25 partes en peso de ciclohexanol,



5. 65 partes en peso de una fracción de aceite mineral del punto de ebullición 210 hasta 280°C y 10 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Vertiendo y distribuyendo finamente la solución en 100.000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

Ejemplo 11:

10. 20 partes en peso de la sustancia activa I se mezclan bien con 3 partes en peso de la sal sódica del ácido disobutilnaftalin- $\alpha$ -sulfónico, 17 partes en peso de la sal sódica de un ácido ligninosulfónico de una lejía residual sulfúrica y 60 partes en peso de silicagel pulverulento y se moliduran en un molino de martillos. Distribuyendo finamente la mezcla en 20.000 partes en peso de agua se obtiene un caldo pulverizable que contiene un 0,1 por ciento en peso de la sustancia activa.

15.

Ejemplo 12:

20. 3 partes en peso del compuesto II se mezclan íntimamente con 97 partes en peso de caolín finamente particulado. Se obtiene de esta manera un agente de espolvoreo que contiene un 3 por ciento en peso de la sustancia activa.

Ejemplo 13:

25. 30 partes en peso del compuesto IV se mezclan íntimamente con una mezcla de 92 partes en peso de silicagel pulverulento y 8 partes en peso de aceite de parafina pulverizado sobre la superficie de dicho silicagel. De esta manera se obtiene una preparación de la sustancia activa con buena adherencia.



Ejemplo 14:

En el invernadero se llenó arena arcillosa en tientos experimentales y se sembraron semillas de maíz (*zea mays*), algodón (*gossypium hirsutum*), guisantes de soja (*glycine (soja) hispida*), remolachas (*beta vulgaris*), col (*brassica oleracea*), especie de mijo común (*echinochloa crus galli*), almorajo grande (*setaria faberii*), alopecuro (*alopecurus myosuroides*) y eleusina índica (*eleusine indica*). A continuación, la tierra así preparada se trató en cada caso con 1 y 2 kg/Ha de substancia activa de los compuestos activos

I N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico,  
 II N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico,

III N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-fenilsulfonilglicólico,

IV N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-p-metilfenilsulfonilglicólico, y a título de comparación, con

V N-metilanilida de ácido O-metilsulfonilglicólico, siempre en emulsión en 500 litros de agua por hectárea.

Al cabo de 4 a 5 semanas las substancias activas I hasta IV mostraron un efecto herbicida más fuerte que la substancia activa V, siendo igual de buena la compatibilidad de los compuestos con las plantas de cultivo.

El resultado del experimento se indica en la tabla que sigue:

Substancia activa kg/Ha	I		II		III	
	1	2	1	2	1	2
Zea mays (maíz)	0	0	0	0	0	0
Gossypium hirsutum	0	0	0	0	0	0
Soja (Glycine) hispida	0	0	0	0	0	0
Beta vulgaris	0	0	0	0	0	0
Brassica olearacea	0	0	0	0	0	0



Substancia activa kg/Ha	I		II		III	
	1	2	1	2	1	2
Echinochloa crus galli	90-100	100	100	100	90	90-100
Setaria faberii	90-100	100	100	100	90	90-100
5. Alopecurus myosuroides	80	90	90	100	60-70	80
Eleusine indica	90-100	100	90-100	100	90	90-100
0 = Sin daño						
100 = Destrucción total						
10. Substancia activa kg/Ha	IV		V			
	1	2	1	2		
Zea mays	0	0	0	0		
Gossypium hirsutum	0	0	0	0		
Soja (Glycine) hispida	0	0	0	0		
15. Beta vulgaris	0	0	0	0		
Brassica olearacea	0	0	0	0		
Echinochloa crus galli	90-100	100	70-80	90		
Setaria faberii	90-100	100	70	80-90		
Alopecurus myosuroides	80-90	90-100	50-60	70-80		
20. Eleusine indica	90-100	100	70-80	80-90		
0 = Sin daño						
100 = Destrucción total						
<u>Ejemplo 15:</u>						
25.	En el invernadero se trataron las plantas maíz (Zea mays), guisantes de soja (Glycine (soja) hispida), algodón (Gossypium hirsutum), remolachas (beta vulgaris), arroz (Oryza sativa), trigo (Triticum aestivum), cebada (Hordeum vulgare), eleusina indica (Eleusine indica), especie de mijo común					
30.	(echinochloa crus galli), especie de setaria grande (setaria					



