



411733

411733

PATENTE DE INVENCION

Le A 14 205-Sp.

F. E. 18-12-75

COFD//AOJY

Memoria Descriptiva

sobre:

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE COMPOSICIONES
HERBICIDAS.

Solicitante: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana, residente
en Leverkusen-Bayerwerk, República Federal Alemana.

La presente invención se refiere a un procedimiento para preparar composiciones herbicidas a base de nuevos 1-aminouracilos y sus sales.

Ya se ha dado a conocer que uracilos sustituidos en la posición N-3 pueden ser utilizados para

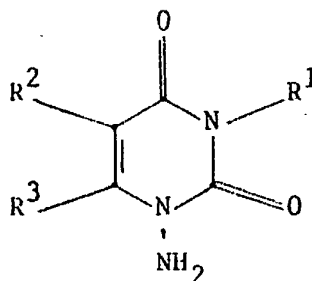
5.



5. combatir químicamente malezas (compárese: Patente francesa No. 1.461.796 y Patente norteamericana No. 3.397.050). Particularmente el 3-sec-butil-5-bromo-6-metiluracilo adquirió gran importancia como agente de eficacia herbicida. Su eficacia es, también a concentraciones bajas, tan amplia que el mismo es aplicado principalmente como herbicida total.

10. Además, es conocido que el 3-ciclohexil-5,6-trimetilenuracilo es eficaz como herbicida (compárese: Patentes norteamericanas Nos. 3.466.280 y 3.406.023 y la Patente alemana publicada no examinada No. 1.567.037). Su eficacia, sin embargo, particularmente a bajas cantidades y concentraciones de aplicación, no siempre es del todo satisfactoria.

15. Ahora se ha encontrado que tienen muy buenas propiedades herbicidas los 1-aminouracilos de la fórmula



(I)

20. en la cual representan R¹ alquilo, alquenoilo, alquinilo, cicloalquilo, alquilocicloalquilo, halogenocicloalquilo, terpenilo, halogenoalquilo, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, alcoxycarbonilo, alquiltiocarbonilo, alquilocarbonilo, alcoxialquilocarbonilo, aroxialquilocarbonilo, alquiltioalquilo, arilsulfonilo, aralquilo eventualmente substituido en la parte arilo, arilocarbonilo,

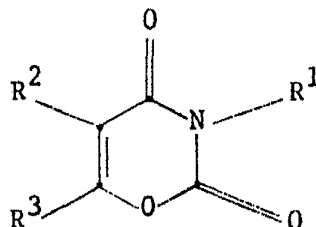


5. fenoxicarbonilo y feniltiocarbonilo eventualmente sustituidos, arilo eventualmente sustituido o un heterociclo eventualmente sustituido, R² hidrógeno, halógeno, el radical tiocianato, alquilo o arilo eventualmente sustituido, R³ alquilo o aralquilo eventualmente sustituido en la parte arilo, además, R² y R³ conjuntamente representan un puente de metileno de varios miembros que con los dos átomos de carbono en las posiciones 5 y 6 del heterociclo forman un anillo condensado que eventualmente está sustituido por alquilo, y sus sales.
- 10.

Además, se ha encontrado que se obtienen los 1-aminouracilos de la fórmula (I), respectivamente sus sales, de tal manera que

(a) 2,3-dihidro-1,3-oxacin-2,4-dionas de la fórmula

15.

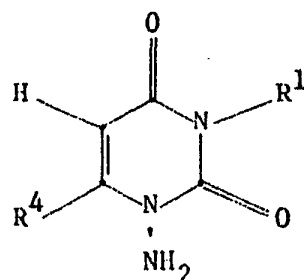


(II)

en la cual R¹, R² y R³ tienen los significados arriba definidos, se hacen reaccionar con hidracina, eventualmente en presencia de un diluyente, a temperaturas entre -30° C y + 100° C (variante de procedimiento a) o

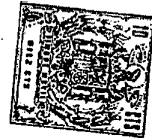
20.

(b) 1-aminouracilos de la fórmula



(IA)

411733



en la cual R¹ tiene el significado arriba indicado y R⁴ representa alquilo o aralquilo eventualmente substituido en la parte arilo, se hacen reaccionar con halógeno, particularmente bromo, o pseudohalógeno, particularmente disulfocianogeno, eventualmente en presencia de un agente ligador de ácidos y eventualmente en presencia de un disolvente o diluyente a temperaturas entre 0° C y 50° C (variante de procedimiento b), y de los compuestos obtenidos por estos dos procedimientos de la fórmula (I) eventualmente se preparan las sales según métodos usuales.

5.

10.

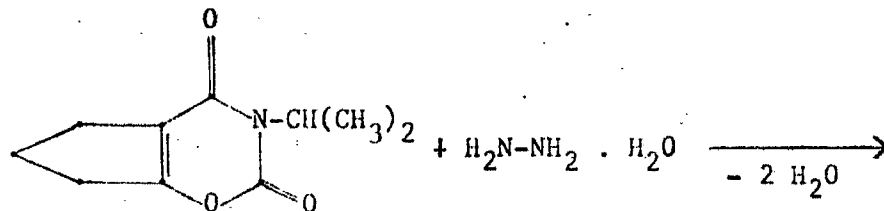
Sorprendentemente, los 1-aminouracilos según la invención muestran a una potencia herbicida igualmente buena, una eficacia herbicida selectiva considerablemente mejor que el conocido 3-sec-butil-5-bromo-6-metiluracil y una potencia herbicida mayor que el 3-ciclohexil-5,6-trimetil-uracilo, que son las sustancias químicamente mas parecidas de igual orientación de efecto. Por consiguiente, las sustancias según el invento representan un enriquecimiento de la técnica.

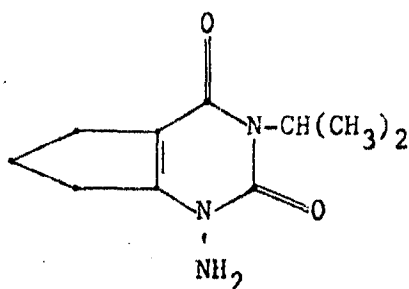
15.

20.

Si se emplean 3-isopropil-2,3,4,5,6,7-hexahidrociclopenta [e]-1,3-oxacin-2,4-diona e hidrato de hidracina, como sustancias de partida, el desarrollo de la reacción (variante de procedimiento a) puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:

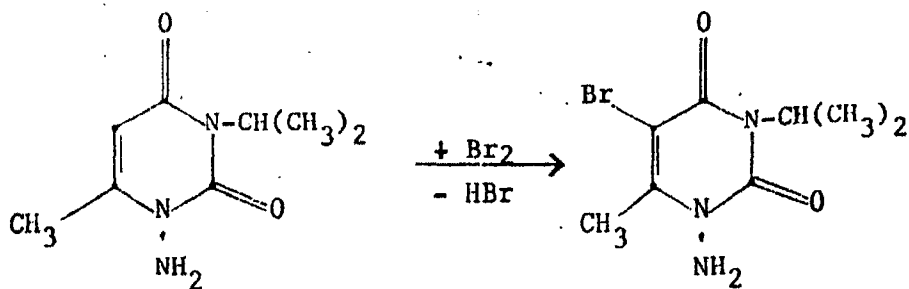
25.





