

3-38-71A

PATENTE DE INVENCION

O.Z. 30 627

**CONCEDIDA**

*Memoria Descriptiva* 23 SET. 1976

*sobre:*

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE 2,2-DIOXIDOS DE  
1H-(PIRIDINO-[3,2-e]-2,1,3-TIADIAZIN-(4)-ONA).

*Solicitante:* BASF AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana, resi-  
dente en 6700 Ludwigshafen, República Federal  
Alemana.

Int. Cl.  
C04D 93/28, A01N 5/00

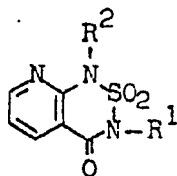
- 1 -

La presente invención se refiere a nuevos y valiosos 2,2-  
 dióxidos de piridino-[3,2-e]-2,1,3-tiadiazin-(4)-ona  
 sustituidos con efecto herbicida, herbicidas conteniendo  
 estas sustancias activas, un procedimiento para combatir  
 5 el crecimiento de plantas indeseadas con estos compuestos  
 y un procedimiento para su obtención.

Es conocido el utilizar el 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-  
 benzotiadiazin-(4)-ona como herbicida. Sin embargo, su apli-  
 cación en la práctica trae consigo daños en las plantas  
 10 útiles.

Se ha encontrado, ahora, que tienen una mejor compatibilidad  
 con las plantas de cultivo y el mismo efecto herbicida,  
 especialmente sobre malezas, que la sustancia activa conoci-  
 da los compuestos de la fórmula general III

15



III

en la que R<sup>1</sup> significa hidrógeno, un radical alifático con  
 hasta 10 átomos de carbono, un radical cicloalifático con 3

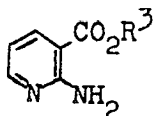
- 2 -

5 a 7 átomos de carbono, un radical alifático ramificado con 3 a 10 átomos de carbono o un radical alquilo sustituido por halógeno con 2 a 10 átomos de carbono y  $R^2$  es hidrógeno, un átomo de metal o un ión de amonio en caso dado sustituido.

10  $R^1$  puede significar, entre otros: metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec.-butilo, pentilo, ciclo-pentilo, hexilo, ciclohexilo, 3-pentilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,3-dimetilbutilo, 2-cloroetilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2-cloroisopropilo, 1-clorometilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, 1,2,2,-trimetilpropilo, 1,2-dimetilhexilo, 1-ciclohexiletilo, 2-clorobutilo-3, 2-cloro-2-metilpropilo, 2-fluorobutilo-3, 2-fluoro-2-metilpropilo, 2-fluoroisopropilo, terc.-butilo, terc.-amilo, cloro-terc.-butilo.

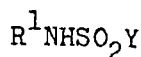
15  $R^2$  puede significar, entre otros, hidrógeno, litio, sodio, potasio, magnesio, calcio, cinc, cobre, amonio, metilamónio, etilamónio, isopropilamónio, dimetilamónio, dietilamónio, trimetilamónio, etanolamónio, dietanolamónio.

20 Los nuevos compuestos pueden obtenerse, por ejemplo, en la siguiente forma: Se hace reaccionar un éster de ácido carboxílico de fórmula



I

en la que R significa un radical alquilo inferior con un haluro de aminosulfonilo de fórmula



II

5 en la que R<sup>1</sup> tiene los significados arriba mencionados e Y es un átomo de halógeno, en un margen de temperatura de 10 a 100°C en un disolvente orgánico inerte en presencia de una base auxiliar terciaria, y se calienta, luego, la mezcla de reacción en presencia de una base alcohólica. Pa-  
10 ra calentar con el alcoholato se escoge un margen de temperatura de entre 10 y 100°C, preferentemente 50 y 80°C.

Las sustancias de partida I se pueden hacer reaccionar con las sustancias de partida II en cantidades estequiométricas o en un exceso en haluro de aminosulfonilo II, preferentemen-  
15 te en una proporción de 1,1 a 1,8 moles de haluro de alquil-amino-sulfonilo II por mol de éster carboxílico I.

