

436.502

PATENTE DE INVENCION

O.Z. 30 503

Int. Cl.:	C07C // A 01 N
-----------	----------------

Memoria Descriptiva

sobre:

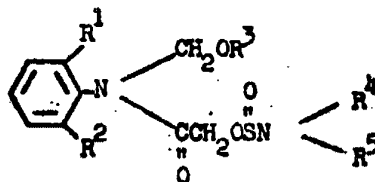
PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE ANILIDAS DE
ACIDO O-AMINOSULFONIL-GLICOLICO.

Solicitante: BASF AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana, re-
sidente en 6700 Ludwigshafen, República Federal
Alemana.

La presente invención se refiere a la obtención de nuevas y valiosas anilidas de ácido O-aminosulfonil-glicólico,

Es conocido emplear la N-metoximetil-2,6-dietilanilida de ácido cloroacético como herbicida (publicación de solicitud de patente alemana DOS 1 543 751); resulta, sin embargo, poco eficiente.

Se ha encontrado que tienen un buen efecto herbicida las anilidas de ácido O-aminosulfonil-glicólico de la fórmula general



en la que R¹ y R² significan grupos alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, R³ es un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilalquilo, alquilo halogenado, alqueno, alqueno halogenado, alquino, cicloalquilo o heterocicloalquilo, R⁴ y R⁵ representan hidrógeno, alquilo, alquilo halogenado, cicloalquilo, alqueno, alqueno halogenado, alquino o aralquilo.

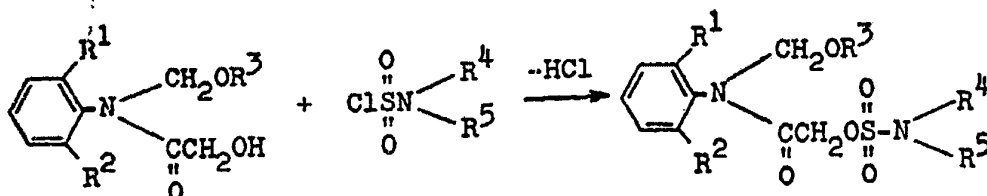
R¹ y R² significan, por ejemplo, grupos metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec.-butilo o terc.-butilo.

5 R³ es, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, amilo o hexilo normal o ramificado, 2-cloroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,3-dicloroisopropilo, 1,3-dibromoisopropilo, metoxietilo, metoxietoxietilo, alilo, propargilo, butin-1-ilo-3, 3-metilbutin-1-ilo-3, ciclopentilo.

10 R⁴ y R⁵ significan, por ejemplo, hidrógeno, metilo, clorometilo, etilo, 2-cloroetilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, pentilo, ciclopentilo, hexilo, ciclohexilo, bencilo, alilo, butenilo, hexenilo, propargilo, butin-1-ilo-3, 3-metilbutin-1-ilo-3, 2-fluoro-
15 2-metilpropilo, 2-fluoropropilo.

Los agentes poseen un fuerte efecto herbicida para con la mayoría de las malas hierbas de semillas y malezas de germinación poco profunda.

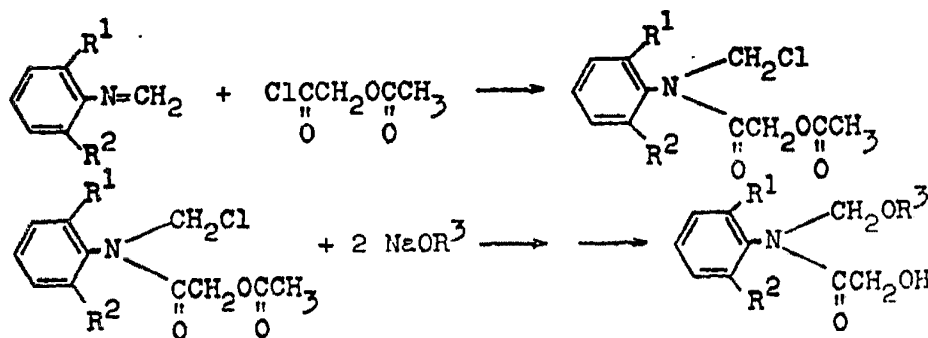
20 Los nuevos compuestos pueden prepararse según la siguiente ecuación general:



en la que R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados arriba indicados. La reacción se lleva a cabo, preferentemente, en presencia de un agente ligante de ácido.

- 5 Para el caso de que se utilice un haluro de dialquilaminosulfonilo, es recomendable emplear la anilida de ácido glicólico correspondiente en forma de sal metálica, preferentemente como sal alcalina.

10 Las anilidas de ácido glicólico que se necesitan para la reacción pueden prepararse en la siguiente forma:



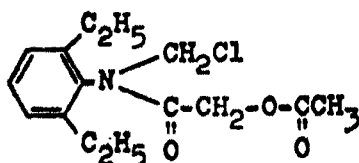
teniendo R¹, R² y R³ los significados arriba indicados.

La esterificación dando el grupo alcoximetilo y la separación del grupo acetilo también pueden realizarse en etapas.

EJEMPLO 1

5 a) A una solución de 136,5 partes (partes en peso) de cloruro de acetoxiacetilo en 150 partes de éter (seco) se
adicionan a 0°C y bajo agitación 161 partes de N-metilen-
2,6-dietilanilina. Para completar la reacción se azita
por 2 horas a 25°C. A continuación, se separa de la pe-
queña cantidad de material indisuelto y se concentra la
10 solución clara al vacío. Después de agregar 250 partes
de petroléter y enfriar con agua helada se filtra el pro-
ducto cristalino por succión: p.f. 51 - 54°C. Recristali-
zado a partir de éter/petroléter el producto analítica-
mente puro posee un p.f. de 56 - 58°C.

