

426304

PATENTE DE INVENCION

O.Z. 29 883.

F.C. 12-1-76

Int. Cl.: C07D//A01N

426304

Memoria Descriptiva

sobre:

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE
BENZOFURANILO.-

Solicitante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana, residente en
6700 Ludwigshafen, Republica Federal Alemana.-

La presente invención se refiere a un procedimiento para preparar nuevos y valiosos ésteres de 5-benzofuranilo que se utilizan como herbicidas.

Se conoce el empleo de sulfonato de 2,3-dihidro-
5. 3,3-dimetil-2-etoxi-5-benzofuranilmetano, pero su efecto,

BAD ORIGINAL

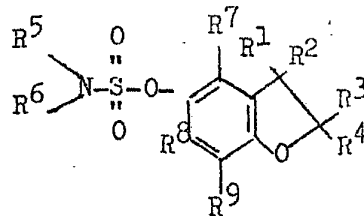
423304



sin embargo, es deficiente.

Se ha encontrado que ésteres de 5-benzofuranilo de la fórmula general:

5.



10.

en la que R^1 , R^2 y R^3 pueden ser iguales o diferentes y representan hidrógeno o alquilo (metilo, etilo, propilo), o R^1 y R^2 , o R^2 y R^3 forman juntos una cadena de alquileno (verg. con 2 a 5 átomos de carbono); R^4 es hidroxilo, alcoxi (verg. con 1 a 5 átomos de carbono, en caso dado sustituido por haluro

15.

o alcoxi, por ejemplo, metoxi, alcoxi, beta-cloroetoxi o metoxietoxi), alquenciloxi (verg. con 2 a 4 átomos de carbono, en caso dado sustituido por haluro, por ejemplo, aliloxi o cloroaliloxi), alquinioloxi (verg. con 2 a 4 átomos de carbono, en caso dado sustituido por haluro, por ejemplo, propargiloxi, butiniloxi o clorobutiniloxi), alquiltiomerapto (verg. metiltiomerapto, etiltiomerapto, propiltiomerapto), ariltiomerapto

20.

(en caso dado sustituido en el aromático por haluro o alquilo, verg. bencilmerapto, p-feniletiltiomerapto, p-clorobencilmerapto), ariloxi (en caso dado sustituido por haluro o

25.

nitro, verg. ionoxi, nitrofenoxi), R^4 representa, además, el grupo $NH^{10}R^{11}$, representando R^{10} y R^{11} alquilo (metilo, etilo, propilo, butilo), o alquilo sustituido (verg. con 1 a 4 átomos de carbono, sustituido por haluro o alcoxi, verg. etilo halogenado o metoxietilo), o cuando R^{10} y R^{11} junto

30.

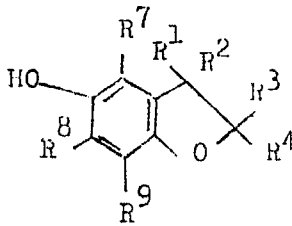
con el átomo de nitrógeno, siendo aquellos los sustituyentes



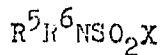
- del nitrógeno, un anillo heterocíclico, en caso sustituido, por ejemplo, morfolina, 2,6-dimetilmorfolina, pirrolidina, piperidina, metilpiperacina, hexamtilenimina, 2-metil-hexamtilenimina, acetidina, trimetilacetidina, R^4 representa, además, el grupo $OCOR^{12}$, siendo R^{12} alquilo (verg. con 1 a 4 átomos de carbono, en caso dado sustituido por haluro, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, trifluorometilo, clorometilo), alquenilo (verg. alilo y metalilo), alquinilo (verg. propargilo y butinilo), arilo (en caso dado sustituido por haluro, alquilo o nitro, por ejemplo, fenilo, tolilo, clorofenilo nitrofenilo), alquilamino (verg. metilamino, dimetilamino), alcoxi (en caso dado sustituido por haluro o alcoxi, verg. metoxi, etoxi, propoxi), alqueniloxi (con 3 a 4 átomos de carbono, en caso dado sustituido por haluro, por ejemplo, aliloxi, y cloroaliloxi), alquiniloxi (verg. con 3 a 4 átomos de carbono, en caso dado sustituido por haluro, verg. propargiloxi o clorobutiniloxi), arilamino (en caso dado sustituido por alquilo, cloro o alcoxi, verg. fenilamino, tolilamino, clorofenilamino), ariloxi (en caso dado sustituido por alquilo o haluro, verg. fenoxi, toliloxi, clorofeniloxi), y en que R^5 y R^6 son iguales o diferentes y representan hidrógeno, alquilo (metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, sec-butilo, i-butilo), o alquilo sustituido (beta-cloroetilo), R^7 , R^8 y R^9 son iguales o diferentes y representan hidrógeno, alquilo (metilo, etilo), haluro (cloro, bromo), ciano, acetilo o metoxi, tienen un buen efecto herbicida que es superior a él de los herbicidas conocidos.

Los nuevos compuestos se obtienen haciendo reaccionar un derivado de benzofuranilo de la fórmula

42630A 4 -



5. en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁷, R⁸ y R⁹ tienen las significaciones arriba indicadas, con un haluro de aminosulfonilo de la fórmula



10.

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, teniendo R⁵ y R⁶ las significaciones arriba indicadas y siendo X haluro.

La obtención de los nuevos ésteres de 5-benzofurani- lo se ilustra a raíz de los ejemplos siguientes:

15.

Ejemplo 1

A una solución de 48,8 partes (partes en peso) de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolino-5-hidroxi-benzofurano y 27,3 partes de trietilamina, en 130 partes de tetrahidrofurano se añaden bajo agitación a 0 - 5°C 36 partes de cloruro de metilaminosulfenilo. La mezcla de reacción se filtra por succión después de agitarla durante una hora a temperatura ambiente. El filtrado se concentra al vacío y el residuo se disuelve en 250 partes de metanol. Después de adicionar 100 partes de agua y de tratar la solución con carbón activo se induce la cristalización mediante enfriamiento. La pasta cristalina se filtra por succión, se lava con metanol absoluto y se seca al vacío. El producto bruto tiene un punto de fusión de 125 - 128°C. Cristalizando una prueba a partir de metanol al 80 % se obtiene un 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato puro, P.F. 125-126°C.

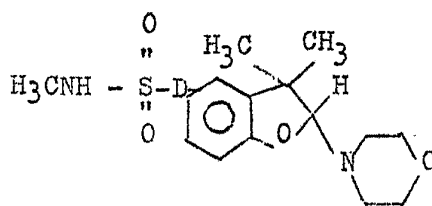
20.