5.

Si, como sustancias de partida, se aplican 1-amino-3-isopropil-6-metil-uracilo y bromo, el desarrollo de la reacción (variante de procedimiento b) puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



10.

Las 2,3-dihidro-1,3-oxacindionas-(2,4) empleadas como sustancias de partida en la variante de procedimiento (a), están definidas en forma general por la fórmula (II). En esta fórmula, R¹ representa preferiblemente alquilo lineal o ramificado con 1 a 13 átomos de carbono, alqueno lineal o ramificado con 3 a 6 átomos de carbono, alquino lineal o ramificado con 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 5 a 8 átomos de carbono eventualmente substituido por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono o halógeno, particularmente cloro, especialmente norbornil-(2)-metilo; halogenoalquilo con 2 a 6 átomos de carbono y 1 a 3 átomos de halógeno, particularmente fluor o cloro; cianoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, parti-

15.



5. particularmente con 2 a 4 átomos de carbono; alcoxialquilo y alcoxycarbonilalquilo cada uno con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo y con 1 ó 3 átomos de carbono en la parte alcoxi; alquylcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquiltiocarbonilo, alcoxialquylcarbonilo cada uno con 2 a 6 átomos de carbono en la parte alquilo y con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alcoxi; alquiltioalquyl con 2 a 6 átomos de carbono en la parte alquilo y con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquiltio. Además, R^1 representa aroxialquylcarbonilo con preferiblemente 6 a 10 átomos de carbono en la parte arilo y con 1 a 2 átomos de carbono en la parte alquilo.
10. Además, R^1 representa preferiblemente arilo eventualmente substituido, aralquilo, arilcarbonilo y arilsulfonilo, cada uno con 6 a 10 átomos de carbono en la parte arilo y con 1 a 2 átomos de carbono en la parte alquilo; además, fenoxycarbonilo y feniltiocarbonilo eventualmente substituido en el núcleo fenílico.
15. Además, R^1 representa preferiblemente un radical heterocíclico eventualmente substituido de 5 a 7 miembros con 1 a 3 heteroátomos.
20. Como substituyentes de la parte arilo o del heterociclo, de preferencia, sean mencionados: alquilo lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono, halogenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono y 1 a 3 átomos de halógeno, particularmente fluor o cloro; alcoxi y alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, dialquylamino con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo lineal o ramificado; nitro, ciano, halógeno, particularmente fluor, cloro o bromo; halogenoalquiltio y halogenoalcoxi con 1 a 2 átomos.
- 25.
- 30.



mos de carbono y 3 a 5 átomos de halógeno, particularmente fluor o cloro; alcóxicarbonilalqueno con 2 a 3 átomos de carbono en la parte alqueno y con 1 a 3 átomos de carbono en la parte alquilo.

5. El radical arilo, particularmente el resto fenilo y el resto heterocíclico, pueden estar substituidos una o varias veces.

10. En la fórmula (II), R^2 representa preferiblemente hidrógeno, halógeno, particularmente cloro o bromo, alquilo lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono, el radical tiocianato, fenilo eventualmente substituido por los substituyentes arriba mencionados.

15. R^3 representa preferiblemente alquilo lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono o fenilalquilo con 1 a 3 átomos de carbono en la parte alquilo.

20. Sin embargo, R^2 y R^3 conjuntamente pueden representar preferiblemente también un puente de metileno lineal o ramificado de 3 a 5 miembros que con los dos átomos vecinos de carbono forma un anillo de 5 ó 7 miembros que eventualmente está substituido por alquilo con 1 a 3 átomos de carbono.

Como ejemplos de las 2,3-dihidro-1,3-oxacindionas-(2,4), aplicables según el invento, en detalle sean mencionadas:

25. 3- α -naftil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(norbornil-2)-metil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
2-fenil-5-cloro-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3,6-dimetil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
30. 3-(2-metilciclohexil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindio-



- na-(2,4),
3-(3-metilciclohexil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindio-
na-(2,4);
5. 3-(3,3,5-trimetilciclohexil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxa-
cindiona-(2,4),
3-ciclohexil-5-metil-6-etil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-
(2,4),
3-ciclohexil-5-etil-6-propil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-
(2,4),
10. 3-ciclohexil-5-metil-6-isopropil-2,3-dihidro-1,3-oxacin-
diona-(2,4),
3-(3,4-diclorofenil)-5-metil-6-etil-2,3-dihidro-1,3-oxa-
cindiona-(2,4),
3-bencil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
15. 3-(3-clorofenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4-clorofenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4-trifluormetil-fenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacin-
diona-(2,4),
3-(3-difluormetil-fenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacin-
diona-(2,4),
20. 3-(2,6-diisopropil-fenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacin-
diona-(2,4),
3-(4-metoxifenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-benzoil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
25. 3-ciclohexil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-isopropil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-n-butil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(butil-2)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(pentil-3)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
30. 3-(4-metilpentil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),

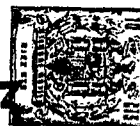


- 3-(6-cloro-n-hexil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(2-clorociclohexil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
5. 3-(2-cloroetil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-etoxicarbonilmetil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4-metilfenilsulfonil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
10. 3-(3-cloro-4-trifluormetil-fenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4-cloro-3-trifluormetil-fenil)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-fenil-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
15. 3-(2,3,4,5-tetracloropiridinil-6)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4,5,6-tricloropirimidinil-2)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4,5-dicloro-2-triclorometil-pirimidinil-6)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
20. 3-(2,4-bis-triclorometil)-1,3,5-triacinil-6)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(2,4-dicloro-1,3,5-triacinil-6)-6-metil-2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4),
25. 3-fenil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(4-clorofenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
3-(3-clorofenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 30.

411733



- 3-(4-clorofenil)-7,7-dimetil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(4-clorofenil)-5,7,7-trimetil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 5. 3-(3,4-diclorofenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(4-trifluormetilfenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 10. 3-(2-etilfenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(3-metilfenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(2,6-dietil-4-metilfenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 15. 3-(4-metoxifenil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(β-feniletil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-n-butil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 20. 3-metil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-etil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 25. 3-ciclohexil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(2-metilciclohexil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 2-(3-metilciclohexil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 30. 1,3-oxacindiona-(2,4),

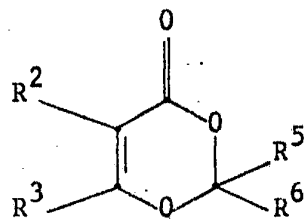


- 3-(4-metilciclohexil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-isobutil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 5. 3-ter-butil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-(6-clorociclohexil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 10. 3-ciclohexilmetil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-metoximetil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-alil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 15. 3-propil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 3-isopropil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),
- 20. 3-(3,5,5-trimetilciclohexil)-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4),

Las 2,3-dihidro-1,3-oxacindionas-(2,4) de la fórmula (II) aplicadas como sustancias de partida, son en parte conocidas (compárese: J. Chem. Soc. 1954 (Londres), 845-849). En parte constituyen objeto de una solicitud de patente separada (compárese: Patente alemana Acta P 19 60 818.5 (Le A 12 691)). Pueden ser preparadas de tal manera que 1,3-dioxinonas-(4) de la fórmula general

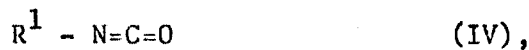
25.