15 El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:



En forma correspondiente se obtiene:

la anilida de ácido N-clorometil-2,6-dimetil-O-acetil-
glicólico p.f. 90 - 91°C

20 la anilida de ácido N-clorometil-2-metil-6-etil-O-

acetilglicólico

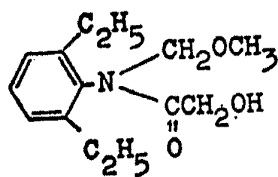
la anilida de ácido N-clorometil-2,6-diisopropil-O-acetil-glicólico p.f. 148 - 149°C

5 la anilida de ácido N-clorometil-2-metil-6-isopropil-O-acetil-glicólico.

- 10 b) A una solución de 119 partes (partes en peso) de anilida de ácido N-clorometil-2,6-diisopropil-O-acetil-glicólico en 400 partes de metanol se adicionan a 15 a 20°C y bajo agitación 131 partes de una solución de metilato sódico al 33 por ciento (por ciento en peso) en metanol, que se ha diluido adicionalmente con 100 partes de metanol. Para completar la reacción se agita la solución por 15 horas a temperatura ambiente. Para la elaboración se neutraliza la mezcla de reacción y se concentra al vacío.
- 15 El residuo se disuelve en etiléster de ácido acético y se lava dos veces con agua.

La solución orgánica se seca con sulfato de magnesio y se concentra al vacío.

20 El residuo smposo se purifica por destilación; p.e. 0,05 120 - 125°C, $n_D^{25} = 1,5255$. El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:



En forma correspondiente se obtienen:

- la 2,6-dietilanilida de ácido N-etoximetil-glicólico
p.e. 0,01 136 - 141°C, $n_D^{25} = 1,5176$
- 5 la 2,6-dietilanilida de ácido N-propoximetil-glicólico
la 2,6-dietilanilida de ácido N-isopropoximetil-glicólico
p.e. 0,1 125 - 134°C, $n_D^{25} = 1,5146$
- la 2,6-dietilanilida de ácido N-butoximetil-glicólico
p.e. 0,1 147 - 154°C, $n_D^{25} = 1,5112$
- 10 la 2,6-dietilanilida de ácido N-isobutoximetil-glicólico
la 2,6-dietilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-glicólico
la 2,6-dietilanilida de ácido N-aliloximetil-glicólico
p.e. 0,1 132 - 137°C, $n_D^{25} = 1,5267$
- 15 la 2,6-dietilanilida de ácido N-propargiloximetil-glicólico, p.e. 0,05 144 - 148°C, $n_D^{25} = 1,5360$
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-glicólico
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-glicólico
p.f. 47 - 48°C
- 20 la 2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-glicólico

p. g.₁ 139 - 142°C, $n_D^{25} = 1,5185$
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-glicólico
p. e._{0,1} 128 - 130°C, $n_D^{25} = 1,5153$
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-glicólico
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-ciclopentiloxi-glicólico
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-
glicólico, p. e._{0,1} 143 - 145°C, $n_D^{24} = 1,5422$
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-glicólico
p. e._{0,1} 133 - 135°C, $n_D^{20} = 1,5331$
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-glicólico
p. e._{0,25} 139 - 142°C
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-glicó-
lico
p. e.₁ 160 - 165°C
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-(2,2,2-trifluoroetoxi-
metil)-glicólico
p. f. 48 - 49°C
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-metoxietoximetil-glicó-
lico
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-2-cloroetoximetil-gli-
cólico
la 2,6-dimetilanilida de ácido N-butin-1-il-3-oximetil-
glicólico
la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-metoximetil-glicólico
la 2-metil-6-etilanilida de ácido N- etoximetil-glicólico

la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-propoximetil-glicó-
lico

la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-isopropoximetil-
glicólico

la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-butoximetil-glicólico

la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-isobutoximetil-
glicólico

la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-
glicólico

la 2-metil-6-etilanilida de ácido N-aliloximetil-gli-
cólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-metoximetil-glicó-
lico, p.f. 124 - 126°C

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-etoximetil-glicólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-propoximetil-gli-
cólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-isopropoximetil-
glicólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-butoximetil-glicólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-isobutoximetil-gli-
cólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-
glicólico

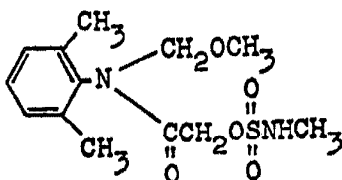
la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-aliloximetil-glicólico

la 2,6-diisopropilanilida de ácido N-propargiloximetil-
glicólico

c) 2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-metilamino-sulfonil-glicólico

A una solución de 22,3 partes en peso de 2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-glicólico en 135 partes en peso de diclorometano se adiciona a 0 a -5°C a la vez y por dos recipientes de entrada 17,5 partes en peso de trietilamina y 22,5 partes en peso de cloruro de metilaminosulfonilo (al 90 por ciento). Una hora después de la alimentación se trata la mezcla de reacción con agua, ácido clorhídrico diluido, agua y una solución de bicarbonato sódico diluida. Después de secar con sulfato de magnesio se evapora la mayor parte de la fase orgánica al vacío. Después de adicionar éter al residuo se inicia la cristalización por frotamiento y enfriamiento y después de algún tiempo se filtra la pasta cristalina por succión. p.f. $101 - 102^{\circ}\text{C}$.