25.

30.



El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:



Los siguientes compuestos se obtienen en forma similar:

10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-amino-sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-etil-amino-sulfonato, p.f. 95-97°C
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-propil-aminosulfonato, aceite no destilable,
15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-isopropilaminosulfonato, p.f. 117-119°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-butil-amino-sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-beta-cloroetil-sulfonato,
20. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-amino-sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-metil-aminosulfonato,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-etil-aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-propil-aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-isopropil-aminosulfonato,
- 30.

426304

- 6 -



- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-beta-clo-
roetilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(4-metilpiperacino)-benzofuran-5-
il-aminosulfonato,
5. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(4-metilpiperacino)-benzofurano-5-
il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(4-metilpiperacino)-benzofuran-5-
il-etilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(4-metilpiperacino)-benzofuran-5-
10. il-propilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(4-metilpiperacino)-benzofuran-5-
il-isopropilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(hexametilenuimino)-benzofuran-5-il-
metilaminosulfonato,
15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(hexametilenuimino)-benzofuran-5-
il-etilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3-etil-2-morfolinobenzofuran-5-il-metilaminosul-
fonato,
- 2,3-dihidro-3-etil-2-piperidinobenzofuran-5-il-metilamino-
20. fonato, p.f. 114-115²⁰,
- 2,3-dihidro-3-etil-2-piperidinobenzofuran-5-il-metilamino-
sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(dimetilamino)-benzofuran-5-il-
metilaminosulfonato,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(dimetilamino)-benzofuran-5-il-
etilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3,6-trimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-
aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3,6-trimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-etilami-
30. nosulfonato,



- 2,3-dihidro-3,3,6,7-tetrametil-2-morfolinobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3,6,7-tetrametil-2-morfolinobenzofuran-5-il-etilaminosulfonato,
5. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-pirrolidino-4,6-diclorobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolino-6-clorobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolino-4,6-diclorobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-morfolino-4-acetilbenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolino-6-metoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
15. 2,3-dihidro-2,3-tetrametilen-2-morfolinobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-2,3-trimetilen-2-morfolinobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato.

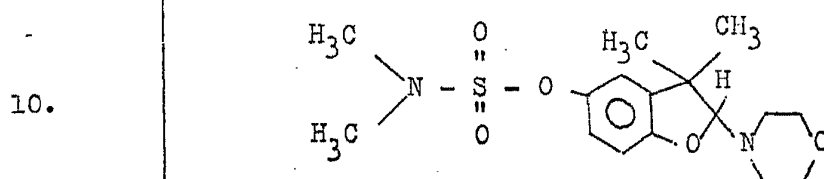
Ejemplo 2

20. Una suspensión de 9,6 partes de hidruro sódico en 190 partes de tetrahidrofurano se mezcló a 20 a 30°C con una solución de 99,6 partes de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolino-5-hidroxi-benzofurano en 360 partes de tetrahidrofurano bajo agitación y controlando el desarrollo de hidrógeno. Para completar la reacción se siguió agitando durante 1 hora a 40°C.
25. A continuación, se adicionó a la mezcla de reacción a 30 a 35°C 60 partes de cloruro de dimetilaminosulfonilo gota a gota y después se completó la reacción durante 30 minutos a 50 a 55°C. Para la elaboración se separó el cloruro sódico, se
30. concentró la solución clara al vacío, se disolvió el residuo



5. en metanol bajo calentamiento y se filtró la solución caliente. Después de enfriado se filtró el producto cristalizado por succión; el producto bruto tuvo un p.f. de 110-113°C. Cristalizando una segunda vez a partir de metanol se obtuvo un 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato puro, p.f. 113 a 114°C.

El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:



En forma similar se prepararon:

15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato, p.f. 90 - 92°C,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-N-metil-beta-cloroetilaminosulfonato,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
20. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-piperidinobenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-pirrolidinobenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-pirrolidinobenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,
2,3-dihidro-3-etil-piperidinobenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
2,3-dihidro-3-etil-2-piperidinobenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,
30. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-N-metil-



etilaminosulfonato.

5. La obtención de los derivados de 5-hidroxi-benzofurano sustituidos empleados como sustancias de partida puede desprenderse, entre otros, de la publicación de patente holandesa 6.512.311, del jornal para química práctica, 4ª serie, tomo 32, página 144 (1966) y de la publicación de patente estadounidense 3.184.457.

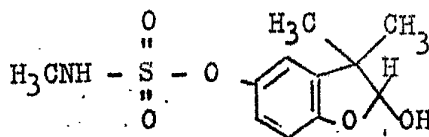
Ejemplo 3

10. A una mezcla de 133 partes de agua y 68 partes de ácido clorhídrico concentrado se agregó de una vez a 80°C y bajo agitación 68 partes de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolino-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato. La mezcla obtenida se calentó rápidamente a 90 a 95°C, y se mantuvo durante 2 minutos a esta temperatura. A continuación, se enfrió la solución de reacción inmediatamente añadiéndole hielo. Para su elaboración se extrajo con éter; se lavó la solución etérea dos veces con agua, se secó con sulfato de magnesio y se concentró al vacío.

15. El residuo viscoso se disolvió en 100 partes de éter y después de agregar 60 partes de n-hexano se obtuvo por enfriamiento un 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato en forma cristalina, p.f. 111-112°C.

El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:

25.



30.

En forma análoga se obtuvieron los compuestos si-



guientes:

- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-etilamino-sulfonato; $n_D^{25} = 1,5250$,
5. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-propilamino-sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-isopropil-aminosulfonato, p.f. 75 - 76°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-butilamino-sulfonato,
10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-beta-cloro-etilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-dimetil-aminosulfonato, p.f. 90 - 91°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-diethylamino-sulfonato, p.f. 65-66°C,
15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-N-metil-N-beta-cloroetilaminosulfonato,
20. 2,3-dihidro-3-etil-2-hidroxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3,6,7-tetrametil-2-hidroxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3,6,7-tetrametil-2-hidroxibenzofuran-5-il-etilaminosulfonato.
- 25.

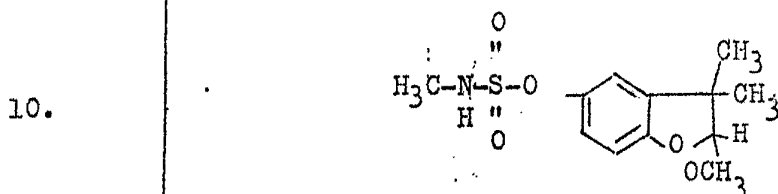
Ejemplo 4

- Una solución de 22,5 partes de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato en 200 partes de metanol se mezcló con 4 gotas de ácido sulfúrico concentrado y, a continuación, se hirvió durante 30 minutos a
- 30.