411733



(III)

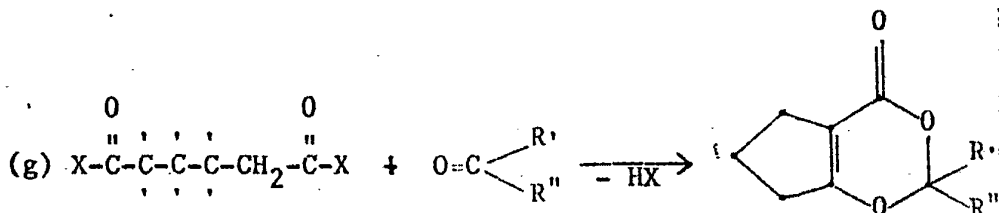
5. en la cual R^2 y R^3 tienen los significados indicados con referencia a la fórmula (I), R^5 representa hidrógeno o alquilo y R^6 alquilo o arilo, se hacen reaccionar con isocianatos de la fórmula general

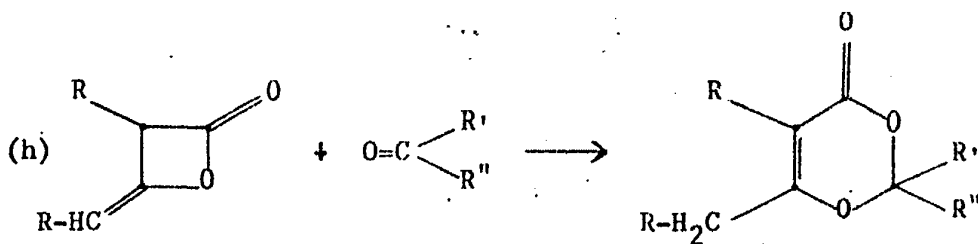


10. en la cual R^1 tiene el significado indicado con referencia a la fórmula (I), eventualmente en presencia de disolventes orgánicos inertes a temperaturas entre aproximadamente $+ 80^\circ$ y $+ 200^\circ$ C (compárese: Ejemplos de preparación y tabla).

15. Las 1,3-dioxinonas-(4) de la fórmula (III) necesarias para esta reacción, pueden ser obtenidas ya sea por reacción de dihalogenuros de ácido adípico con compuestos de carbonilo según (g) (compárese: Patente alemana Acta P 19 57 312.7 (Le A 12 563)) o sea por reacción de diceteno o dicetenos substituidos con cetonas en presencia de cantidades catalíticas de ácido p-toluensulfónico (h) (compárese: Journal of the American Chemical Society 74, 6305 (1952)) :

20.





5. Los 1-aminouracilos de la fórmula (IA) empleados como sustancias de partida para la variante de procedimiento (b), pueden ser obtenidos según el procedimiento (a).

10. Como diluyentes en el procedimiento según la invención (variante de procedimiento a), entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen hidrocarburos, tales como decahidronaftaleno (Decalin), tetrahidronaftaleno (Tetralin), tolueno; alcoholes, tales como etanol, isopropanol o metanol; amidas de ácido, tales como dimetilformamida.

15. De preferencia, se emplean amoníaco líquido, aminas, por ejemplo trietilamina, o piridina o mezclas de los disolventes arriba mencionados con amoníaco o aminas.

Las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un margen amplio, Por lo general, se trabaja a temperaturas entre -30° y $+100^{\circ}$ C, preferiblemente entre -30° y $+30^{\circ}$ C.

20. Por lo general, la reacción es llevada a cabo a la presión normal; sin embargo, puede ser realizada también con buen resultado a una presión de 1 a 10 atmósferas de sobrepresión.

25. En la realización del procedimiento según la invención, por mol de 2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4) de la fórmula (II), se aplican 1 a 10 moles de hidrato de



5. hidracina, preferiblemente 1 a 5 moles, agregándose la 2,3-dihidro-1,3-oxacindiona-(2,4) de la fórmula (II), ya sea en substancia o sea disuelta en uno de los precitados disolventes, al hidrato de hidracina o a una solución de hidrato de hidracina y agitándose durante unas horas. Para la elaboración, eventualmente se elimina por destilación el disolvente en exceso hasta aproximadamente la mitad, se aísla por filtración el precipitado formado y se lo purifica por recristalización.

10. En el procedimiento según la invención (variante de procedimiento b), como diluyentes entran en consideración todos los disolventes orgánicos polares. A estos pertenecen preferiblemente alcoholes, tales como metanol, etanol, butanol; éteres, tales como dioxano y tetrahidrofurano; nitrilos, tales como tolunitrilo y acetónitrilo; hidrocarburos clorados, tales como cloroformo y cloruro de metilo; ácidos orgánicos, tales como ácido acético glacial.

15. La reacción según el invento es llevada a cabo con la ayuda de un agente ligador de ácidos. Como agentes ligadores de ácidos entran en consideración: hidróxidos de metales alcalinotérreos, tales como hidróxido de calcio; hidróxidos alcalinos, tales como hidróxido de potasio; carbonatos alcalinos, tales como carbonato de sodio; acetatos alcalinos, tales como acetato de sodio.

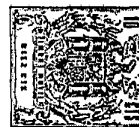
20. Las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un margen amplio. Por lo general, se trabaja a temperaturas entre 0° y + 100° C, preferiblemente entre + 10° y + 50° C.

25. En la realización del procedimiento según la

30.



5. invención, por mol de 1-aminouracilo de la fórmula (IA) se aplican aproximadamente 1 mol de halógeno y aproximadamente 1 a 1,5 moles de agente ligador de ácidos, agregándose gota a gota una solución del halógeno o delseudohalógeno que en el último caso es preparada in situ, a la solución del uracilo. Para aislar los compuestos de la fórmula (IA), la mayor parte del disolvente es eliminado por destilación, el precipitado formado es aislado por filtración y es purificado por recristalización.
10. Los nuevos 1-aminouracilos según la invención y sus sales tienen propiedades herbicidas y, por ello, pueden encontrar aplicación para combatir malezas.
15. Bajo malezas en el sentido mas amplio se entienden todas las plantas que crecen en lugares donde no son deseadas. La cuestión de que las sustancias activas actúan como herbicidas totales o selectivos, depende de la magnitud de la cantidad de sustancia activa aplicada.
20. Las sustancias según el invento pueden ser aplicadas, por ejemplo en el caso de las siguientes plantas: Dicotiledóneas, tales como mostaza (*Sinapis*), berro (*Lepidium*), amor de hortelano (*Galium*), pamplina (*Stellaria*), camomila (*Matricaria*), escabiosa (*Galinsoga*), pata de ganso (*Chenopodium*), ortiga (*Urtica*), zuzón (*Senecio*), algodón (*Gossypium*), remolacha (*Beta*), zanahoria (*Daucus*),
25. habichuelas (*Phaseolus*), patata (*Solanum*), café (*Coffea*); monocotiledóneas, tales como fleo (*Phleum*), púa (*Poa*), cañuela (*Festuca*), eleusina (*Eleusine*), carricera (*Setaria*), cizaña (*Lolium*), bromo (*Bromus*), ranúnculo (*Echinochloa*), maiz (*Zea*), arroz (*Oryza*), avena (*Avena*), cebada (*Hordeum*),
30. trigo (*Triticum*), mijo (*Panicum*), caña de azúcar (*Saccha-*



rum).