El compuesto tiene la siguiente fórmula estructural:



En forma correspondiente se obtienen los compuestos:

2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico, $n_D^{25} = 1,5163$

2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-2-fluoropropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico, p.f. 84 - 86°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico, p.f. 79 - 80°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-sec.-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-2-fluoroetilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-aminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico, p.f. 48 - 49°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico, p.f. 64 - 66°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico, p.f. 54 - 56°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-sec.-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-2-cloropropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-2-fluoropropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-aminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico, p.f. 76 - 78°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico, p.f. 73 - 74°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico, p.f. 80 - 81°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-sec.-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-2-fluoropropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-sec.-butilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico

- 2,6-dimetilanilida de ácido N-butoximetil-O-2-fluoropropil-aminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-O-metilaminó-sulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-butilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-propilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-isobutoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico, p.f. 78 - 79°C
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico , $n_D^{25} = 1,5120$
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-etilaminosul-

fonil-glicólico, p.f. 58 - 59°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-propilamino-
sulfonil-glicólico, p.f. 75 - 75°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-isopropil-
aminosulfonil-glicólico, p.f. 60 - 61°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-metilaminosul-
fonil-glicólico, p.f. 52 - 53°C

2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-isopropilamino-
sulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-butilaminosul-
fonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-sec.-butilamino-
sulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-2-cloroetilami-
nosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-aliloximetil-O-2-fluoro-2-
metilpropilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-metilami-
nosulfonil-glicólico, p.f. 71 - 73°C

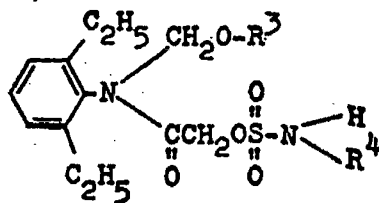
2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-etilami-
nosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-propil-
aminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-isopropil-
aminosulfonil-glicólico

- 2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-butil-aminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-sec.-butilaminosulfonil-glicólico
- 5 2,6-dimetilanilida de ácido N-propargiloximetil-O-2-cloroetilaminosulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-(2,2,2-trifluoroetoximetil)-O-metilaminosulfonil-glicólico, p.f. 26 - 87°C
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-(2,2,2-trifluoroetoximetil)-O-etilaminosulfonil-glicólico, p.f. 60 - 62°C
- 10

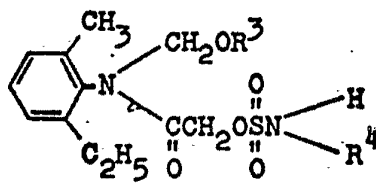
Los siguientes compuestos también se obtuvieron según este procedimiento:



R ³	R ⁴	p.f. (°C)
15 CH ₃	H	
CH ₃	CH ₃	74 a 76
CH ₃	C ₂ H ₅	n _D ²⁵ = 1,5150
CH ₃	C ₃ H ₇	
CH ₃	1-C ₃ H ₇	77 a 79

R ³	R ⁴	p.f. (°C)	
CH ₃	C ₄ H ₉		
CH ₃	sec.-C ₄ H ₉		
CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	72 a	73
5 CH ₃	CH ₂ CF(CH ₃)CH ₃		
C ₂ H ₅	H		
C ₂ H ₅	CH ₃		
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		
C ₂ H ₅	C ₃ H ₇		
10 C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇	60 a	61
C ₂ H ₅	C ₄ H ₉		
C ₂ H ₅	sec.-C ₄ H ₉		
C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ Cl		
C ₂ H ₅	CH ₂ CF(CH ₃)CH ₃		
15 C ₃ H ₇	H		
C ₃ H ₇	CH ₃		
C ₃ H ₇	C ₂ H ₅		
C ₃ H ₇	C ₃ H ₇		
C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇		
20 C ₃ H ₇	C ₄ H ₉		
C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉		
C ₃ H ₇	CH ₂ CH ₂ Cl		
C ₃ H ₇	CH ₂ CF(CH ₃)CH ₃		
1-C ₃ H ₇	H		
25 1-C ₃ H ₇	CH ₃		
1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅		
1-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇		
1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇		
1-C ₃ H ₇	C ₄ H ₉		
30 1-C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉		
1-C ₃ H ₇	CH ₂ CH ₂ Cl		
1-C ₃ H ₇	CH ₂ CF(CH ₃)CH ₃		
CH ₂ CH=CH ₂	H		
CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	n _D ²⁵	1,5185
CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅	n _D ²⁵	1,5160
35 CH ₂ CH=CH ₂	C ₃ H ₇		
CH ₂ CH=CH ₂	1-C ₃ H ₇	Fp. _v	47 - 48°C

	R ³	R ⁴
	CH ₂ CH=CH ₂	C ₄ H ₉
	CH ₂ CH=CH ₂	sec.-C ₄ H ₉
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
5	CH ₂ C=CH	H
	CH ₂ C=CH	CH ₃
	CH ₂ C=CH	C ₂ H ₅
	CH ₂ C=CH	C ₃ H ₇
	CH ₂ C=CH	1-C ₃ H ₇
10	CH ₂ C=CH	C ₄ H ₉
	CH ₂ C=CH	sec.-C ₄ H ₉
	CH ₂ C=CH	CH ₂ CH ₂ Cl

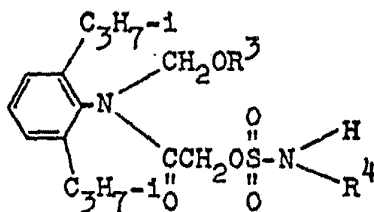


	R ³	R ⁴
15	CH ₃	H
	CH ₃	CH ₃
	CH ₃	C ₂ H ₅
	CH ₃	C ₃ H ₇
	CH ₃	1-C ₃ H ₇
20	CH ₃	C ₄ H ₉
	CH ₃	sec.-C ₄ H ₉
	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
	C ₂ H ₅	H
	C ₂ H ₅	CH ₃
25	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇
	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇
	C ₂ H ₅	C ₄ H ₉
	C ₂ H ₅	sec.-C ₄ H ₉
30	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ Cl
	C ₃ H ₇	H
	C ₃ H ₇	CH ₃