5. reflujo. Después de enfriada se neutralizó la mezcla de reacción para su elaboración con trietilamina y, a continuación, se secó al vacío. Alimentando el residuo viscoso con una mezcla de éter/n-hexano se obtuvo un 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato en forma cristalina; p.f.: 89 - 91°C.

El compuesto tuvo la siguiente fórmula estructural:



Procediendo en forma correspondiente se obtuvieron los siguientes compuestos:

15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato, p.f. 64 - 66°C,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato, p.f. 51 - 53°C,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato, p.f. 58 - 59°C,
20. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-butoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato, p.f. 66 - 67°C,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propargiloxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato, p.f. 70 - 71°C,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(2-cloroetoxi)-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato, p.f. 52 - 54°C.,
2,3-dihidro-3,3-dimetil-3-(2-metoxietoxi)-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
30.

426304



- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etiltiobenzofuran-5-il-metilamino-sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-etil-amino-sulfonato, $n_D^{25} = 1.5130$,
5. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-etilamino-sulfonato, $n_D^{25} = 1.5065$,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-etilamino-sulfonato, $n_D^{25} = 1.5005$,
10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-etilaminosulfonato $n_D^{25} = 1.5020$,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-etilamino-sulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-propilamino-sulfonato, p.f.: 74 - 75°C,
15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-propilamino-sulfonato, p.f.: 49 - 50°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-propil-aminosulfonato, p.f.: 54 - 55°C,
20. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-propil-aminosulfonato, p.f.: 78 - 81°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-propil-aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-isopropil-aminosulfonato, p.f.: 84 - 86°C,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-isopropil-aminosulfonato, p.f. 73 - 74°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-isopropil-aminosulfonato, p.f. 77 - 78°C,
30. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-isopropilaminosulfonato, p.f. 69 - 70°C,



- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-isopropil-aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, $n_D^{25} = 1.5087$, p.e.: 147 - 150°C,
5. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, $n_D^{25} = 1.5023$, p.e.₀: 165 - 167°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, $n_D^{25} = 1.5002$, p.e._{0,1}: 170 - 173°C,
10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, p.f.: 37 - 38°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, p.e._{0,05}: 161°C, $n_D^{25} = 1.5125$,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato, p.f.: 52 - 53°C,
15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato, $n_D^{25} = 1.4995$,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,
20. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-(2-cloretoci)-benzofuran-5-il-dimetilaminsulfonato, p.e._{0,05}: 170 - 173°C, $n_D^{25} = 1.5135$,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxietoxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, p.e._{0,05}: 166 - 172°C, $n_D^{25} = 1.5025$,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato, $n_D^{25} = 1.5050$,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-N-metiletilaminosulfonato, p.e._{0,05}: 143 - 152°C, $n_D^{25} = 1.5075$,
30. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-N-metiletilaminosulfonato,



- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-N-metil-etilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-N-metil-etilaminosulfonato,
5. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-N-metil-beta-cloroetilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-N-metil-beta-cloroetilaminosulfonato,
10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-N-metil-beta-cloroetilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-N-metil-beta-cloroetilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-aminosulfonato, p.f.: 130 - 131°C,
15. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-aminosulfato, p.f.: 139 - 140°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-aminosulfonato,
20. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-aminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-aminosulfato,
- 2,3-dihidro-3,3,6,7-tetrametil-2-etoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metilcarboniloxi-benzofuran-5-il-dimetilarinosulfonato, p.f.: 66 - 68°C,
25. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-clorometilcarboniloxi-benzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, p.f. 89 - 90°C,
- 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etilcarboniloxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato, p.f. 53-55°C,
30. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxicarboniloxi-benzofuran-5-il-



- dimetilaminosulfonato, p.f. 101 - 102°C,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxicarboniloxibenzofuran-5-il-
 dimetilaminosulfonato,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metilcarbamoiloxibenzofuran-5-il-
 5. dimetilaminosulfonato, p.f. 100 - 102°C,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etilcarbamoiloxibenzofuran-5-il-
 dimetilaminosulfonato, p.f. 111-113°C,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropilcarbamoiloxibenzofuran-
 5-il-dimetilaminosulfonato, p.f. 107 - 109°C,
 10. 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-clorometilcarbamoiloxibenzofuran-
 5-il-dietilaminosulfonato, aceite no destilable, $n_D^{25} = 1.5078$,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxicarboniloxibenzofuran-5-il-
 dietilaminosulfonato, p.f. 96 - 97°C,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metilcarbamoiloxibenzofuran-5-il-
 15. dietilaminosulfonato, p.f. 122 - 123°C,
 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etilcarbamoiloxibenzofuran-5-il-
 dietilaminosulfonato, p.f. 125 - 126°C.

Las nuevas sustancias activas muestran un fuerte efecto herbicida por lo que se pueden emplear como herbicidas, o bien para combatir el crecimiento de plantas indeseadas. Que los agentes tengan un efecto selectivo o total depende en primera linea de la cantidad aplicada por unidad de área.

20. Por malas hierbas o bien plantas indeseadas se entienden de toda planta mono o dicotiledónea que crece en lugares donde no se desea.

Así pueden combatirse con los agentes conforme a la invención gramíneas, tales como

- | | | |
|-----|------------------|---------------|
| 25. | Cynodon spp. | Dactylis spp. |
| | Digitaria spp. | Avena spp. |
| 30. | Echinochloa spp. | Bromus spp. |

426304

- 16 -



5. Setaria spp. Uniola spp.
 Panicum spp. Poa spp.
 Alopecurus spp. Leptochloa spp.
 Lolium spp. Brachiaria spp.
 Sorghum spp. Eleusine spp.
 Agropyron spp. Cenchrus pp.
 Phalaris spp. Eragrostis spp.
 Apera spp. y otros
10. cyperaceae, tales como
 Carex spp. Eleocharis spp.
 Cyperus spp.
 Scirpus spp. y otros
- malas hierbas dicotiledóneas, tales como
 malvaceae, por ejemplo
15. Abutilon theoprasti Hibiscus spp.
 Sida spp.
 Malva spp. y otros
- compositiae, tales como
20. Ambrosia spp. Centaurea spp.
 Lactuca spp. Tussilago spp.
 Senecio spp. Lapsana communis
 Sonchus spp. Tagetes spp.
 Xanthium spp. Erigeron spp.
 Iva spp. Anthemis spp.
25. Galinsoga spp. Matricaria spp.
 Taraxacum spp. Artemisia spp.
 Chrysanthemum spp. y otros.
 Bidens spp.
 Cirisum spp.
- 30.