Las sustancias de partida I y II son conocidas. Como sustan-  
cia de partida A se utiliza preferentemente, el metil, etil, n-propil, isopropil, n-butil-sec.-butil y isobutiléster del  
20 ácido aminonicotínico. Como sustancia de partida II entran en consideración, por ejemplo, los siguientes haluros de

aminosulfonilo: cloruro de amidosulfonilo, cloruro de metil,  
etil, n-propil, isopropil, n-butil, sec.-butil, isobutil,  
pentil, ciclopentil, hexil, ciclohexil, 3-pentil, 1,2-di-  
metil-1; 1,3-dimetilbutil-1, 2-cloroetil, 2-cloropropil,  
5 3-cloropropil,  $\beta$ -clbroisopropil, 1-clorometilpropil-1,  
1-etil-2-metilpropil-1, 1,2,2-trimetilpropil-1, 1,2-dimetil-  
hexil-1, 1-ciclohexil-etil-1, 2-clorobutil-3, 2-cloro-2-  
metil-propil-1, 2-fluorobutil-3, 2-fluoro-2-metilpropil-1,  
 $\beta$ -fluoroisopropil, terc.-butil, terc.-amil y cloro-terc.-  
10 butilaminosulfonilo.

Como base auxiliar terciaria se presta, por ejemplo, la  
trimetilamina, la trietilamina, la piridina, la  $\alpha$ ,  $\beta$ ,  $\gamma$ -  
picolina, la lutidina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-  
ciclohexilamina, la quinolina, la isoquinolina, la quinazo-  
15 lina, la tri-n-butilamina, la tri-n-propilamina y la N-  
propil-diisopropilamina.

Como disolventes orgánicos inertes se puede emplear benceno,  
tolueno, clorobenceno, petroléter, heptano; hexano, ciclo-  
hexano, hidrocarburos halogenados, tales como cloruro meti-  
20 lénico, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,1 y 1,2-  
dicloroetano, 1,1,2-tricloroetano, 1,1,2,2, y 1,1,1,2-tetra-  
cloroetano, carbonamidas sustituidas, tabs como N-metil y

N,N-dimetilformamida, cetonas, tales como acetona, acetofenona, ciclohexanona, ésteres, tales como metilacetato, isobutilacetato, éteres, tales como dietil, di-n-propiléter, dioxano, tetrahidrofurano y nitrilos, tales como acetonitrilo, isobutironitrilo y benzonitrilo.

Como bases alcohólicas se prestan los alcoholatos alcalinos, tales como las del alcohol metílico, etílico, n-propílico, isopropílico, n-butílico, sec.-butílico, isobutílico y terc.-butílico, por ejemplo, metilato sódico.

10 La cantidad de la base alcohólica asciende, convenientemente, a 2 veces la cantidad del equivalente de las sustancias de partida I. En una forma especialmente ventajosa del procedimiento conforme a la invención se calienta la mezcla de reacción obtenida después de la reacción de las sustancias de partida I con las sustancias de partida II, directamente y sin separar el hidrocloreuro de la base orgánica terciaria, en presencia de 2 a 4 veces la cantidad de base alcohólica, referido a la sustancia de partida I. La elaboración se lleva a cabo en forma usual concentrando la solución alcalina al vacío o bien diluyéndola con agua, acidificándola y filtrando la sustancia precipitada por succión.

La síntesis de las sustancias activas se ilustrará a base de los siguientes ejemplos de preparación.

EJEMPLO 1

5 2,2-dióxido de 3-sec.-butil-1H-(piridino[3,2-e]-2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)

A una solución de 22,8 partes (partes en peso) de metil-éster de ácido 2-aminonicotínico en 230 partes de cloroformo se introducen bajo agitación dentro de 15 minutos, a 20 a 25°C, a la vez 28,3 partes de cloruro de sec.-butilaminosul-  
10 fonilo y 16,7 partes de trietilamina. La mezcla de reacción se agita por media hora a 50 a 60°C. Después de enfriar a 15°C se introducen nuevamente en el curso de 15 minutos 11 partes de cloruro de sec.-butilaminosulfonilo y 6,5 partes de trietilamina. La mezcla de reacción se agita por me-  
15 dia hora a temperatura ambiente y por 3 horas a 50 a 60°C. Después de eliminar el disolvente al vacío se disuelve el residuo en 240 partes de metanol y se mezcla con 72 partes de una solución de metilato sódico al 30 % (por ciento en peso) en metanol a temperatura ambiente. Ahora, se agita la  
20 mezcla de reacción por 3 horas bajo calentamiento a reflujo. Después de eliminar el disolvente al vacío se disuelve en agua helada y se acidifica con ácido sulfúrico 1 nor-