p.f. 62 - 63°C

n_D²⁵ 1,5120

	R ³	R ⁴
	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅
	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇
	C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇
5	C ₃ H ₇	C ₄ H ₉
	C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉
	C ₃ H ₇	CH ₂ CH ₂ Cl
	1-C ₃ H ₇	H
	1-C ₃ H ₇	CH ₃
10	1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅
	1-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇
	1-C ₃ H ₇	C ₄ H ₉
	1-C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉
15	1-C ₃ H ₇	CH ₂ CH ₂ Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
	CH ₂ CH=CH ₂	C ₃ H ₇
20	CH ₂ CH=CH ₂	1-C ₃ H ₇
	CH ₂ CH=CH ₂	C ₄ H ₉
	CH ₂ CH=CH ₂	sec.-C ₄ H ₉
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ Cl
	CH ₂ C≡CH	H
25	CH ₂ C≡CH	CH ₃
	CH ₂ C≡CH	C ₂ H ₅
	CH ₂ C≡CH	C ₃ H ₇
	CH ₂ C≡CH	1-C ₃ H ₇
	CH ₂ C≡CH	C ₄ H ₉
30	CH ₂ C≡CH	sec.-C ₄ H ₉
	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₂ Cl

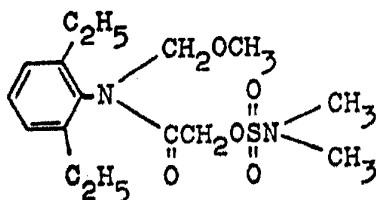


	R ³	R ⁴	p. f. (°C)
	CH ₃	H	
	CH ₃	CH ₃	83 a 85
5	CH ₃	C ₂ H ₅	
	CH ₃	C ₃ H ₇	
	CH ₃	1-C ₃ H ₇	90 a 91
	CH ₃	C ₄ H ₉	
	CH ₃	sec.-C ₄ H ₉	
10	CH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	
	C ₂ H ₅	H	
	C ₂ H ₅	CH ₃	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	
15	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇	
	C ₂ H ₅	C ₄ H ₉	
	C ₂ H ₅	sec.-C ₄ H ₉	
	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ Cl	
	C ₃ H ₇	H	
20	C ₃ H ₇	CH ₃	
	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	
	C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	
	C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	
	C ₃ H ₇	C ₄ H ₉	
25	C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉	
	C ₃ H ₇	CH ₂ CH ₂ Cl	
	1-C ₃ H ₇	H	
	1-C ₃ H ₇	CH ₃	
	1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	
30	1-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	
	1-C ₃ H ₇	C ₄ H ₉	
	1-C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉	
	1-C ₃ H ₇	CH ₂ CH ₂ Cl	

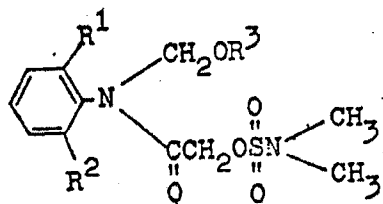
EJEMPLO 2

2,6-dietilanilida de ácido N-metoximetil-O-dimetilamino-sulfonil-glicólico

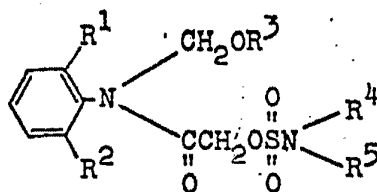
Una suspensión de 3,6 partes en peso de hidruro sódico en
5 100 partes en peso de tetrahydrofurano se mezcla a 20 a 30°C
y bajo agitación y en la medida que se desarrolla el hidró-
geno con una solución de 37,7 partes en peso de 2,6-dietil-
anilida de ácido N-metoximetil-glicólico. Para completar
la reacción se agita ulteriormente por 10 horas a 40°C. A
10 continuación, se agrega a la mezcla de reacción a 15 a 20°C
una solución de 21,6 partes en peso de cloruro de dimetil-
aminosulfonilo en 30 partes en peso de tetrahydrofurano.
Al cabo de 2 horas después de la adición se concentra la mez-
cla de reacción al vacío. El residuo se disuelve en éster
15 acético y se lava sucesivamente con agua, ácido clorhídrico
diluido, y nuevamente con agua. Después de secar con sulfato
de magnesio se elimina el disolvente de la solución de éster
acético al vacío. El residuo siruposo ($n_D^{25} = 1,5145$) no se
20 cristaliza aún dejándolo en reposo por un tiempo más pro-
longado. El compuesto tiene la siguiente estructura:



En forma correspondiente se obtienen los siguientes compuestos:



	R ¹	R ²	R ³	n _D ²⁵	
	CH ₃	CH ₃	CH ₃	n _D ²⁵	1,5055
	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	"	1,5083
	CH ₃	CH ₃	C ₃ H ₇		
5	CH ₃	CH ₃	1-C ₃ H ₇		
	CH ₃	CH ₃	C ₄ H ₉		
	CH ₃	CH ₃	1-C ₄ H ₉	"	1,5030
	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂		
	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH		
10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃		
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇		
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇		
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₄ H ₉		
15	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1-C ₄ H ₉		
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂		
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH		
	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	n _D ²⁵	1,5100
	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		
20	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇		
	CH ₃	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇		
	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₄ H ₉		
	CH ₃	C ₂ H ₅	1-C ₄ H ₉		
	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂		
25	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	CH ₃		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇		
30	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	C ₄ H ₉		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	CH ₂ CH=CH ₂		
	1-C ₃ H ₇	1-C ₃ H ₇	CH ₂ C≡CH		



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	n _D ²⁵
	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1,5090
	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1,5100
5	CH ₃	CH ₃	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	CH ₃	CH ₃	1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1,5070
	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	CH ₃	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
15	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	
	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	
	CH ₃	CH ₃	C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	
	CH ₃	CH ₃	1-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	
20	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇	CH ₃	C ₂ H ₅	
	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	1,5082

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.