426334



- urtica spp.
- violaceae, tales como
- viola spp. y otros
- zygophyllaceae, tales como
5. Tribulus ferrestis y otros
- euphorbiaceae, tales como
- mercurialis annua Euphorbia spp.
- umbelliferae, tales como
- Daucus carota Ammi majus
10. Aethusa cynapium y otros
- commelinaceae
- Commelina spp. y otros
- labiatae, tales como
- Lamium spp. y otros
15. Galeopsis spp.
- leguminosae, tales como
- Vicia spp. Cassia spp.
- Lathyrus spp. y otros
- Sesbania exaltata
20. plantaginaceae, tales como
- Plantago spp. y otros
- polygonaceae, tales como
- Polygonum spp. Fagopyrum spp.
- Rumex spp. y otros
25. aizoaceae, tales como
- Mollugo verticillata y otros
- amaranthaceae, tales como
- Amaranthus spp. y otros
- boraginaceae, tales como
30. Amsinckia spp. Anchusa spp.



- Myostis spp.
- Lithospermum spp. y otros
- caryophyllaceae, tales como
 - Stellaria spp. Silene spp.
 - 5. Spergula spp. Cerastium spp.
 - Saponaria spp. Agrostemma githago
 - Scleranthus annuus y otros
- chenopodiaceae, tales como
 - Chenopodium spp. Atriplex spp.
 - 10. Kochia spp. Monolepis nuttalliana
 - Salsola Kali y otros
- lythraceae, tales como
 - Cuphea spp. y otros
- oxalidaceae, tales como
 - 15. oxalis spp.
- ranunculaceae, tales como
 - Ranunculus spp. Adonis spp.
 - Delphinium spp. y otros
- papaveraceae, tales como
 - 20. Papaver spp. y otros
 - Fumaria officinalis
- onagraceae, tales como
 - Jussiaea spp. y otros
- rosaceae, tales como
 - 25. Alchemillia spp. y otros
 - Potentilla spp.
- potamogetonaceae, tales como
 - patamogeton spp. y otros
- najadaceae, tales como
 - 30. Najas spp. y otros.



marsileaceae, tales como

marsilea quadrifolia y otros

Las nuevas sustancias activas pueden emplearse en cultivos de cereales, tales como

- | | | |
|----|---------------|-------------------|
| 5. | Avena spp. | Sorghum |
| | Triticum spp. | Zea mays |
| | Hordeum spp. | Panicum miliaceum |
| | Secale spp. | Oryza spp. |

y en cultivos de dicotiledóneas, tales como

- | | | |
|-----|-----------------------|------------------|
| 10. | Cruciferae, verg. | |
| | Brassica spp. | Raphanus spp. |
| | Sinapis spp. | Legitima spp. |
| | Compositae, verg. | |
| | Lactuca spp. | Carthamus spp. |
| 15. | Helianthus spp. | Scorzonera spp. |
| | Malvaceae, verg. | |
| | Gossypium hirsutum | |
| | Leguminosae, verg. | |
| | Medicago spp. | Phaseolus spp. |
| 20. | Trifolium spp. | Arvicola spp. |
| | Pisum spp. | Glycine Max |
| | Chenopodiaceae, verg. | |
| | Beta vulgaris | |
| | Spinacia spp. | |
| 25. | Solanaceae, verg. | |
| | Solanum spp. | Capisium carraun |
| | Nicotiana spp. | |
| | Linaceae, verg. | |
| | Linum spp. | |
| 30. | Umbelliferae, verg. | |



Petroselinum spp.

Apium graveolens

Daucus carota

Rosaceae, verg.

Fragaria

Cucurbitaceae, verg.

5.

Cucumis spp.

Cucurbita spp.

Liliaceae,

Allium spp.

Vitaceae, verg.

Vitis vinifera

10.

Bromeliaceae, verg.

Ananas sativus

15.

La aplicación se efectúa, por ejemplo, en forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite, pastas, agentes de espolvoreo, de esparcimiento, granulados directamente pulverizables, pulverizando, atomizando, espolvoreando, esparciendo o regando. Las formas de aplicación vienen determinadas por las finalidades del empleo, pero en todo caso es necesario que esté asegurada la más fina repartición posible de las sustancias activas.

20.

Para la obtención de soluciones, emulsiones, pastas y dispersiones de aceite directamente pulverizables entran en consideración, fracciones de aceite mineral del punto de ebullición medio hasta elevado, tales como querosina o aceite Diesel, además aceites de alquitrán de carbón etc., así como aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, benceno, tolueno, xilol, parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas o sus derivados, por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol, cloroformo, tetracloruro de carbono

25.

30.

426304



no, ciclohexanol, ciclohexanona, clorobenceno, isoflora ete. disolventes fuertemente polares, por ejemplo, dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirilidona, agua etc.

5. Las formas de aplicación acuosas pueden prepararse mediante la adición de agua a concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables) y dispersiones de aceite. Para obtener emulsiones, pastas o dispersiones de aceite pueden homogeneizarse las sustancias como tales o disueltas en un aceite o en un disolvente mediante agentes reticulantes, adhesivos, dispersantes, emulsionantes en agua.
10. Pero también es posible obtener concentrados compuestos de sustancia activa, agentes de reticulación, adhesión, dispersión o de emulsión y eventualmente disolventes o aceites solubles con agua.

15. Como sustancias tensioactivas sean mencionadas: sales alcalinas, alcalinotérreas, sales amónicas de ácido ligninosulfónico, ácidos naftalinosulfónicos, ácidos fenolnaftalínicos, alquilorilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sales alcalinas y alcalinotérreas del ácido dibutilnaftalinosulfónico, sulfato de lauriléter, sulfatos de alcohol graso, sales alcalinas y alcalinotérreas de ácidos grasos, sales de hexadecanoles sulfatados, heptadecanoles, octadecanoles, sales de glicoléter de alcohol graso sulfatado, productos de condensación de naftalina sulfonada y derivados de la naftalina con formaldehído, productos de condensación de la naftalina o bien de los ácidos naftalinosulfónicos con fenol y formaldehído, polioxietilen-octilfenoléter, laeoctilfenol, octilfenol, nonilfenol etoxilados, alquifenolpoliglicoléter, tributilfenilpoliglicoléter, alcoholes de alquifenoléter, alcohol de isotridecilo, condensados de óxido etilénico de
- 20.
- 25.
- 30.



cohol grano, aceite de ricino etoxilado, polioxietilenaalquil-éter, polioxipropileno etoxilado, acetal de poliglicoléter de laurilalcohol, éster sorbítico, lignina, lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.