mal a ~pH 2. La sustancia precipitada se filtra por succión y se lava con agua, obteniéndose 32,1 partes (84 % de la teoría) de 2,2-dióxido de 3-sec.-butil-1H-(piridino- $\square$ 3,2- $\square$ 7-2,1,3-tiadiazin-(4)-ona) como polvo incoloro con p.f. 202 a 211°C, descomp.

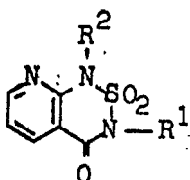
EJEMPLO 2

Sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-(piridino- $\square$ 3,2- $\square$ 7-2,1,3-tiadiazin-(4)-óna)


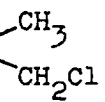


---

10 A una solución de 5,7 partes de 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino- $\square$ 3,2- $\square$ 7-2,1,3-tiadiazin-(4)-óna) en 65 partes de metanol se añaden 4,27 partes de una solución de metilato sódico al 30 % en metanol. Después de eliminar el disolvente al vacío se obtienen 6,1 partes de la sal sódica deseada (98 % de la teoría) con p.f. 268°C descomp.



15 En la misma forma se obtienen los siguientes compuestos:



|    | $R^1$  | $R^2$ | p. f. ( $^{\circ}C$ ) |
|----|--|-------|-----------------------|
|    | H  | H     |                       |
|    | CH <sub>3</sub>  | H     | 270-279               |
| 5  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H     | 241-247               |
|    | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                                      | H     | 205-212 descomp.      |
|    | 1-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                                      | H     | 197-206 descomp.      |
|    | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | H     | 173-178               |
|    | 1-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | H     |                       |
| 10 | tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                  | H     |                       |
|    | n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>                                     | H     |                       |
|    | -CH $\begin{matrix} \diagup C_2H_5 \\ \diagdown C_2H_5 \end{matrix}$ | H     | 192-198 descomp.      |
|    |  | H     |                       |

|    | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | n.f. (°C) |
|----|--|----------------|-----------|
|    | n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>   | H              |           |
|    |   | H              |           |
|    | -CH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub><br> <br>CH <sub>3</sub><br> <br>H  | H              |           |
| 5  | -C-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub><br> <br>CH <sub>3</sub>  | H              |           |
|    | CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl  | H              |           |
|    | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl  | H              |           |
|    | -CH <sub>2</sub> -CH-CH <sub>3</sub><br> <br>Cl  | H              |           |
|    | -CH-   | H              |           |
| 10 | -CH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub><br> <br>CH <sub>2</sub> Cl  | H              |           |
|    | -CH-CH-CH <sub>3</sub><br>       <br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>   | H              |           |
|    | H     CH <sub>3</sub><br>       <br>-C - C-CH <sub>3</sub><br>       <br>CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>                               | H              |           |
|    | -CH-CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub><br>       <br>CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>                                   | H              |           |
|    | H<br> <br>-C- <br> <br>CH <sub>3</sub>              | H              |           |
| 15 | -CH- <br>       <br>CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> | H              |           |