Para la obtención de soluciones, emulsiones, pastas y dispersiones de aceite directamente pulverizables entran en consideración, las fracciones de aceite mineral del punto de ebullición medio hasta elevado, tales como querosina
5 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,
10 propanol, butanol, cloroformo, tetracloruro de carbono, ciclohexanol, ciclohexanona, clorobenceno, isoforona etc., disolventes fuertemente polares, por ejemplo, dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirilidona, agua etc.

Las formas de aplicación acuosas pueden prepararse mediante
15 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
20 reticulantes, adhesivos, dispersantes, emulsionantes en agua. Pero también es posible obtener concentrados compuestos de sustancia activa, agentes de reticulación, adhesión, dispersión o de emulsión y eventualmente disolventes o aceites diluibles con agua.

Como sustancias tensioactivas sean mencionadas: sales alcalinas, alcalinotérreas, sales amónicas de ácido ligninosulfónico, ácido naftalinosulfónicos, ácidos fenosulfónicos, alquilanilsulfonatos, 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, isooctilfenol, octilfenol, nonilfenol etoxilados, alquilfenolpoliglicoléter, tributilfenilpoliglicoléter, alcoholes de alquilarilpoliéter, alcohol de isotridecilo, condensados de óxido etilénico de alcohol graso, aceite de ricino etoxilado, polioxietilenaalquiléter, polioxipropileno etoxilado, acetal de diglicoléter de laurilalcohol, éster sorbítico, lignina, lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.

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

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 silbagel, 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 harinas de cereales, de corteza, de madera y de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros soportes sólidos.

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

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 (por ejemplo siliconas), reguladores de crecimiento, antídotos u otros compuestos de efecto herbicida, tales como anilinas sustituidas,

- ácidos ariloxycarboxílicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
éteres sustituidos,
ácidos arsónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres
5 y amidas,
bencimidazoles sustituidos,
benzisotiazoles sustituidos,
dióxidos de benztiazinona sustituidos,
benzoxacinas sustituidas,
10 benzocacinas sustituidas,
benztiazoles sustituidos,
biuretes sustituidos,
quinolinas sustituidas,
carbamatos sustituidos,
15 ácidos carboxílicos alifáticos sustituidos, así como sus
sales, ésteres y amidas,
ácidos carboxílicos aromáticos sustituidos, así como sus
sales, ésteres y amidas,
20 carbamoilalquiltiol o carbamoilalquilditiofosfatos susti-
tuídos,
quinazolininas sustituidas,
ácidos cicloalquilamidocarbatiólicos sustituidos, así como
sus sales, ésteres y amidas,
cicloalquilcarbonamidotiazoles sustituidos,

- ácidos dicarboxílicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
sulfonatos de dihidrobenzofuranilo sustituidos,
disulfuros sustituidos,
5 sales de dipiridilio sustituidas,
ditiocarbamatos sustituidos,
ácidos ditioposfóricos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
ureas sustituidas,
10 hexhidro-l-H-carbotioatos sustituidos,
hidantoínas sustituidas,
sales de hidrazonio sustituidas,
hidracidas sustituidas,
isocazolpirimidonas sustituidas,
15 imidazoles sustituidos,
isotiazolpirimidonas sustituidas,
cetonas sustituidas,
naftoquinonas sustituidas,
nitrilos alifáticos sustituidos,
20 nitrilos aromáticos sustituidos,
oxadiazoles sustituidos,
oxadiazinonas sustituidas,
oxadiazolidindionas sustituidas,
oxadiazindionas sustituidas,
25 fenoles sustituidos, así como sus sales, ésteres
ácidos fosfónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres
y amidas,

- cloruros fosfónicos sustituidos,
fosfonalquilglicinas sustituidas,
fosfitas sustituidas,
ácidos fosfóricos sustituidos, así como sus sales, ésteres
5 y amidas,
piperidinas sustituidas,
pirazoles sustituidos,
ácidos pirazolalquilocarboxílicos sustituidos, así como sus
sales, ésteres y amidas,
10 sales de pirazolio sustituidas,
pirazolioalquilsulfatos sustituidos,
piridacinas sustituidas,
piridazonas sustituidas.
ácidos piridincarboxílicos sustituidos, así como sus sales,
15 ésteres y amidas,
piridinas sustituidas,
carboxilatos de piridina sustituidos, .
piridinonas sustituidas,
pirimidinas sustituidas,
20 pirimidonas sustituidas,
ácidos pirrolidincarboxílicos sustituidos, así como sus
sales, ésteres y amidas,
pirrolidinas sustituidas,
pirrolidonas sustituidas,
25 ácidos arilsulfónicos sustituidos, así como sus sales, éste-
res y amidas,

- estirenos sustituidos,
tetrahidro-oxadiazindionas sustituidas,
tetrahidro-oxadiazoldionas sustituidas,
tetrahidrometanoindenos sustituidos,
5. tetrahidro-oxadiazoltionas sustituidas,
tetrahidrotiadiazintionas sustituidas,
tetrahidrotiadiazoldionas sustituidas,
amidas de ácido tiocarboxílico aromáticas sustituidas,
ácidos tiocarboxílicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
10 tiolcarbamatos sustituidos,
tioureas sustituidas,
ácidos tiofosfóricos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
15 triazinas sustituidas,
triazoles sustituidos,
uracilos sustituidos,
uretindionas sustituidas,
los últimos compuestos herbicidas pueden aplicarse tanto
20 antes como después de la aplicación de las sustancias activas como tales o de las mezclas de las sustancias activas conforme a la invención.

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.

5 Los agentes conforme a la invención pueden emplearse una o varias veces, entre otros, antes de plantar, después de plantar, antes de la siembra, antes de la emergencia, después de la emergencia o durante la emergencia de las plantas de cultivo o de las plantas indeseadas.