5. Los polvos, agentes de esparcimiento y de espolvoreo pueden obtenerse mezclando o moliendo las sustancias activas junto con un soporte sólido.

10. Los granulados, por ejemplo, granulados recubiertos, impregnados y granulados homogéneos pueden producirse mediante enlace de las sustancias activas con soportes sólidos. Soportes sólidos son, por ejemplo, tierras minerales, tales como silcagel, ácidos silícicos, geles de silicio, silicatos, talco, caolín, attaclay, caliza, cal, tiza, talco, bol, loess, arcilla, dolomita, diatomita, sulfato de calcio y de magnesio, óxido de magnesio, sustancias plásticas molidas, abonos, tales como sulfato amónico, fosfato amónico, nitrato amónico, ureas y productos vegetales, tales como arinas de cereales, de corteza, de madera y de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros soportes sólidos.

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

20. A las mezclas o a cada sustancia activa se puede adicionar, en caso dado inmediatamente antes de aplicarlas (mezcla de tanque), aceites de diferente tipo, herbicidas, fungicidas, nematocidas, insecticidas, bactericidas, elementos pizcas, abonos, agentes antiespumantes, (p.e. siliconas), reguladores del crecimiento, antídotos u otros compuestos de efecto herbicida, tales como

25. anilinas sustituidas, ácidos ariloxicarboxílicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,

30.



426304

ésteres sustituidos,

ácidos arsónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,

bencimidazoles sustituidos,

5. benzisocitazoles sustituidos,

dióxidos de benzitiadiazinona sustituidos,

benzoxacinas sustituidas,

benzoxacinonas sustituidas,

benztiadiazoles sustituidos,

10. biuretes sustituidos,

quinolinas sustituidas,

carbamatos sustituidos,

ácidos carboxílicos alifáticos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,

15. ácidos carboxílicos aromáticos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,

carbamoilalquiltiol o carbamoilalquilditiofosfatos sustituidos,

quinazolinas sustituidas,

ácidos cicloalquilamidocarbatiólicos sustituidos, así como sus sales,

20. sales, ésteres y amidas,

cicloalquilcarbonamidoazoles sustituidos,

ácidos dicarboxílicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,

sulfonatos de dihidrobenzofuranilo sustituidos,

25. disulfuros sustituidos,

sales de dipiridilio sustituidas,

ditiocarbamatos sustituidos,

ácidos ditiofosfóricos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,

30. ureas sustituidas,



- hexahidro-l-H-carbotoicatos sustituidos;
hidantoinas sustituidas,
sales de hidrazonio sustituidas,
hidracidas sustituidas,
isooxazolpirimidonas sustituidas,
5. imidazoles sustituidos,
isotiazolpirimidonas sustituidas,
cetonas sustituidas,
naftoquinonas sustituidas,
nitrilos alifáticos sustituidos,
10. nitrilos aromáticos sustituidos,
oxadiazoles sustituidos,
oxadiazinonas sustituidas,
oxadiazolidindionas sustituidas,
oxadiazindionas sustituidas,
15. fenoles sustituidos, así como sus sales y ésteres,
ácidos fosfónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y
amidas,
cloruros fosfónicos sustituidos,
fosfonalquilglicinas sustituidas,
20. fosfitas sustituidas,
ácidos fosfóricos sustituidos, así como sus sales, ésteres y
amidas,
piperidinas sustituidas,
pirazoles sustituidos,
25. ácidos pirazolalquilcarboxílicos sustituidos, así como sus
sales, ésteres y amidas,
sales de pirazolio sustituidas,
pirazolioalquilsulfatos sustituidos,
piridacinas sustituidas,
30. piridazonas sustituidas,

426304



- ácidos piridincarboxílicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
piridinas sustituidas,
carboxilatos de piridina sustituidos,
piridinonas sustituidas,
5. pirimidinas sustituidas,
pirimidonas sustituidas,
ácidos pirrolidincarboxílicos sustituidos, así como sus sa-
les, ésteres y amidas,
pirrolidinas sustituidas,
10. pirrolidonas sustituidas,
ácidos arilsulfónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres
y amidas,
estirenos sustituidos,
tetrahidro-oxadiazindionas sustituidas,
15. tetrahidro-oxadiazoldionas sustituidas,
tetrahidrometanoindenos sustituidos,
tetrahidro-oxadiazoltionas sustituidas,
tetrahidrotiadiazintionas sustituidas,
tetrahidrotiadiazoldionas sustituidas,
20. amidas de ácido tiocarboxílico aromáticas sustituidas,
ácidos tiocarboxílicos sustituidos, así como sus sales, ésteres
y amidas,
tiolcarbamatos sustituidos,
tioureas sustituidas,
25. ácidos tiofosfóricos sustituidos, así como sus sales, ésteres
y amidas,
triazinas sustituidas,
triazoles sustituidos,
uracilos sustituidos,
30. uretidindionas sustituidas.



426306

Los últimos compuestos herbicidas pueden aplicarse tanto antes como después de la aplicación de las sustancias activas como tales o de las mezclas de las sustancias activas conforme a la invención.

5. La adición de estos agentes a los herbicidas conforme a la invención, puede efectuarse en una proporción en peso de 1:10 a 10:1. Lo mismo puede decirse de aceites, fungicidas, nematocidas, insecticidas, bactericidas, antídotos y reguladores del crecimiento.

10. Los agentes conformes a la invención pueden emplearse,

- una o varias veces
- antes de plantar
- después de plantar

15. antes de la siembra
antes de la emergencia

o

- después de la emergencia
- durante la emergencia de las plantas de cultivos o de las plantas indeseadas.

20. La cantidad de aplicación de los agentes conforme a la invención puede variar y depende en primer lugar de la clase del efecto deseado.

25. La cantidad de aplicación asciende, generalmente, a entre 0,1 g y 15 kg o más, preferentemente 0,2 y 6 kg de sustancia activa por hectárea.

Ejemplo 5

30. En el invernadero se llenaron tiestos experimentales con arena arcillosa y se sembraron semillas de beta vulga-

420004



ris, spinacia oleracea, avena fatua, echinochloa crus galli, lolium multiflorum, poa annua y sinapis convensis.

Inmediatamente después se trataron éstos con las sustancias activas I y VIII y con la sustancia activa comparativa IX, en una cantidad de 2 kg de sustancia activa por hectárea, dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea.

5.

Sustancia activa:

10.