|    | $R^1$  | $R^2$   | $d.f. (^{\circ}C)$ |
|----|--|---|--------------------|
|    | $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}_2-\text{C}-\text{Cl} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$                         | H   |                    |
|    | $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}-\text{CH}-\text{F} \\   \quad   \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$ | H   |                    |
|    | $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}_2-\text{C}-\text{F} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$                          | H   |                    |
| 5  | $-\text{CH} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$   | H   |                    |
|    | $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$   | H   |                    |
|    | $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}_2\text{H}_5$   | H   |                    |
|    | $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{Cl}$   | H   |                    |
|    | $\text{CH}_3$  | Na  | 300                |
| 10 | $\text{C}_2\text{H}_5$   | Na  | 300 descomp.       |
|    | $-\text{n}-\text{C}_3\text{H}_7$   | Na  |                    |
|    | $-\text{n}-\text{C}_3\text{H}_7$   | $\text{H}_3\overset{\oplus}{\text{N}}\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ | 134-135            |
|    | $-\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7$   | K   | 268 descomp.       |
|    | $-\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7$   | $\overset{\oplus}{\text{N}}\text{H}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ | 143-147            |
| 15 | $-\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7$   | $\text{H}_3\overset{\oplus}{\text{N}}\text{CH}(\text{CH}_3)_2$        |                    |
|    | $-\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7$   | $\text{H}_2\overset{\oplus}{\text{N}}(\text{CH}_3)_2$                 |                    |
|    | $\text{n}-\text{C}_4\text{H}_9$  | Na  | 265-269 descomp.   |
|    | $\text{sec.}-\text{C}_4\text{H}_9$   | Na  |                    |
|    | $\text{sec.}-\text{C}_4\text{H}_9$   | $\text{H}_2\overset{\oplus}{\text{N}}(\text{CH}_3)_2$                 | 93-95              |

| R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | p.f.(°C)         |
|---|----------------|------------------|
|    | Na             |                  |
|    | K              |                  |
| $\begin{array}{l} \text{-CH} \\ \text{ } \end{array} \begin{array}{l} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$   | Na             | 190-210 descomp. |
| 5 $\begin{array}{l} \text{-CH} \\ \text{ } \end{array} \begin{array}{l} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$ | Ca/2           |                  |

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.

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

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

|                  |               |
|------------------|---------------|
| 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.                               |                     |
|    | 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.        |
|    | Galinsoga spp.             | Matricaria spp.      |
|    | Taraxacum spp.             | Argemisia spp.       |
| 5  | Chrysanthemum spp.         | etc.                 |
|    | Bidens spp.                |                      |
|    | Cirsium spp.               |                      |
|    | Convolvulaceae, tales como |                      |
|    | Convolvulus spp.           | Cuscuta spp.         |
| 10 | Ipomoea spp.               | etc.                 |
|    | Jaquemontia tamnifolia     |                      |
|    | Cruciferae, tales como     |                      |
|    | Barbarea vulgaris          | Arabidopsis thaliana |
|    | Brassica spp.              | Descurainia spp.     |
| 15 | Capsella spp.              | Draba spp.           |
|    | Sisymbrium spp.            | Coronopus didymus    |
|    | Thlaspi spp.               | Lepidium spp.        |
|    | Sinapis arvensis           | etc.                 |
|    | Raphanus spp.              |                      |
| 20 | Geraniaceae, tales como    |                      |
|    | Erodium spp.               | etc.                 |
|    | Geranium spp.              |                      |
|    | Portulacaceae, tales como  |                      |
|    | Portulaca spp.             | etc.                 |

- Primulaceae, tales como  
    Anagallis arvensis           etc.  
    Lysimachia spp.
- 5   Rubiaceae, tales como  
    Richardia spp.           Diodia spp.  
    Galium spp.           etc.
- Scrophulariaceae, tales como  
    Linaria spp.           Digitalis spp.  
    Veronica spp.
- 10   Solanaceae, tales como  
    Physalis spp.           Nicandra spp.  
    Solanum spp.           etc.  
    Datura spp.
- 15   Urticaceae, tales como  
    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 maius

|    |                            |                    |
|----|----------------------------|--------------------|
|    | 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                   |                    |
|    | 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   |                    |
|    | Amsinchia spp.             | Anchusa spp.       |
|    | Myostis spp.               | etc.               |
|    | Lithospermum spp.          |                    |

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

- 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.
- Los nuevos agentes pueden emplearse en cultivos de cereales,  
15 tales como  
Avena spp. Sorghum  
Triticum spp. Zea mays  
Hordeum spp. Panicum miliaceum  
Secale spp. Oryza spp.
- 20 y en cultivos de dicotiledóneas, tales como  
Cruciferae, por ejemplo  
Brassica spp. Raphanus spp.  
Sinapis spp. Lepidium spp.