10 Las mezclas 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 línea de la cantidad aplicada por unidad de área.

15 Por malas hierbas o bien plantas indeseadas se entiende 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

20	Cynodon spp.	Dactylis spp.
	Digitaria spp.	Avena spp.
	Echinochloa spp.	Bromus spp.

- | | | |
|----|--|---------------------|
| | Setaria spp. | Uniola spp. |
| | Panicum spp. | Poa spp. |
| | Alopecurus spp. | Leptochloa spp. |
| | Lolium spp. | Brachiaria spp. |
| 5 | Sorghum spp. | Eleusine spp. |
| | Agropyron spp. | Cenchrus spp. |
| | Phalaris spp. | Eragrostis spp. |
| | Apera spp. | Phragmites communis |
| | y otros | |
| 10 | Cyperaceae, tales como | |
| | Carex spp. | Eleocharis spp. |
| | Cyperus spp. | |
| | Scirpus spp. | y otros |
| | malas hierbas dicotiledóneas, tales como | |
| 15 | malvaceae, por ejemplo | |
| | Abutilon theoprasti | Hibiscus spp. |
| | Sida spp. | etc. |
| | Malva spp. | |
| | Compositae, 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.
Galinsoga spp.
Taraxacum spp.
Chrysanthemum spp.
5 Bidens spp.
Cirsium spp.
- Convolvulaceae, tales como
Convolvulus spp.
Ipomoea spp.
10 Jaquemontia tamnifolia
- Cruciferae, tales como
Barbarea vulgaris
Brassica spp.
Capsella spp.
15 Sisymbrium spp.
Thlaspi spp.
Sinapis arvensis
Raphanus spp.
- Geraniaceae, tales como
20 Erodium spp.
Geranium spp.
- Portulacaceae, tales como
Portulaca spp.
- Anthemis spp.
Matricaria spp.
Argemisia spp.
etc.
- Cuscuta spp.
etc.
- Arabidopsis thaliana
Descurainia spp.
Draba spp.
Coronopus didymus
Lepidium spp.
etc.
- etc.

- Primulaceae, tales como
 Anagallis arvensis etc.
 Lysimachia spp.
- Rubiaceae, tales como
5 Richardia spp. Diodia spp.
 Galium spp. etc.
- Scrophulariaceae, tales como
 Linaria spp. Digitalis spp.
 Veronica spp. etc.
- 10 Solanaceae, tales como
 Physalis spp. Nicotiana spp.
 Solanum spp. etc.
 Datura spp.
- Urticaceae, tales como
15 Urtica spp.
- Violaceae, tales como
 Viola spp. etc.
- Zygophyllaceae, tales como
 Tribulus terrestris etc.
- 20 Euphorbiaceae, tales como
 Mercurialis annua Euphorbia spp.
- Umbelliferae, tales como
 Daucus carota Ammi majus

- Aethusa cynapium etc.
- Commelinaceae, tales como
Commelina spp. etc.
- Labiatae, tales como
5 Lamium spp. etc.
Galeopsis spp.
- Leguminosae, tales como
Medicago spp. Sesbania exaltata
Trifolium spp. Cassia spp.
10 Vicia spp. etc.
Lathyrus spp.
- Plantaginaceae, tales como
Plantago spp. etc.
- Polygonaceae, tales como
15 Polygonum spp. Fagopyrum spp.
Rumex spp. etc.
- Aizoaceae, tales como
Mollugo verticillata etc.
- Amaranthaceae, tales como
20 Amaranthus spp. etc.
- Boraginaceae, tales como
Amsinckia spp. Anchusa spp.
Myostis spp. etc.
Lithospermum spp.

	Caryophyllaceae, tales como	
	Stellaria spp.	Silene spp.
	Spergula spp.	Cerastium spp.
	Saponaria spp.	Agrostemma githago
5	Scleranthus annuus	etc.
	Chenopodiaceae, tales como	
	Chenopodium spp.	Atriplex spp.
	Kochia spp.	Monolepsis nuttalisana
	Salsola Kali	etc.
10	Lythraceae, tales como	
	Cuphea spp.	etc.
	Oxalidaceae, tales como	
	Oxalis spp.	
	Ranunculaceae, tales como	
15	Rnunculus spp.	Adonis spp.
	Delphinium spp.	etc.
	Papaveraceae, tales como	
	Papaver spp.	etc.
	Fumaria officinalis	
20	Onagraceae, tales como	
	Jussiacea, spp.	etc.
	Rosaceae, tales como	
	Alchemillia spp.	etc.
	Potentilla spp.	

- Potamogetonaceae, tales como
Potamogeton spp. etc.
- Najadaceae, tales como
Najas spp. etc.
- 5 Marsileaceae, tales como
Marsilea quadrifolia etc.
- Polypodiaceae, tales como
Pteridium aquilinum
- Alismataceae, tales como
10 Alisma spp. etc.
Sagittaria sagittifolia
- Equisetaceae, tales como
Equisetaceae spp. etc.

15 La cantidad de aplicación de los agentes conforme a la in-
vención puede variar y depende en primer lugar de la clase
de efecto deseado. La cantidad de aplicación varía, general-
mente, entre 0,1 y 15 kg o más, preferentemente 0,2 y 6 kg
de sustancia activa por hectárea.

20 Los nuevos agentes pueden emplearse en cultivos de cereales,
tales como
Avena spp. Sorghum
Triticum spp. Zea mays

Hordeum spp.

Panicum miliaceum

Secale spp.

Oryza spp.

y en cultivos de dicotiledóneas, tales como

Cruciferae, por ejemplo

5 Brassica spp.

Raphanus spp.

Sinapis spp.

Lepidium spp.

Compositae, por ejemplo

Lactuca spp.

Carthamus spp.

Helianthus spp.

Scorzonera spp.

10 Malvaceae, por ejemplo

Gossypium hirsutum

Leguminosae, por ejemplo

Medicago spp.

Phaseolus spp.