I 2,3-dicloro-3,3-dimetil-2-metocibenzofuran-5-il-etilaminosulfonato,

II 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,

III 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,

15.

IV 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,

V 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,

20.

VI 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-etilaminosulfonato,

VII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzofuran-5-il-etilaminosulfonato,

VIII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,

25.

X 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,

XI 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzofuran-5-il-metil-etil-aminosulfonato,

30.

XII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-beto-cloretobenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,

1426304



- XIII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-beta-metoxi-etoxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
- XIV 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
- 5. XV 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-beta-cloroetoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- XVI 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- XVII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- 10. XVIII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propargiloxibenzofuran-5-il-metilaminosulfonato.

Sustancia comparativa IX = 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzofuran-5-il-metanosulfonato.

15. Al cabo de 3 a 4 semanas se verificó que las sustancias activas I a VIII tuvieron una mejor compatibilidad con las plantas de cultivo y un mejor efecto herbicida que la sustancia activa IX.

20. El resultado del experimento se desprende de la tabla siguiente:

sustancia activa kg/ha.	I 2	II 2	III 2	IV 2	V 2	VI 2	VII 2	VIII 2	IX 2
----------------------------	--------	---------	----------	---------	--------	---------	----------	-----------	---------

plantas útiles:

Beta vulgaris	0	0	0	0	0	5	0	0	10
Spinacia oleracea	0	0	0	0	0	10	2	0	15

25. plantas indeseadas:

Avena fatua	100	95	95	90	100	90	90	85	80
Echinochloa crus galli	100	95	90	90	90	90	90	85	80
Lolium multiflorum	100	100	100	100	100	85	50	100	80
Poa annua	100	100	100	100	100	90	65	95	85
30. Sinapis arvensis	40	60	60	65	60	30	30	30	20

426304



sustancia activa	X	XI	XII	XIII	XIV	XV	XVI	XVII	XVIII
kg/ha.	2	2	2	2	2	2	2	2	2

plantas útiles:

Beta vulgaris	0	0	0	0	0	0	0	0	0
---------------	---	---	---	---	---	---	---	---	---

5.

plantas indeseadas:

Avena fatua	100	90	85	95	90	90	90	90	90
-------------	-----	----	----	----	----	----	----	----	----

Echinochloa crus galli	100	100	90	85	90	85	85	80	80
------------------------	-----	-----	----	----	----	----	----	----	----

Lolium multiflorum	100	90	100	80	90	80	85	80	80
--------------------	-----	----	-----	----	----	----	----	----	----

10.

Poa annua	100	90	100	85	90	85	85	80	80
-----------	-----	----	-----	----	----	----	----	----	----

Sinapis arvensis	80	30	30	30	30	40	40	25	25
------------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----

0 = sin daño

100 = destrucción total

Ejemplo 6

15.

En el invernadero se trataron diferentes plantas teniendo una altura de crecimiento de 3 a 11 cm con las sustancias activas:

I 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxibenzo furan-5-il-metilaminosulfonato,

20.

II 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzo furan-5-il-metilaminosulfonato,

III 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxibenzo furan-5-il-metilaminosulfonato,

25.

IV 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzo furan-5-il-metilaminosulfonato,

V 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzo furan-5-il-metilaminosulfonato,

VI 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-isopropoxibenzo furan-5-il-etilaminosulfonato,

30.

VII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-morfolinobenzo furan-5-il-dimetilaminosulfonato,



- minosulfonato,
- IX 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxi-benzofuran-5-il-dietilaminosulfonato,
5. X 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-metoxi-benzofuran-5-il-etilaminosulfonato,
- XI 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-beta-cloroetoxi-benzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
- XII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-beta-metoxi-etoxi-benzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
10. XIII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxi-benzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato,
- XIV 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-beta-cloroetoxi-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- XV 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propoxi-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
15. XVI 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-aliloxi-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
- XVII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-propargiloxi-benzofuran-5-il-metilaminosulfonato,
20. y con la sustancia activa comparativa
- VIII 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-etoxi-benzofuran-5-il-metanosulfonato
- cada vez con una cantidad de aplicación de 2 kg de sustancia activa por hectárea, dispersada en 500 l de agua por hectárea.
25. Al cabo de 2 a 3 semanas se comprobó que las sustancias activas I a VII tuvieron una mejor compatibilidad con las plantas de cultivo y un mejor efecto herbicida que la sustancia activa VIII.
- El resultado del experimento se indica en la tabla
30. siguiente:



Sustancia activa kg/ha.	I 2	II 2	III 2	IV 2	V 2	VI 2	VII 2	VIII 2
----------------------------	--------	---------	----------	---------	--------	---------	----------	-----------

plantas útiles:

Beta vulgaris	0	0	0	0	0	0	0	20
---------------	---	---	---	---	---	---	---	----

5. Plantas indeseadas:

Avena fatua	100	100	100	85	85	90	90	75
Echinochloa crus galli	100	100	100	80	80	85	90	70
Poa annua	95	95	100	85	80	85	85	70

10. Sustancia activa kg/ha.	IX 2	X 2	XI 2	XII 2	XIII 2	XIV 2	XV 2	XVI 2	XVII 2
--------------------------------	---------	--------	---------	----------	-----------	----------	---------	----------	-----------

plantas útiles:

Beta vulgaris	0	0	0	0	0	0	0	0
---------------	---	---	---	---	---	---	---	---

plantas indeseadas:

15. Avena factua	75	80	85	90	90	100	90	95	90
Echinochloa crus galli	80	80	75	70	75	90	80	80	70
Poa annua	85	80	80	70	80	70	85	85	70

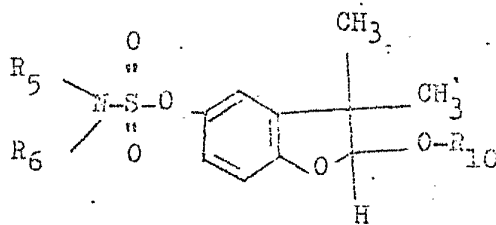
0 = sin daño

100 = destrucción total.

20.

Los siguientes compuestos tienen una eficiencia biológica correspondiente a aquellos de los ejemplos 6 y 8:

25.



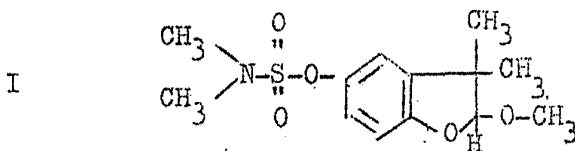
42630A



	R ₁₀	R ₆	R ₅
	-C-CH ₂ Cl	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅
	0		
5.	-C-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃
	0		
	-C-CH ₂ Cl	-CH ₃	-CH ₃
	0		
10.	-C-NH-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃
	0		
	-C-NH-C ₃ H ₇ ⁱ	-CH ₃	-CH ₃
	0		
15.	-C-NH-CH ₃	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅
	0		
	-C-NH-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅
	0		
20.			