- Compositae, por ejemplo  
Lactuca spp. Carthamus spp.  
Helianthus spp. Scorzonera spp.
- Malvaceae, por ejemplo  
5 Gossypium hirsutum
- Leguminosae, por ejemplo  
Medicago spp. Phaseolus spp.  
Trifolium spp. Arachis spp.  
Pisum spp. Glycine Max
- 10 Chenopodiaceae, por ejemplo  
Beta vulgaris  
Spinacia spp.
- Solanaceae, por ejemplo  
Solanum spp. Capsicum annum
- 15 Nicotiana spp.
- Linaceae, por ejemplo  
Linum spp.
- Umbelliferae, por ejemplo  
Petroselinum spp. Apium graveolens  
20 Daucus carota
- Rosaceae, por ejemplo  
Fragaria
- Cucurbitaceae, por ejemplo  
Cucumis spp. Cucurbita spp.

Liliaceae. por ejemplo

Allium spp.

Vitaceae, por ejemplo

Vitis vinifera

5 Bromeliaceae, por ejemplo

Ananas sativus

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

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

15 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.

20 La aplicación se efectúa, por ejemplo, en forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite, pastas, agentes de espolvoreo, de espar-

cimiento, 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  
5 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  
10 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,  
15 naftalinas alquiladas o sus derivados, por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol, cloroformo, tetracloruro de carbono, ciclohexanol, ciclohexanona, clorobenceno, isoforona etc., disolventes fuertemente polares, por ejemplo, dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirilidona,  
20 agua etc.

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 5 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.

10 Como sustancias tensioactivas sean mencionadas: sales alcalinas, alcalinotérreas, sales amónicas de ácido lignosulfónico, ácidos naftalinosulfónicos, ácidos fenosulfónicos, alquilanilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sales alcalinas y alcalinotérreas del ácido dibutilnaftalinosulfónico, sulfato de lauriléter, sulfatos de alcohol 15 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-octilfenol- 20 éter, isooctilfenol, octilfenol, nonilfenol etoxilados, alquilfenolpoliglicoléter, tributilfenilpoliglicoléter,

alcoholes de alquilarilpoliéter, alcohol de isotridecilo, condensados de óxido etilénico de alcohol graso, aceite de ricino etoxilado, polioxiétilenalquiléter, polioxiopropileno etoxilado, acetal de poliglicoléter de laurilalcohol, 5 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.

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 silicagel, ácidos silícicos, geles de silicio, silicatos, talco, caolín, attaclay, caliza, cal, tiza, talco, 15 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 20 de nuez, polvos de celulosa y otros soportes sólidos.

Las formulaciones contienen entre 0,1 y 95 % en peso de

sustancia activa, preferentemente entre 0,5 a 90 % 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
- 5 anilinas sustituidas,
- 10 ácidos ariloxicarboxílicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- ésteres sustituidos,
- 15 ácidos arsónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- bencimidazoles sustituidos,
- benzisotiazoles sustituidos,
- dióxidos de benztiadiazinona sustituidos,
- benzoxacinas sustituidas,
- 20 benzoxacinonas sustituidas,
- benztiadiazoles sustituidos,
- uretes sustituidos,
- quinolinas sustituidas,

- carbamatos sustituidos,
- ácidos carboxílicos alifáticos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- 5 ácidos carboxílicos aromáticos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- carbamoilalquiltiol o carbamoilalquilditiofosfatos sustituidos,
- quinazolinas sustituidas,
- 10 ácidos cicloalquilamidocarbotiólicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- cicloalquilcarbonamidotiazoles sustituidos,
- ácidos dicarboxílicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- 15 sulfonatos de dihidrobenzofuranilo sustituidos,
- disulfuros sustituidos,
- sales de dipiridilio sustituidas,
- ditiocarbamatos sustituidos,
- ácidos ditiofosfóricos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
- 20 ureas sustituidas,
- hexahidro-1-H-carbotioatos sustituidos,
- hidantoínas sustituidas,
- sales de hidrazonio sustituidas,
- hidracidas sustituidas.