Trifolium spp.

Arachis spp.

15 Pisum spp.

Glycine Max

Chenopodiaceae, por ejemplo

Beta vulgaris

Spinacia spp.

Solanaceae, por ejemplo

20 Solanum spp.

Capsicum annum

Nicotiana spp.

Linaceae, por ejemplo

Linum spp.

- Umbelliferae, por ejemplo
 Petroselinum spp. Apium graveolens
 Daucus carota
- Rosaceae, por ejemplo Fragaria
- 5 Cucurbitaceae, por ejemplo
 Cucumis spp. Cucurbita spp.
- Liliaceae, por ejemplo
 Allium spp.
- Vitaceae, por ejemplo
- 10 Vitis vinifera
- Bromeliaceae, por ejemplo
 Ananas sativus

EJEMPLO 3

15 En el invernadero se llena tierra arenosa y arcillosa en
 tiestos experimentales y se siembran con las semillas de
 diferentes plantas.

Inmediatamente después se efectúa el tratamiento con

- I 2,6-dietilanilida de ácido N-metoximetil-O-metilamino-
 sulfonil-glicólico
- 20 II 2,6-dietilanilida de ácido N-metoximetil-O-dimetil-
 aminosulfonil-glicólico
- III 2,6-dietilanilida de ácido N-etoximetil-O-isopropil-
 aminosulfonil-glicólico

- IV 2,6-dietilanilida de ácido N-metoximetil-O-etil-aminosulfonil-glicólico
- V 2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-etil-aminosulfonil-glicólico
- 5 VI 2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-metil-aminosulfonil-glicólico
- VII 2,6-dimetilanilida de ácido N-etoximetil-O-etil-aminosulfonil-glicólico
- VIII 2,6-dimetilanilida de ácido N-propoximetil-O-metil-aminosulfonil-glicólico
- 10 IX 2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico
- y para comparar con
- X 2,6-dietilanilida de ácido N-metoximetil-cloroacético.

15 La cantidad de aplicación ascendió en cada caso a 3 kg por hectárea, estando las sustancias activas en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea.

Al cabo de 4 a 5 semanas se comprobó que las sustancias activas I a IX mostraron una mejor compatibilidad con las plantas de cultivo teniendo el mismo efecto herbicida que la sustancia activa X.

20

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente.

sustancia activa		I	II	III	IV	V	VI	VII
kg/ha		3	3	3	3	3	3	3
<u>plantas útiles:</u>								
5	Brassica napus	0	0	0	0	0	0	0
	Zea mays	0	0	0	0	0	0	0
	Glycine max	0	0	0	0	0	0	0
	Gossypium hirsutum	0	0	0	0	0	0	0
	Beta vulgaris	0	10	10	0	5	10	10
<u>plantas indeseadas:</u>								
10	Lolium multiflorum	95	100	100	95	100	100	100
	Poa annua	95	100	100	95	100	100	100
	Echinochloa crus-galli	95	100	100	100	100	100	100

sustancia activa		VIII	IX	X
kg/ha		3	3	3
15	Brassica napus	0	0	40
	Zea mays	0	0	5
	Glycine max	0	0	7
	Gossypium hirsutum	0	0	10
	Beta vulgaris	0	0	60
20	Lolium multiflorum	100	95	90
	Poa annua	100	100	90
	Echinochloa crus-galli	100	100	95

0 = sin daño
 100 = destrucción total

25

EJEMPLO 4

En el invernadero se tratan diferentes plantas teniendo una altura de crecimiento de 2 a 18 cm. con las sustancias activas

I a X. La cantidad de aplicación ascendió en cada caso a 3 kg por hectárea estando las sustancias activas en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 la de agua por hectárea. Al cabo de dos a tres semanas se comprobó que las sustancias activas I a IX mostraron una mejor compatibilidad con las plantas de cultivo y un mejor efecto herbicida que la sustancia activa X.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

	<u>sustancia activa</u>	I	II	III	IV	V	VI	VII
10	kg/ha.	3	3	3	3	3	3	3
	<u>plantas útiles</u>							
	Brassica napus	5	0	0	0	0	5	5
	Beta vulgaris	0	5	5	5	5	5	5
	<u>plantas indeseadas</u>							
15	Lolium multiriorum	75	80	80	75	80	80	75
	Poa annua	75	75	80	75	80	85	80
	Echinochloa crus-galli	75	75	75	75	75	85	80
	Sinapis arvensis	75	65	70	70	70	75	70
	Polygonum persicaria	85	75	70	65	70	75	70
20	Matricaria chamomilla	80	70	75	70	75	75	70
	Chenopodium album	80	70	80	70	75	70	75

	<u>sustancia activa</u>	VIII	IX	X	
	kg/ha	3	3	3	
	Brassica napus	0	0	30	
	Beta vulgaris	0	0	20	
5	Lolium multiflorum	90	80	45	
	Poa annua	80	80	50	
	Echinochloa crus-galli	90	80	40	
	Sinapis arvensis	60	60	20	
	Polygonum persicaria	-	-	10	
10	Matricaria chamomilla	-	-	55	0 = sin daño
	Chenopodium album	-	-	55	100 = destrucción total

Los siguientes compuestos mostraron, en ensayos análogos a los ejemplos 3 y 4, una eficiencia biológica correspondiente:

- 15 2,6-dietilanilida de ácido N-metoximetil-O-isopropilamino-sulfonil-glicólico
- 2,6-diisopropilanilida de ácido N-metoximetil-O-etilamino-sulfonil-glicólico
- 2,6-diisopropilanilida de ácido N-metoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico
- 20 2,6-dimetilanilida de ácido N-metoximetil-O-metilamino-sulfonil-glicólico
- 2,6-dimetilanilida de ácido N-n-propoximetil-O-etilaminosul-

fonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-n-propoximetil-O-isopropil-aminosulfonil-glicólico

5 2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-etilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-isopropoximetil-O-isopropilaminosulfonil-glicólico

EJEMPLO 5

10 90 partes en peso de compuesto I se mezclan con 10 partes en peso de N-metil- γ -pirrolidona obteniendo así una solución apropiada para ser aplicada en forma de gotas minúsculas.