Ejemplo 7

En el invernadero se llenaron varios tiestos experimentales con arena arcillosa y se sembraron diferentes semillas. Inmediatamente después se efectuó el tratamiento con las sustancias activas



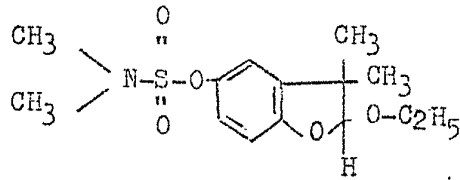
30.



426304

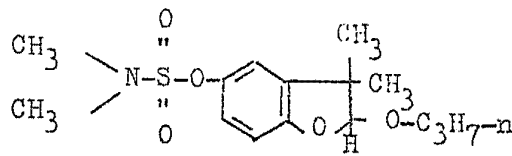
5.

II



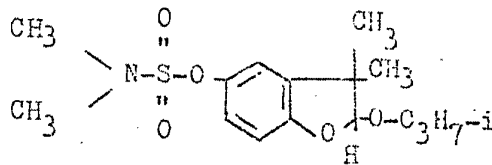
10.

III



15.

IV



20.

y para comparar con la sustancia activa comparativa

V 2-etoxi-7,7-dimero-5,5-dimetil-5-benzotiazolil-molenoato fenato

en cada caso dispersadas o emulsionadas con 500 l de agua por hectárea. La cantidad de aplicación ascendió en cada caso

25.

a 0,5 kg/ha de sustancia activa.

Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas I a IV tuvieron una mejor compatibilidad con las plantas de cultivo y un mejor efecto herbicida que la sustancia activa V.

30.

El resultado del experimento se desprende de la ta-



bla siguiente.

Tabla

sustancia activa kg/ha.	I 0,5	II 0,5	III 0,5	IV 0,5	V 0,5
Beta vulgaris	0	0	0	0	2,5
Avena fatua	100	100	80	90	16
Lolium multiflorum	80	85	50	60	4
Echinochloa crus galli	100	100	50	100	25
Alopecurus myosuroides	90	90	80	85	17

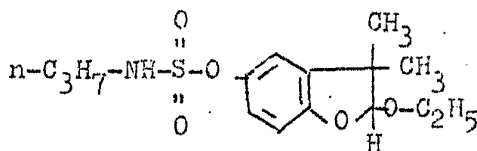
10.

0 = sin daño

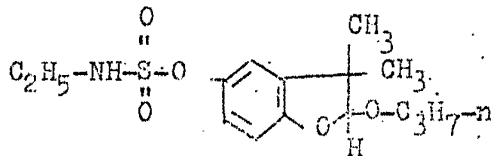
100 = destrucción total

Las siguientes sustancias activas tienen una eficacia biológica correspondiente a la de los compuestos I / II

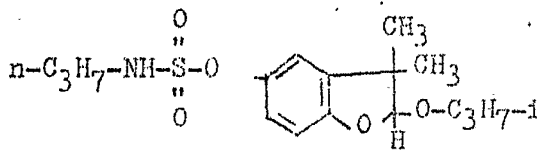
15.



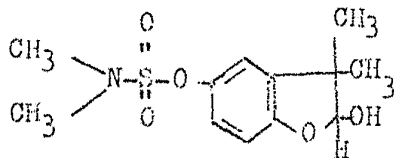
20.



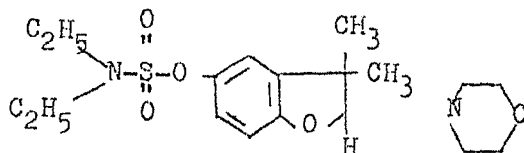
25.



30.



426304

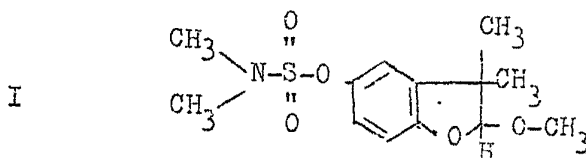


5.

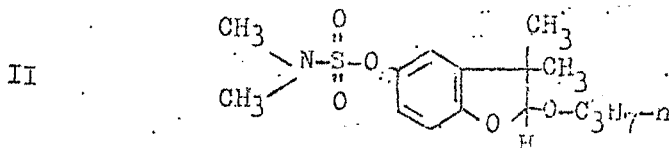
Ejemplo 8

En el invernadero se trataron diferentes plantas teniendo una altura de crecimiento de 3 a 11 cm con las siguientes sustancias activas

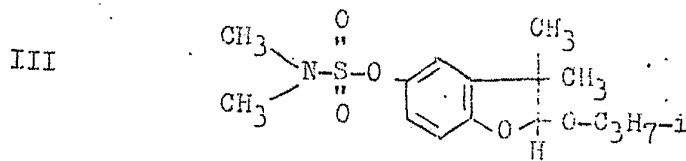
10.



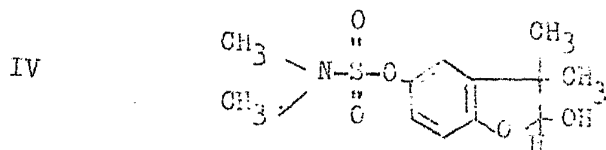
15.



20.

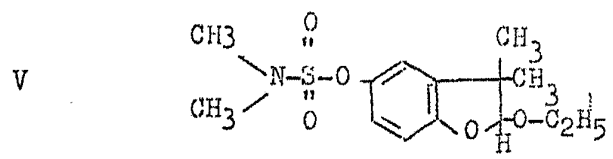


25.



30.

42030



5.

y para comparar con la sustancia activa

VI 2-etoxi-2,3-dihidro-3,3-dimetil-5-benzofuranil-metano-sulfonato,

10.

en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea. La cantidad de aplicación ascendió en cada caso a 1 kg de sustancia activa por hectárea. Al cabo de 2 a 3 semanas se verificó que las sustancias activas I a V mostraron un mejor efecto herbicida.

15.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

Tabla

sustancia activa kg/ha.	I 1	II 1	III 1	IV 1	V 1	VI 1
Beta vulgaris	0	0	0	0	0	0
Avena fatua	100	80	90	90	100	55
Alopecurus myosuroides	85	80	85	80	85	50
Cynodon dactylon	85	80	80	80	85	80

20.