411733

- Las sustancias activas según el invento pueden ser elaboradas en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. Estas formulaciones son producidas en forma conocida, por ejemplo por mezclamiento de las sustancias activas con diluyentes, vale decir, disolventes líquidos, gases licuados puestos bajo presión y/o sustancias sólidas de vehículo, eventualmente con el empleo de agentes tensioactivos, vale decir, emulsivos y/o agentes dispersantes. En el caso de la utilización del agua como diluyente, pueden emplearse por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Entran en consideración esencialmente, como disolventes líquidos: hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno, benceno o alquilnaftalinas, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano; parafinas, por ejemplo fracciones de aceite mineral; alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres; cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutiletetona o ciclohexanona; disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua, bajo diluyentes o agentes de vehículo gaseosos licuados se entienden tales líquidos que a la temperatura normal y bajo presión normal son líquidos, por ejemplo, gases impeledores de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, por ejemplo freón, entran con consideración como sustancias sólidas de vehículo: mine-
- 5.
- 10.
- 15.
- 20.
- 25.
- 30.



5. rales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas; polvos minerales sintéticos, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como emulsivos: emulsivos no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácidos grasos, éteres de polioxietileno y ácidos grasos, por ejemplo éteres alquilarilpoliglicólicos, sulfonatos alquílicos, sulfatos alquílicos y sulfonatos arílicos; como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfito, metilcelulosa.
- 10.

Las sustancias activas pueden estar presentes en las formulaciones en mezcla con otras sustancias activas conocidas.

15. Las formulaciones contienen generalmente entre 0,1 y 95, preferiblemente entre 0,5 y 90 % en peso de sustancia activa.

20. Las sustancias activas pueden ser aplicadas como tales, como sus formulaciones o como formas de aplicación preparadas de las últimas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados en estado listo para el uso. La aplicación es efectuada en forma usual, por ejemplo por riego, rociada, nebulización esparcimiento, espolvoreo.

25. La cantidad de sustancia activa aplicada puede variar dentro de límites amplios. Depende esencialmente de la clase del efecto deseado. Por lo general, las cantidades de aplicación están entre 0,1 y 20 kg, preferiblemente entre 0,2 y 15 kg de sustancia activa por hectárea.
- 30.

411733



Ejemplo A

Ensayo de post-brotadura.

Disolvente: 5 partes en peso de acetona.

Emulsivo: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico.

5. Para la producción de una preparación adecuada de substancia activa, se mezcla 1 parte en peso de substancia activa con la cantidad indicada del disolvente, se agrega la cantidad indicada del emulsivo y subsiguientemente se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.
- 10.

La preparación de substancia activa es rociada sobre plantas de ensayo de una altura de 5 a 15 cm, de tal modo que son aplicadas las cantidades de substancia activa por unidad de superficie indicadas en la tabla. Según la concentración del líquido de rociada, la cantidad de agua aplicada es de entre 1000 y 2000 litros/ha. Al cabo de tres semanas, se determina el grado de daño sufrido por las plantas y se lo clasifica con los índices de 0 a 5 que tienen los significados siguientes:

20. 0 ningún efecto
- 1 manchas individuales de ligera quemadura
- 2 daños manifiestos en las hojas
- 3 hojas individuales y partes de tallo parcialmente muertas
25. 4 planta parcialmente destruida
- 5 planta totalmente muerta.

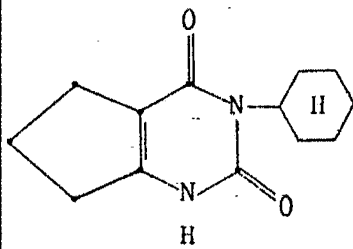
Las substancias activas, las cantidades de aplicación y los resultados se encuentran indicados en la siguiente tabla:



T A B L A A

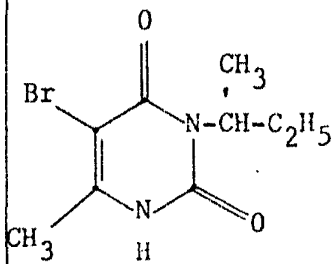
Ensayo de post-brotadura

Substancia activa	Cantidad de aplicación de substancia activa kg/ha	Echinochloa	Chenopodium	Sinapis
-------------------	---	-------------	-------------	---------



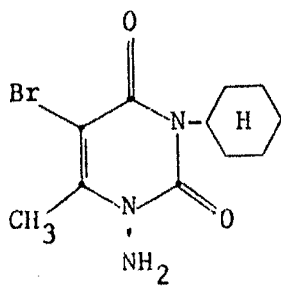
(conocido)

2	5	1	5
1	5	0	5

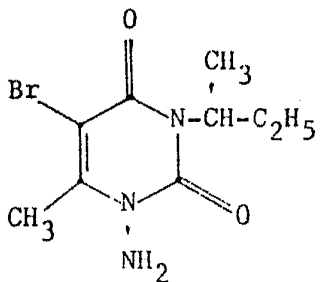


(conocido)

2	5	5	5
1	5	5	5



2	5	5	5
1	5	5	5



2	5	5	5
1	5	5	5



EJEMPLO B

Ensayo de pre-brotadura

Disolvente: 5 partes en peso de acetona.

Emulsivo: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico.

5.

Para la producción de una preparación adecuada de substancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la substancia activa con la cantidad indicada del disolvente, se agrega la cantidad indicada del emulsivo y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

10.

Semillas de las plantas de ensayo son sembradas en una tierra normal y, al cabo de 24 horas, son regadas con la preparación de substancia activa, manteniéndose convenientemente constante la cantidad de agua por unidad de superficie. La concentración de la substancia activa en la preparación no es de importancia, decisiva es tan solo la cantidad de aplicación de la substancia activa por unidad de superficie. Al cabo de tres semanas, se determina el grado de daño sufrido por las plantas de ensayo y se lo clasifica con los índices de 0 a 5, que tienen los siguientes significados:

15.

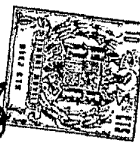
20.

- 0 ningún efecto
- 1 leves daños o retraso del crecimiento
- 2 daños manifiestos o inhibición del crecimiento
- 3 daños graves y desarrollo tan solo deficiente o brotadura de un 50 % de las plantas solamente
- 4 plantas parcialmente destruidas después de la germinación o brotadura de un 25 % de las plantas solamente
- 5 plantas totalmente muertas o sin brotadura.

25.

30.