5. faberii), especie de mijo panicular en forma de varilla (panicum virgatum), dedalera (Digitaria sanguinalis), alopecuro (Alopecurus myosuroides) y espiguilla anual (poa annua), de entre 7 y 15 cm de altura de crecimiento de las plantas de cultivo y entre 2 y 10 cm de altura de las malas hierbas mono y dicotiledóneas, en cada caso con 1 kg/Ha de sustancia activa de los compuestos activos

I N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico  
 II N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-n-butilsulfonilglicólico y, a título de comparación, con  
 10. III N-metil-anilida de ácido O-metilsulfonilglicólico, siempre en emulsión en 500 litros de agua por hectárea. Al cabo de 3-4 semanas, las sustancias activas I y II mostraron un efecto herbicida más fuerte que la sustancia activa III, siendo igual de buena la compatibilidad con las plantas de cultivo.  
 15.

El resultado del experimento se indica en la tabla que sigue:

		Sustancia activa		
		I	II	III
20.	Zea mays	0-10	0-10	10
	Glycine (Soja) hispida	0	0	5
	Gossypium hirsutum	0	0	0
	Beta vulgaris	0	0	0
25.	Oryza sativa	0-10	0-10	0-10
	Triticum aestivum	0-10	0-10	0-10
	Hordeum vulgare	0-10	0-10	0-10
	Eleusine indica	90-100	90-100	60-70
30.	Echinochloa crus galli	90-100	100	40-50



	Substancia activa		
	I	II	III
Setaria faberii	90-100	100	60
Panicum virgatum	90-100	100	60
5. Digitaria sanguinalis	90-100	90-100	60-70
Alopecurus myosuroides	90-100	100	60-70
Poa annua	100	100	70-80
0 = Sin daño			
100 = Destrucción total			

10.

Tienen una eficacia biológica correspondiente a la de las substancias activas I y II los compuestos:  
 N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-fenilsulfonilglicólico y  
 N-butin-1-il-3-anilida de ácido O-p-metilfenilsulfoniglicólico.

15.

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 una Solicitud de Patente, presentada en Alemania, con fecha 6 de Diciembre de 1971, bajo el número P 21 60 380.5; 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, sobre: PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR ANILIDAS SULFONILGLICOLICAS N-SUBSTITUIDAS; caracterizándose por lo siguiente:

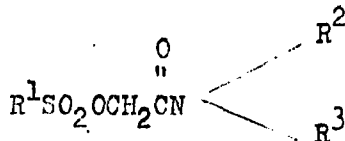
25.

30.

1.- Procedimiento para preparar anilidas sulfonilglicólicas n-substituidas anilidas sulfonilglicólicas N-substituidas



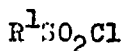
das, de fórmula



5. en la que R<sup>1</sup> significa un radical alquilo, cicloalquilo, alquilo halogenado, aralquilo, alqueno o alqueno halogenado o un radical fenilo en caso dado substituido por alquilo, alquilo halogenado, alcoxi, halógeno o el grupo nitro, R<sup>2</sup> representa un radical fenilo en caso dado substituido por alquilo y
10. R<sup>3</sup> significa un radical alquilo con más de dos átomos de carbono, un radical cicloalquilo, un radical alqueno o un radical alquino, caracterizado porque se hace reaccionar una anilida de ácido glicólico substituida de fórmula:



en la que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se definen como anteriormente con un cloruro de sulfonilo substituido de fórmula:



20. en la que R<sup>1</sup> se define como anteriormente, en presencia de un aceptor de ácidos.

2.- Procedimiento para preparar anilidas sulfonilglicólicas N-substituidas, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

25. Esta Memoria consta de 19 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 16 MAYO 1975

BADISCHE ANILIN- & SODA-FABRIK  
AKTIENGESELLSCHAFT.-

L. GÓMEZ ASEBÚ Y RUBÉN  
p. p. Firmados L. Gómez ASEBÚ y RUBÉN