0 = sin daño

100 = destrucción total.

25.

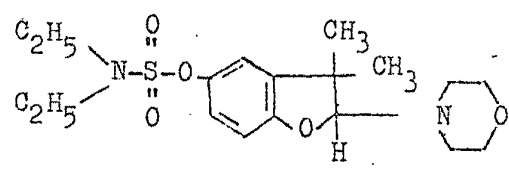
Tienen una eficiencia biológica correspondiente las sustancias activas

30.

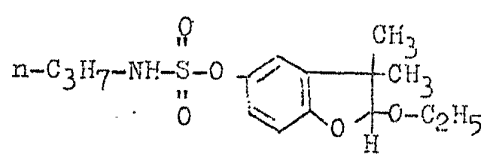
426304



5.



10.



15.

Ejemplo 9

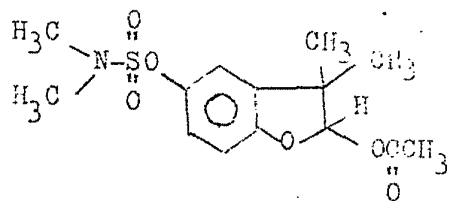
A una solución de 28,7 partes en peso de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato y 14,1 partes en peso de trietilamina en 120 partes en peso de éter (seco), se dosifican bajo agitación a -8 a -12°C 40,3 partes en peso de cloruro de acétilo. Al cabo de una hora se lava la mezcla de reacción, para su elaboración, agitando 3 veces con agua. Al concentrar la fase orgánica secada con sulfato de magnesio, se precipita la mayor parte del producto de reacción: p.f. 66-68°C.

20.

25.

El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:

30.



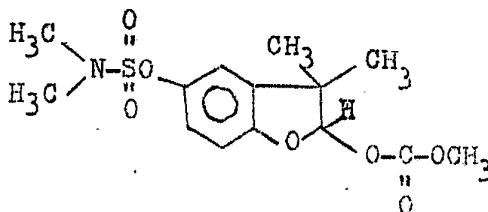


Ejemplo 10

5. A una solución de 28,7 partes en peso de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato y 14,1 partes en peso de trietilamina en 120 partes en peso de éter (seco), se dosifican bajo agitación a -8 a -12°C 12,4 partes en peso de clorocarbonato de metilo.

Después de su elaboración (según el ejemplo 9) se aísla el producto de reacción en forma de una sustancia cristalina, p.f. 101 - 102°C.

10. El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural



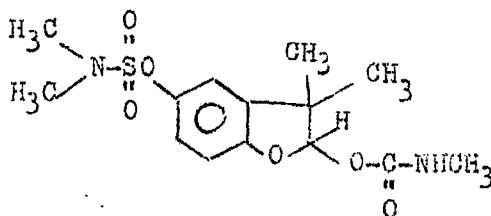
15.

Ejemplo 11

20. A una solución de 28,7 partes en peso de 2,3-dihidro-3,3-dimetil-2-hidroxibenzofuran-5-il-dimetilaminosulfonato en 90 partes en peso de tetrahydrofurano se agregó después de adicionar 1 parte en peso de trietilamina 6,9 partes en peso de metilisocianato. La mezcla de reacción se mantuvo en renozo durante 48 horas a temperatura ambiente y, a continuación, se concentró al vacío para su elaboración, el residuo se cristalizó a partir de éter, p.f. 100 - 102°C.

25.

El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:



30.

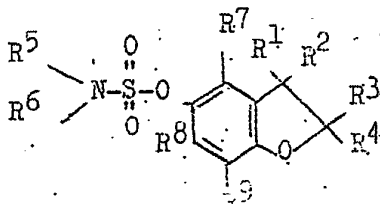
426304



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 16 de mayo de 1.973, bajo el número P 23 24 592.3; 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 OBTENCION DE DERIVADOS DE BENZOFURANILIO; caracterizándose por lo siguiente:

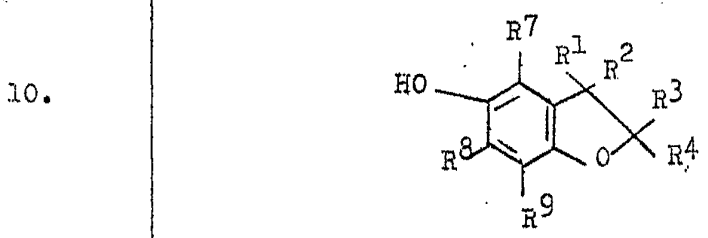
1.- Procedimiento para la obtención de derivados de benzofuranilo, de fórmula general:



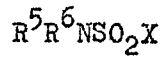
en la que R¹, R² y R³ son iguales o diferentes y representan hidrógeno o alquilo, o R¹ y R² ó R² y R³ forman juntos una cadena de alquileo; R⁴ es hidroxilo, alcoxi, alquinoxilo, alquinoxilo, alquilmercapto, aralquilmercapto, ariloxi, R⁵ representa, además, el grupo NR¹⁰R¹¹, siendo R¹⁰ y R¹¹ alquilo o alquilo sustituido o formando R¹⁰ y R¹¹ junto con el átomo de nitrógeno, siendo aquellos los sustituyentes del nitrogrupo, un anillo heterocíclico, en caso dado sustituido, R⁶ es,

R₆

42000
 además, el grupo OCOR^{12} , siendo R^{12} alquilo, alquenoilo, alquini-
 nilo, arilo, alquilamino, alcoxi, alquenilo, alquinilo, arilamino, ariloxi, y R^5 y R^6 son iguales o diferentes y re-
 presentan hidrógeno, alquilo o alquilo sustituido, R^7 , R^8 y
 5. R^9 son iguales o diferentes y significan hidrógeno, alquilo,
 haluro, ciano, acetilo o metoxi; caracterizado porque se ha-
 ce reaccionar un 5-hidroxibenzofurano de fórmula



15. en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , R^8 y R^9 tienen las significa-
 ciones arriba indicadas, con un haluro de aminosulfonilo de
 fórmula



en la que R^5 y R^6 tienen las significaciones arriba indicadas
 y X es haluro.

20. 2.- Procedimiento para la obtención de derivados
 de benzofuranilo, tal y como queda sustancialmente descrito
 en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 41 hojas escritas a máquina
 por una sola cara.

25. Madrid, 19 JUN 1974

BASF AKTIENGESELLSCHAFT.-

J. GÓMEZ ACEBO Y MODET
 P. Firmado: L. García Fernández

PG