Las substancias activas, las cantidades de



aplicación y los resultados se encuentran indicados en la siguiente tabla:

T A B L A B

Ensayo de pre-brotadura

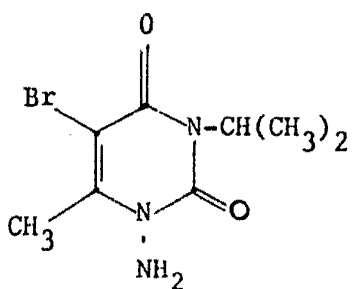
Substancia activa	Cantidad de aplicación de substancia activa kg/ha	Echinochloa	Chenopodium	Sinapis
<chem>CC1=C(Br)C(=O)N(C1)CC</chem>	5	5	5	5
	2,5	5	5	5
	1,25	5	5	5
(conocido)				
<chem>CC1=C(Br)C(=O)N(C1)C2CCCCC2</chem>	5	5	5	5
	2,5	4	5	5
	1,25	3	4	5
<chem>CC1=C(Br)C(=O)N(C1)CCN</chem>	5	5	5	5
	2,5	5	5	5
	1,25	5	5	5
<chem>CC1=C(Br)C(=O)N(C1)CCCN</chem>	5	5	5	5
	2,5	4	5	4
	1,25	4	4	4



T A B L A B (Continuación)

Ensayo de pre-brotadura.

Substancia activa	Cantidad de aplicación de substancia activa kg/ha	Echinochloa	Chenopodium	Sinapis
-------------------	---	-------------	-------------	---------



5	5	5	4
2,5	5	5	4
1,25	5	5	3

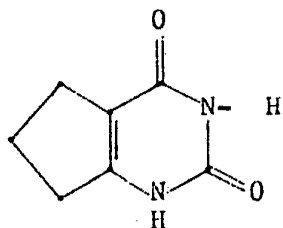
Stellaria	Lolium	Galinsoga	Matricaria	Algodón	Trigo	Maiz
5	5	5	5	5	5	5
5	5	5	5	4-5	5	4
5	4-5	5	5	4	5	4
5	4	5	5	2	1	0
5	4	5	5	1	0	0
5	3	5	5	0	0	0
5	5	5	5	2	0	2
4-5	4-5	5	5	1	0	0
4	4	5	5	0	0	0
5	5	5	5	1	1	0
4	4	5	5	0	0	0
4	4	5	5	0	0	0
5	5	5	5	2	2	1
5	4	5	5	1	1	0
4	4	5	5	0	0	0



T A B L A C

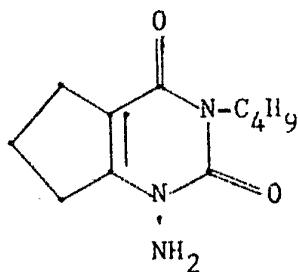
Ensayo de pre-brotadura

Substancia activa	Cantidad de aplicaci3n de substancia activa kg/ha	Echinochloa	Allopecurus	Poa
-------------------	---	-------------	-------------	-----

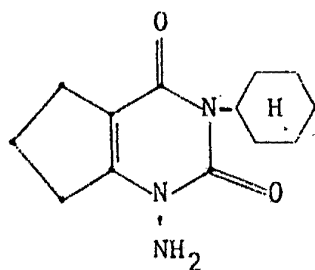


5	3	3	4
2,5	3	2	3
1,25	3	1	2

(conocido)



5	5	5	5
2,5	4	4	5
1,25	2	2	3



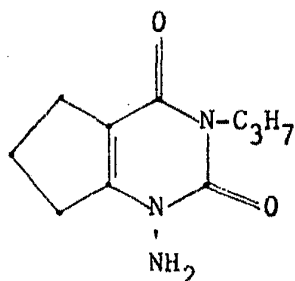
5	5	5	5
2,5	5	5	5
1,25	4	4-5	5

Galinsoga Polygonum Amaranthus Urtica Sojaborner

4-5	5	3	5	1
4	4	3	3	0
3	4	2	1	0
5	5	4	5	0
5	5	4	5	0
5	5	4	5	0
5	5	5	5	1
5	5	4-5	5	0
5	5	4	5	0



Ejemplo 1



5.

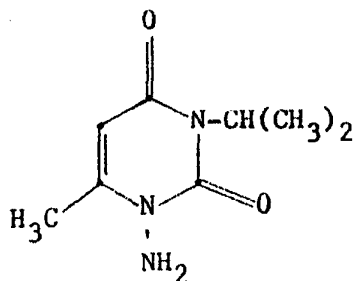
64 g. (0,34 moles) de 3-n-propil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4) son introducidos bajo agitación y enfriamiento exterior dentro de 45 minutos en 180 ml (3,4 moles) de hidrato de hidracina enfriado hasta -5° C. Terminada la adición, la mezcla de reacción es agitada lentamente hasta alcanzar la temperatura ambiente. El precipitado formado es separado por filtración, lavado bien con agua y secado en vacío sobre pentóxido de fósforo.

10.

Se obtienen 58,8 g. (93,7 % de la teoría) de 1-amino-3-n-propil-5,6-trimetilen-uracilo del P.f. = 126-127° C.

15.

Ejemplo 2



20.

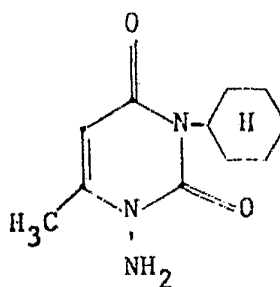
16,9 g. (0,1 mol) de 3-isopropil-6-metil-2,3-dihidro-oxacindiona-(2,4) finamente pulverizada fueron introducidos en porciones bajo agitación a una temperatura de 5 a 10° C en 30 ml (0,58 moles) de hidrato de hi-



dracina. Al cabo de un tiempo de reacción de 12 horas a 10° C, el precipitado formado es recogido por filtración a succión, lavado con agua y secado sobre pentóxido de fósforo.

5. Se obtienen 11,8 g. (86,5 % de la teoría) de 1-amino-3-isopropil-6-metil-uracil del P.f. = 119-120° C.

Ejemplo 3



10. Primeramente se prepara una suspensión de 42 g. (0,2 moles) de 3-ciclohexil-6-metil-2,3-dihidro-oxacindiona-(2,4) en 200 ml de isopropanol anhidro y en esta mezcla se introduce a una temperatura de -25° C. amoníaco gaseoso hasta la saturación. Entonces se agregan 41,7 ml (0,8 moles) de hidrato de hidracina y se agita durante 3 horas a -20° C. Subsiguientemente se deja subir la temperatura a -10° C, pasando la mezcla de reacción a una solución clara. Después de una agitación ulterior durante media hora a -10° C, se diluye la solución de reacción con tres veces su cantidad de agua y se la ajusta con ácido clorhídrico diluido a un valor pH de 3, formándose un precipitado cristalizado.
- 15.
- 20.

Por filtración se obtienen 39,8 g. (89 % de la teoría) de 1-amino-3-ciclohexilo-6-metil-uracilo del P.f. = 123-124° C.

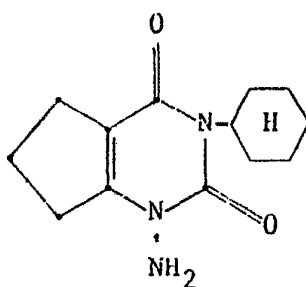


Variante de procedimiento: **411733**

5. Como arriba se prepara una suspensión de 630 g. (3 moles) de 3-ciclohexil-6-metil-2,3-dihidro-oxacindiona-(2,4) en 2,5 litros de isopropanol y a una temperatura de -20° C se agregan 31,3 ml (0,6 moles) de hidrato de hidracina. Como arriba se ha indicado se agita durante 3 horas a -20° C y durante media hora a -10° C y se elabora la mezcla de reacción correspondientemente.