EJEMPLO 6

15 20 partes en peso del compuesto II se disuelven en una mezcla que se compone de 80 partes en peso de xilol, 10 partes en peso del producto de adición de 8 a 10 moles de óxido de etileno a 1 mol de N-monoetanolamida de ácido oléico, 5 partes en peso de la sal cálcica del ácido dodecibencenosulfónico y 5 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Vertiendo y
20 distribuyendo la solución finamente en 100 000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

EJEMPLO 7

20 partes en peso del compuesto III se disuelven en una mezcla compuesta de 40 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 20 partes en peso del producto de adición de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol y 10 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Vertiendo y distribuyendo finamente la solución en 100 000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

EJEMPLO 8

20 partes en peso del compuesto IV se disuelven en una mezcla compuesta de 25 partes en peso de ciclohexanol, 65 partes en peso de una fracción de aceite mineral del punto de ebullición 210 hasta 280°C y 10 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Vertiendo y distribuyendo finamente la solución en 100 000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

EJEMPLO 9

20 partes en peso de la sustancia activa I se mezclan bien con 3 partes en peso de la sal sódica del ácido diisobutil-naftalin- α -sulfónico, 17 partes en peso de la sal sódica de un ácido ligninosulfónico de una lejía residual sulfítica y 60 partes en peso de silicagel pulverulento y se molturan en un molino de martillos. Distribuyendo finamente la mezcla en 20 000 partes en peso de agua se obtiene un caldo pulverizable que contiene un 0,1 por ciento en peso de la sustancia activa.

EJEMPLO 10

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

EJEMPLO 11

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

EJEMPLO 12

En el invernadero se llenan tiesto experimentales con tierra arenosa y arcillosa y se siembran diferentes semillas. Inmediatamente después se trata con las sustancias activas

- 5 XI 2-metil-6-etil-anilida de ácido N-etoximetil-O-metil-aminosulfonil-glicólico
- XII 2-metil-6-etil-anilida de ácido N-etoximetil-O-etil-aminosulfonil-glicólico
- XIII 2-metil-6-etil-anilida de ácido N-etoximetil-O-dimetil-aminosulfonil-glicólico
- 10 XIV 2-metil-6-etil-anilida de ácido N-etoximetil-O-metil-etil-aminosulfonil-glicólico
- XV 2-metil-6-etil-anilida de ácido N-etoximetil-O-diethyl-aminosulfonil-glicólico
- 15 XVI 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico

en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea. La cantidad de aplicación ascendió en cada caso a 3 kg/ha de sustancia activa.

- 20 Al cabo de 4 a 5 semanas se comprobó que las sustancias activas XI - XVI mostraron una buena compatibilidad con las plantas de cultivo y un fuerte efecto herbicida.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente.

sustancia activa kg/ha	XI	XII	XIII	XIV	XV	XVI
	3	3	3	3	3	3
<u>plantas útiles:</u>						
Sinapis alba	0	0	0	0	0	0
<u>plantas indeseadas:</u>						
5 Echinochloa crus galli	95	95	95	100	100	90
Lolium multiflorum	90	90	95	95	100	95

Tienen la misma eficiencia biológica los compuestos:

10 2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-etilamino-sulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-n-propilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-sec.-butoximetil-O-i-propilaminosulfonil-glicólico

15 2,6-dimetilanilida de ácido N-iso-butoximetil-O-metilaminosulfonil-glicólico

2,6-dimetilanilida de ácido N-iso-butoximetil-O-dimetilaminosulfonil-glicólico

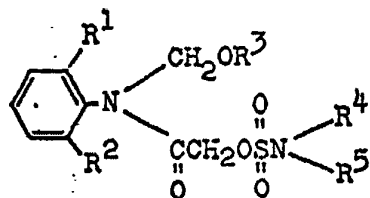
N O T A.-

20 Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarse 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, bajo el No.P 24 17 746.8

25 de 11 abril 1974, 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 so-

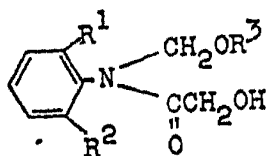
licita Patente de Invención por 20 años en España, sobre:
PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE ANILIDAS DE ACIDO O-AMI
NOSULFONIL-GLICOLICO, caracterizándose por lo siguiente:

1. Procedimiento para la obtención de una anilidas de ácido
5 O-aminosulfonil-glicólico de la fórmula general

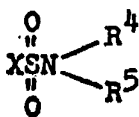


10 en la que R¹ y R² significan grupos alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, R³ es un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxialquilo, alquilo halogenado, alquenoilo, alquenoilo halogenado, alquinilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo, R⁴ y R⁵ representan hidrógeno, alquilo, alquilo halogenado, cicloalquilo, alquenoilo, alquenoilo halogenado; alquinilo o aralquilo, caracterizado porque se hace reaccionar una anilida de ácido glicólico de la fórmula general

15



en la que R¹, R² y R³ tienen los significados arriba indicados, con un haluro de aminosulfonilo de la fórmula general



en la que R⁴ y R⁵ tienen los significados arriba indicados
e X representa un halógeno.

- 5 2. Procedimiento para la obtención de anilidas de ácido O-amino sulfónil-aglicólico, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente memoria.

Esta Memoria consta de 50 hojas escritas a máquina por una sola cara

Madrid, 30 JUL. 1975

BASF AKTIENGESELLSCHAFT.

I. GOMEZ ACEBO Y LOPEZ
p. p. Firmador J. Suarez Diaz

Jesús Suárez