- isooxazolpirimidonas sustituidas,  
imidazoles sustituidos,  
isotiazolpirimidonas sustituidas,  
cetonas sustituidas,  
5 naftoquinonas sustituidas,  
nitrilos alifaticos sustituidos,  
nitrilos aromaticos sustituidos,  
oxadiazoles sustituidos,  
oxadiazinonas sustituidas,  
10 oxadiazolidindionas sustituidas,  
oxadiazindionas sustituidas,  
fenoles sustituidos, así como sus sales y ésteres,  
ácidos fosfónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres  
y amidas,  
15 cloruros fosfónicos sustituidos,  
fosfonalquilglicinas sustituidas,  
fosfitas sustituidas,  
amidas de ácido tiocarboxílico aromáticas sustituidas,  
ácidos tiocarboxílicos sustituidos, así como sus sales,  
20 ésteres y amidas,  
tiolcarbamatos sustituidos,  
tioureas sustituidas,  
ácidos tiofosfóricos sustituidos, así como sus sales,  
ésteres y amidas,

triazinas sustituidas,  
triazoles sustituidos,  
uracilos sustituidos,  
uretindionas sustituidas;

- 5 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.

10 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, antidotos y reguladores del crecimiento.

### EJEMPLO 3

- 15 En el invernadero se tratan las plantas algodón (*Gossypium hirsutum*) y *Sinapis arvensis* cuando tenían una altura de crecimiento de 4 a 20 cm con, en cada caso, 1 kg/ha de la sustancia activa I 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino- $\int$ 3,2-e $\int$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona) en comparación  
20 con la sustancia activa II 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-(4)-ona, en cada caso dispersadas o

emulsionadas en 500 l de agua por hectárea. Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que la sustancia activa I mostró una mejor compatibilidad con las plantas de cultivo teniendo el mismo efecto herbicida que la sustancia activa II. El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente.

|                          | sustancia activa |     |
|--------------------------|------------------|-----|
|                          | I                | II  |
| kg/ha                    | 1                | 1   |
| <u>planta útil:</u>      |                  |     |
| Gossypium hirsutum       | 10               | 30  |
| <u>planta indeseada:</u> |                  |     |
| Sinapis arvensis         | 100              | 100 |

0 = sin daño  
100 = destrucción total

EJEMPLO 4

En el invernadero se tratan las plantas cebada (*Hordeum vulgare*), trigo (*Triticum aestivum*), maíz (*Zea mays*), soja (*Glycine max*), arroz (*Oryza sativa*), *Cyperus esculentus*, *Sinapis arvensis*, *Stellaria media*, *Matricaria chamomilla*, *Galium aparine* y *Solanum nigrum* cuando tenían una altura de crecimiento de 4 a 20 cm con 3 kg/ha de la sustancia activa I 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino-2,6-diil-2,1,3-tiadiazin(4)-ona) en comparación con la sustancia

activa II 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-  
 (4)-ona, en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l  
 de agua por hectárea. Al cabo de 2 a 3 semanas se compro-  
 bó que la sustancia activa I mostró una mejor compatibili-  
 5 dad con las plantas de cultivo teniendo el mismo efecto  
 herbicida que la sustancia activa II. El resultado del ex-  
 perimento se indica en la tabla siguiente.

|    | sustancia activa           | I   |
|----|----------------------------|-----|
|    | kg/ha                      | 3   |
| 10 | <u>plantas útiles:</u>     |     |
|    | Hordeum vulgare            | 0   |
|    | Triticum aestivum          | 0   |
|    | Zea mays                   | 0   |
|    | Glycine max                | 0   |
| 15 | Oryza sativa               | 0   |
|    | <u>plantas indeseadas:</u> |     |
|    | Cyperus esculentus         | 80  |
|    | Sinapis arvensis           | 100 |
|    | Stellaria media            | 100 |
| 20 | Matricaria chamomilla      | 100 |
|    | Galium aparine             | 90  |
|    | Solanum nigrum             | 80  |

0 = sin daño  
 100 = destrucción total

EJEMPLO 5

En el invernadero se tratan diferentes plantas teniendo una altura de crecimiento de 3 a 20 cm con las siguientes sustancias activas:

- 5     III    2,2-dióxido de 3-n-propil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- IV    sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- V    sal de 1-potasio de 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- 10     VI    sal 1-etanolamónica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- VII   2,2-dióxido de 3-metil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- 15     VIII   sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-metil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- IX    2,2-dióxido de 3-etil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- X    2,2-dióxido de 3-sec.-butil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- 20     XI    sal 1-dimetilamínica de 2,2-dióxido de 3-sec.-butil-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)
- XII   2,2-dióxido de 3-(3'-pentil)-1H-(piridino- $\sphericalangle$ 3,2-e $\sphericalangle$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona)

25     en cada caso dispersadas, emulsionadas o como solución acuosa

sa en 500 l de agua por hectárea.

Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas tuvieron una muy buena compatibilidad con las plantas de cultivo y un buen efecto herbicida.

5 El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente.

| sustancia activa<br>kg/ha a.S. | III | IV  | V   | VI  | VII | VIII | IX  | X   | XI  | XII |
|--------------------------------|-----|-----|-----|-----|-----|------|-----|-----|-----|-----|
|                                | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 2,0  | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 |
| <u>Plantas tiles</u>           |     |     |     |     |     |      |     |     |     |     |
| Hordeum vulgare                | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Triticum aestivum              | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Secale cereale                 | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Oryza sativa                   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Zea mays                       | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Glycine max                    | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| <u>plantas indeseadas</u>      |     |     |     |     |     |      |     |     |     |     |
| Cyperus esculentus             | 75  | 80  | 80  | 80  | 80  | 75   | 70  | 70  | 70  | 75  |
| Sinapis arvensis               | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100  | 100 | 100 | 100 | 100 |
| Xanthium pensylvanicum         | 85  | 90  | 90  | 90  | 90  | 80   | 75  | 80  | 75  | 80  |

0 = sin daño

100 = destrucción total

| sustancia activa          | III | IV  | V   | VI  | VII | VIII |
|---------------------------|-----|-----|-----|-----|-----|------|
| kg/ha a.S.                | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0  |
| <u>plantas útiles</u>     |     |     |     |     |     |      |
| Hordeum vulgare           | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    |
| Triticum aestivum         | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    |
| Secale cereale            | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    |
| Oryza sativa              | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    |
| Zea mays                  | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    |
| Glycine max               | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    |
| <u>plantas indeseadas</u> |     |     |     |     |     |      |
| Cyperus esculentus        | 75  | 80  | 80  | 80  | 80  | 75   |
| Sinapis arvensis          | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100  |
| Xanthium pensylvanicum    | 85  | 90  | 90  | 90  | 90  | 80   |

0 = sin daño

100 = destrucción total

0.2. 30 627

| VIII | IX  | X   | XI  | XII |
|------|-----|-----|-----|-----|
| 3,0  | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 |

|   |   |   |   |   |
|---|---|---|---|---|
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

|     |     |     |     |     |
|-----|-----|-----|-----|-----|
| 75  | 70  | 70  | 70  | 75  |
| 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 80  | 75  | 80  | 75  | 80  |

EJEMPLO 6

5 En el invernadero se llenan tiestos experimentales con tierra arenosa y arcillosa y se siembran las semillas de avena (*Avena sativa*), cebada (*Hordeum vulgare*), centeno (5 *Secale cereale*), trigo (*Triticum aestivum*), arroz (*Oryza sativa*), algodón (*Gossypium hirsutum*), y *Sinapis arvensis*. Inmediatamente después se trata con 3 kg/ha de sustancia activa I 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-(piridino- $\left[3,2-e\right]$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona), dispersada o emulsio-  
10 nada en 500 l de agua por hectárea. Al cabo de 4 a 5 semanas se comprobó que la sustancia activa I tuvo una muy buena compatibilidad con las plantas de cultivo y un buen efecto herbicida. El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente.