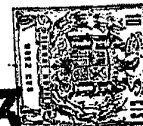
10. Se obtienen 475 g. (71 % de la teoría) de 1-amino-3-ciclohexil-6-metil-uracilo del P.f. = 123° C.

Ejemplo 4



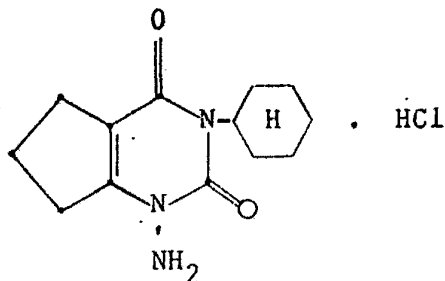
15. En una solución de 23,5 g. (0,1 mol) de 3-ciclohexil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4) en 30 ml de dimetilformamida se instila, bajo agitación a una temperatura de -2 a + 6° C, una solución de 30 ml (0,6 moles) de hidrato de hidracina en 30 ml de dimetilformamida y se agita la mezcla de reacción durante 12 horas a + 6° C. Luego, bajo agitación se agregan 800 ml de agua, se aísla por filtración el precipitado formado, se lo lava con agua y se lo seca sobre pentóxido de fósforo.

20. Se obtienen 17 g. (70 % de la teoría) de 1-amino-3-ciclohexil-5,6-trimetilen-uracilo del P.f. = 149-



150° C.

El hidrocioruro es preparado como sigue:



5.

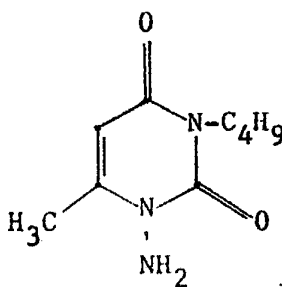
12,4 g. (0,05 moles) de 1-amino-3-ciclohexil-5,6-trimetilen-uracilo se disuelven en 100 ml de cloruro de metileno y subsiguientemente se introduce ácido clorhídrico seco a una temperatura de 0° a + 10° C, hasta que se haya formado un precipitado. Se lo deja sedimentar, se lo aísla por filtración, se lo lava con éter y se lo seca en vacío.

10.

Así se obtienen 14,3 g. de hidrocioruro de 1-amino-3-ciclohexil-5,6-trimetilen-uracilo del P.f. = 156-158° C (descomposición) con un rendimiento cuantitativo.

Ejemplo 5

15.



21 ml (0,4 moles) de hidrato de hidracina se disuelven en 100 ml de amoníaco líquido; a la temperatura de -50° C se agregan a la solución 18,4 g. (0,1 mol) de

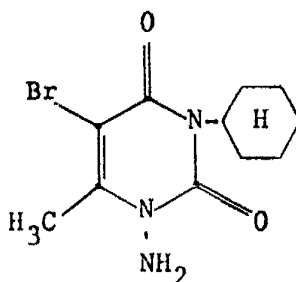
411733



5. 3-n-butyl-6-metil-2,3-dihidro-oxacindiona-(2,4) y se agita 16 horas a dicha temperatura. Luego se calienta lentamente hasta la temperatura ambiente, evaporándose el amoniaco paulatinamente. Se mezcla el residuo obtenido con agua y se ajusta con ácido clorhídrico acuoso al 10. % a un valor pH de 3. Se forma un precipitado que se aísla por filtración y se purifica por recristalización en agua bajo adición de carbón activo.

10. Se obtienen 15,8 g. (80 % de la teoría) de 1-amino-3-n-butyl-6-metil-uracilo del P.f. = 86-88° C.

Ejemplo 6



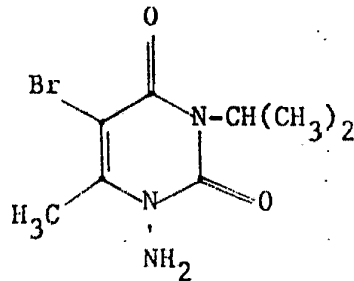
15. A una solución de 44,6 g. (0,2 moles) de 1-amino-3-ciclohexil-6-metil-uracilo en 150 ml de cloroformo se agregan 13,3 g. (0,2 moles) de acetato de sodio anhidro y en la solución a una temperatura de 10 a 15° C se instilan 33,6 g. (0,22 moles) de bromo. Luego se agita la solución de reacción fuertemente todavía durante 30 minutos, subsiguientemente se agrega agua y se agita brevemente en forma intensiva. Se separan las dos fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio, se elimina el disolvente por destilación y se recristaliza el residuo en acetonitrilo.

20. Se obtienen 49,7 g. (82 % de la teoría) de 1-



amino-5-bromo-3-ciclohexil-6-metil-uracilo del P.f. = 158° C.

Ejemplo 7

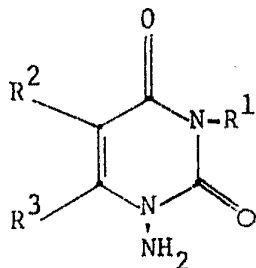


5. En una solución de 18,3 g. (0,1 mol) de 1-amino-3-isopropil-6-metil-uracilo y de 8,2 g. de acetato de sodio anhidro (0,12 moles) en 100 ml de ácido acético glacial, a una temperatura de 15 a 20° C, se instala una solución de 16 g. (0,1 mol) de bromo en 20 ml de ácido acético glacial. Al cabo de un tiempo de reacción de 15 minutos a la temperatura ambiente, se elimina la mayor parte del disolvente por destilación en vacío, se trata el residuo con agua y se aísla por filtración la sustancia sólida formada.

10. Después de la redisolución en metanol, se obtienen 19,5 g. (74,5 % de la teoría) de 1-amino-3-isopropil-5-bromo-6-metil-uracilo del P.f. = 116-118° C.


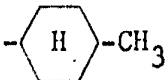
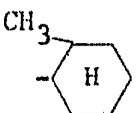
15. En forma análoga se preparan los compuestos de los ejemplos de la siguiente tabla:

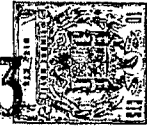
T A B L A 1



411733



Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
8	CH ₃		-(CH ₂) ₃ -	146 - 147
9	C ₂ H ₅		-(CH ₂) ₃ -	132 - 133
10	C ₂ H ₅		-(CH ₂) ₃ -	Hidrocloruro 150 - 152
11	CH(CH ₃) ₂		-(CH ₂) ₃ -	136
12	CH(CH ₃) ₂		-(CH ₂) ₃ -	Hidrocloruro 156 - 157
13	C ₄ H ₉		-(CH ₂) ₃ -	99 - 100
14	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂		-(CH ₂) ₃ -	129
15	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅		-(CH ₂) ₃ -	77 - 78
16	CH ₂ -CH=CH ₂		-(CH ₂) ₃ -	123 - 124
17	CH ₂ -OCH ₃		-(CH ₂) ₃ -	96,5 - 97,5
18	(CH ₂) ₅ -CH ₂ Cl		-(CH ₂) ₃ -	66 - 67
19		H	CH ₃	218 - 220
20		H	CH ₃	119 - 121
21	CH ₃	H	CH ₃	138 - 140
22	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	H	CH ₃	60 - 62
23	CH ₃	Br	CH ₃	172
24	C ₄ H ₉	Br	CH ₃	108 - 110
25	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	Br	CH ₃	94
26		Br	CH ₃	162 - 164



T A B L A 1 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
27		Br	CH ₃	188 - 190
28		- (CH ₂) ₃ -		194 - 195
29		- (CH ₂) ₃ -		122 - 123
30		- (CH ₂) ₃ -		155,5-156
31		- (CH ₂) ₃ -		154 - 155
32				164 - 165
33	(C ₂ H ₅) ₂ CH	H	CH ₃	76
34		H	CH ₃	70
35		Br	CH ₃	188
36		H	CH ₃	140
37		Br	CH ₃	138 - 139



T A B L A 1 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
38	-CH ₂	Br	CH ₃	154
39		H	CH ₃	136 - 137
40	-CH ₂	H	CH ₃	130
41	n-C ₇ H ₁₅	Br	CH ₃	84
42	n-C ₇ H ₁₅	H	CH ₃	78
43	-CH ₂ -CH ₂	Br	CH ₃	200 - 202
44	-CH ₂ -CH ₂	H	CH ₃	155 - 156
45		Br	CH ₃	143,5-144,5
46		H	CH ₃	106 - 107
47	ClCH ₂ CH ₂	- (CH ₂) ₃ -		130 - 131,5
48	-CH ₂	- (CH ₂) ₃ -		145,5-146,5
49	-CH ₂	- (CH ₂) ₃ -		136 - 137
50		- (CH ₂) ₃ -		127 - 128
51	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O- $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C-CH ₂	CH ₂ - (CH ₂) ₃ -		93 - 94



T A B L A 1 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
52		- (CH ₂) ₃ -		123 - 124
53		- (CH ₂) ₃ -		197 - 198
54		- (CH ₂) ₃ -		64 - 65
55	CH ₃ -(CH ₂) ₁₁ -	- (CH ₂) ₃ -		70 - 71
56		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$ mezcla: 1 : 1		65 - 67
57		$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$ mezcla: 1 : 1		113 - 115
58	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{HC}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ \text{H}_2\text{C}-\text{CH}-\text{CH}_3- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$ mezcla: 1 : 1		83 - 84



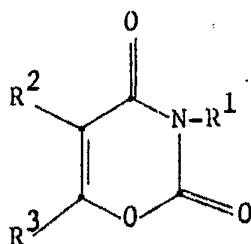
El producto de partida para el compuesto descrito en el Ejemplo 4, puede ser preparado de la siguiente manera:

- 5. En una solución calentada a 140° C de 187,8 g. (1,5 moles) de isocianato de ciclohexilo en 250 ml de xileno, en el transcurso de 90 minutos, se instila una solución de 168,2 g. (1 mol) de 2,2-dimetil-4,5,6,7-tetrahidro-ciclopenta [e]-1,3-dioxinona-(4)* en 300 ml de xileno. La acetona formada en la reacción es destilada continuamente y así es eliminada de la mezcla de reacción.
- 10. Subsiguientemente se elimina el disolvente por destilación bajo presión reducida y se destila el residuo en vacío. Se obtienen 166,3 g. (70 % de la teoría) de 3-ciclohexil-2,3,4,5,6,7-hexahidro-ciclopenta [e]-1,3-oxacindiona-(2,4) del P.e. = 164-165° C/0,5 mm, que se solidifica en forma cristalina y entonces funde a 70-71° C.
- 15.

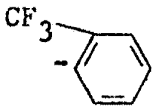
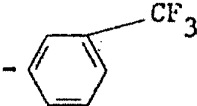
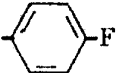
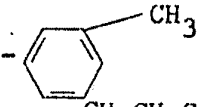
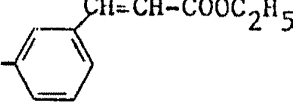
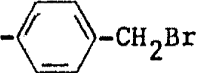
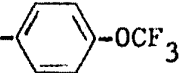
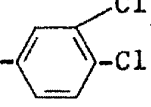
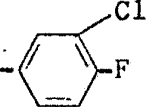
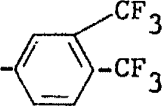
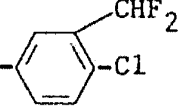
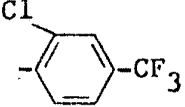
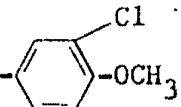
* Preparación de este compuesto, compárese Hoja 7 de la Patente alemana publicada no examinada No. 1.957.312.

- 20. En forma análoga pueden prepararse también los nuevos compuestos de partida detallados en la siguiente tabla:

T A B L A 2





Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
I		H	CH ₃	132 - 135
II		H	CH ₃	133 - 134
III		H	CH ₃	190 - 191
IV		H	CH ₃	128
V		H	CH ₃	184
VI		H	CH ₃	248
VII		H	CH ₃	188
VIII		H	CH ₃	203
IX		H	CH ₃	178 - 181
X		H	CH ₃	126 - 130
XI		H	CH ₃	161 - 163
XII		H	CH ₃	126 - 127
XIII		H	CH ₃	166 - 168



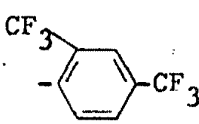
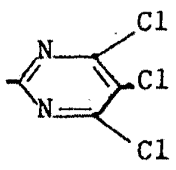
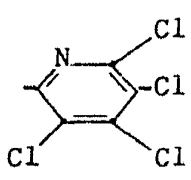
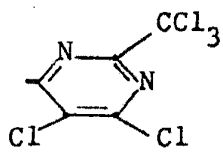
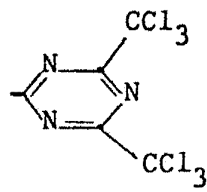
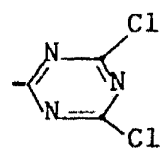
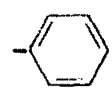
T A B L A 2 (Continuación)

Ejemplo N°	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
XIV		H	CH ₃	189
XV		H	CH ₃	181
XVI		H	CH ₃	198 - 200
XVII		H	CH ₃	152 - 153
XVIII		H	CH ₃	229 - 232
XIX		H	CH ₃	90 - 92
XX		H	CH ₃	99
XXI		H	CH ₃	76 - 78
XXII		H	CH ₃	110 - 112
XXIII		H	CH ₃	150

411733

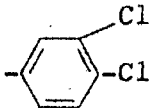


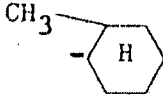
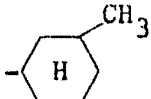


T A B L A 2 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C)
XXIV		H	CH ₃	126 - 130
XXV		H	CH ₃	198 - 200
XXVI		H	CH ₃	180
Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C) - Punto de ebullición °C/ mm Hg
XXVII		H	CH ₃	186
XXVIII		H	CH ₃	142
XXIX		H	CH ₃	117
XXX		Cl	CH ₃	208 - 210



T A B L A 2 (Continuación)

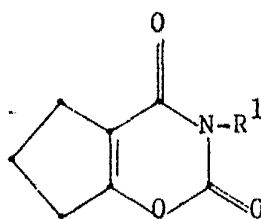
Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C) - Punto de ebullición °C/ mm Hg
XXXI		CH ₃	C ₂ H ₅	102 - 103
XXXII		CH ₃	C ₂ H ₅	134-138/0,3
XXXIII		C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	145-149/0,8
XXXIV	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	52 - 55
XXXV	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	H	CH ₃	94 - 98/0,1
XXXVI	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	92 - 94/0,2
XXXVII	CH-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	57 - 59,5
XXXVIII	CH(CH ₃)-C ₃ H ₇	H	CH ₃	90 - 92/0,3
XXXIX	CH-(C ₃ H ₇) ₂	H	CH ₃	100-102/0,2
XL	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₁₀ -CH ₃	H	CH ₃	183-188/0,05
XLI	CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	77 - 78
XLII	CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	H	CH ₃	76 - 78
XLIII		H	CH ₃	130 - 135/0,1
XLIV		H	CH ₃	58 - 60



T A B L A 2 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	R ²	R ³	Punto de fusión (°C) - Punto de ebullición °C/ mm Hg
XLV		H	CH ₃	177 - 179
XLVI		H	CH ₃	135-140/0,1
XLVII	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ CN	H	CH ₃	145-148/0,2
XLVIII	-CO-S-C ₄ H ₉	H	CH ₃	48
IL	-CO-O-	H	CH ₃	153 - 156
L	-CO-S-	H	CH ₃	123 - 125

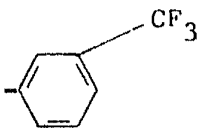
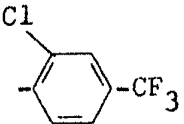
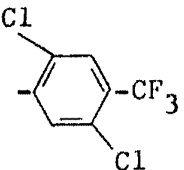
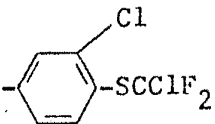
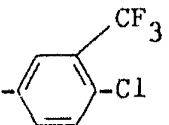
T A B L A 3



Ejemplo Nº	R ¹	Punto de fusión Punto de ebullición °C/mmHg
I	CH ₃	41 - 42 ; 142 / 0,6
II	C ₂ H ₅	108 / 0,6



T A B L A 3 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	Punto de fusión °C Punto de ebullición °C/ mm Hg
III	C ₃ H ₇	141-142 / 0,9
IV	CH(CH ₃) ₂	136-137 / 0,6
V	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	143-144 / 1,2
VI	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	143 / 1
VII	C(CH ₃) ₃	112-113 / 0,3
VIII	CH ₂ -CH=CH ₂	132-134 / 0,7
IX	CH ₂ OCH ₃	174-176 / 1,2
X		139-141
XI		143-144
XII		151-152
XIII		106-107
XIV		178-179



T A B L A 3 (Continuación)

Ejemplo Nº	R ¹	Punto de fusión Punto de ebullición °C/mm Hg
XV		156,5 - 158
XVI		176 - 178 / 0,7
XVII		91 - 92
XVIII		177 - 178 / 0,45
XIX		86 - 89 ; 138-140 / 0,4
XX		200 - 202 / 1,3
XXI		153 / 0,25

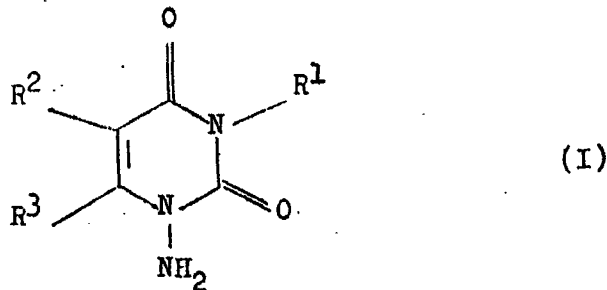
N O T A

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 18 de febrero de 1972, bajo el número P 22 07 549.6; 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 LA OBTENCIÓN DE COMPOSICIONES HERBICIDAS; caracterizándose por lo siguiente:

1.- Procedimiento para la obtención de composiciones herbicidas, a base de 1-aminouracilos, de fórmula:



15.

20.

25.

30.

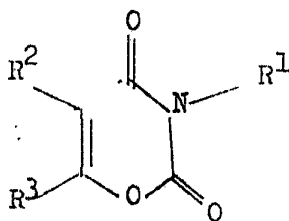
en la que R¹ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, alquilocicloalquilo, halogenocicloalquilo, terpenilo, halogenoalquilo, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilalquilo, alcoxicarbonilo, alquiltiocarbonilo, alquilcarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, aroxialquilcarbonilo, alquiltioalquilo, arilsulfonilo, aralquilo eventualmente sustituido en la parte arilo, arilcarbonilo, fenoxicarbonilo y feniltiocarbonilo eventualmente sustituidos, arilo eventualmente sustituido o un heterociclo eventualmente sustituido, R² es hidrógeno, halógeno, el radical tiocianato, alquilo o arilo eventualmente sustituido, R³ es alquilo o aralquilo eventualmente sustituido en la parte arilo, además, R² y R³ conjuntamente representan un puente de metileno de varios miembros que con los dos átomos de carbono en las posiciones 5 y 6 del heterociclo forman un anillo condensado que





eventualmente está substituido por alquilo, y sus sales; caracterizado porque, en una primera etapa, 2,3-dihidro-1,3-oxacin-2,4-dionas de fórmula:

5.

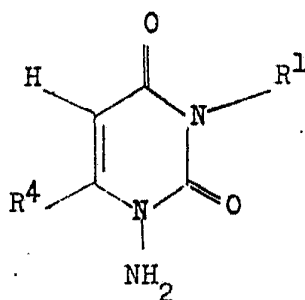


II

en la cual R¹, R² y R³ tienen los significados arriba definidos, se hacen reaccionar con hidracina, eventualmente en presencia de un diluyente, a temperaturas entre -30°C y + 100°C, y los 1-aminouracilos de fórmula:

10.

15.



IA

20.

en la cual R¹ tiene el significado arriba indicado y R⁴ representa alquilo o aralquilo eventualmente substituido en la parte arilo, se hacen reaccionar con halógeno, en presencia de un agente ligador de ácidos y en presencia de un disolvente o diluyente a temperaturas entre 0°C y 50°C; y

25.

en una segunda etapa, los 1-aminouracilos de fórmula (I) así obtenidos, se mezclan con materiales de carga y, en caso dado, con materiales tensioactivos, en una cantidad de 0,1 - 95 partes en peso de material activo por 99,9 - 5 partes en peso de materiales auxiliares.

30.

2.- Procedimiento según la reivindicación 1, carac-





5.

terizado porque en la segunda etapa, como materiales auxiliares, se emplean disolventes líquidos, materiales de carga sólidos, agentes emulsionantes y agentes dispersantes; como disolventes, se emplean disolventes aromáticos, aromáticos clorados, parafinas, alcoholes, aminas o derivados amínicos; como materiales de carga sólidos, se emplean las molturaciones de minerales naturales o molturaciones de minerales sintéticos; y como materiales tensioactivos, se emplean emulsionantes no ionógenos o aniónicos, o lignina, deslixivaciones sulfúricas, o metil celulosa.

10.

3.- Procedimiento para la obtención de composiciones herbicidas, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

15.

Esta Memoria consta de 45 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

4 AGO. 1975

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.-

REPORTE TÉCNICO Y MODELO
 por el Sr. D. J. Suárez Díaz

José Suárez Díaz