0.2. 30 627

- 33 -

| sustancia activa          | I   | III | IV  | V   | VI  | VII | VIII | IX  | X   | XI  | XII |
|---------------------------|-----|-----|-----|-----|-----|-----|------|-----|-----|-----|-----|
| kg/ha                     | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0  | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 |
| <u>plantas útiles</u>     |     |     |     |     |     |     |      |     |     |     |     |
| Avena sativa              | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Hordeum vulgare           | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Secale cereale            | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Triticum aestivum         | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Oryza sativa              | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Gossypium hirsutum        | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0    | 0   | 0   | 0   | 0   |
| <u>plantas indeseadas</u> |     |     |     |     |     |     |      |     |     |     |     |
| Sinapis arvensis          | 100 | 95  | 100 | 100 | 95  | 70  | 95   | 95  | 90  | 75  | 85  |

0 = sin daño  
100 = destrucción total

| sustancia activa          | I   | III | IV  | V   | VI  | VII |
|---------------------------|-----|-----|-----|-----|-----|-----|
| kg/ha                     | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 | 3,0 |
| <u>plantas útiles</u>     |     |     |     |     |     |     |
| Avena sativa              | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Hordeum vulgare           | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Secale cereale            | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Triticum aestivum         | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Oryza sativa              | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   |
| Gossypium hirsutum        | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   | 0   |
| <u>plantas indeseadas</u> |     |     |     |     |     |     |
| Sinapis arvensis          | 100 | 95  | 100 | 100 | 95  | 70  |

0 = sin daño

100 = destrucción total

0.2. 30 627

| VII        | VIII       | IX         | X          | XI         | XII        |
|------------|------------|------------|------------|------------|------------|
| <u>3,0</u> | <u>3,0</u> | <u>3,0</u> | <u>3,0</u> | <u>3,0</u> | <u>3,0</u> |

|   |   |   |   |   |   |
|---|---|---|---|---|---|
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

|    |    |    |    |    |    |
|----|----|----|----|----|----|
| 70 | 95 | 95 | 90 | 75 | 85 |
|----|----|----|----|----|----|

EJEMPLO 7

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

5

EJEMPLO 8

20 partes en peso del compuesto del ejemplo 1 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 dodecylbencenosulfónico 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 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.

10

15

EJEMPLO 9

20 partes en peso del compuesto I 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

20

5 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 finalmente la solución en 100 000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa que contiene un 0,02 por ciento en peso de la sustancia activa.

EJEMPLO 10

10 20 partes en peso del compuesto del ejemplo 1 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 11

20 20 partes en peso de la sustancia activa I se mezclan bien con 3 partes en peso de la sal sódica del ácido diisobutilnaftalin- $\alpha$ -sulfónico, 17 partes en peso de la sal sódica de un ácido ligninosulfónico de una lejía residual sulfúrica y 60 partes en peso de silicagel pulverulento.

y se 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.

5

EJEMPLO 12

3 partes en peso del compuesto del ejemplo 1 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.

10

EJEMPLO 13

30 partes en peso del compuesto del ejemplo 2 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.

15

EJEMPLO 14

En el invernadero se tratan diferentes plantas teniendo una altura de crecimiento de 3 a 20 cm con las siguientes sustancias activas:

20

- XIV 2,2-dióxido de 3-sec.-butil-1H-(piridino- $\left[ \begin{smallmatrix} 3,2-e \\ 2,1,3 \end{smallmatrix} \right]$ -tiadiazin-(4)-ona)
- XV sal sódica de 2,2-dióxido de 3-sec.-butil-1H-(piridino- $\left[ \begin{smallmatrix} 3,2-e \\ 2,1,3 \end{smallmatrix} \right]$ -tiadiazin-(4)-ona)
- 5 XVI sal sódica de 2,2-dióxido de 3-etil-1H-(piridino- $\left[ \begin{smallmatrix} 3,2-e \\ 2,1,3 \end{smallmatrix} \right]$ -tiadiazin-(4)-ona)
- XVII sal etanolamínica de 2,2-dióxido de 3-n-propil-1H-(piridino- $\left[ \begin{smallmatrix} 3,2-e \\ 2,1,3 \end{smallmatrix} \right]$ -tiadiazin-(4)-ona)
- 10 XVIII sal sódica de 2,2-dióxido de 3- $\alpha$ -etilpropil-1H-(piridino- $\left[ \begin{smallmatrix} 2,1,3 \end{smallmatrix} \right]$ -tiadiazin-(4)-ona)

en cada caso dispersadas, emulsionadas o como solución acuosa en 500 l de agua por hectárea.

Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas tuvieron una muy buena compatibilidad con las plantas de cultivo y un buen efecto herbicida.

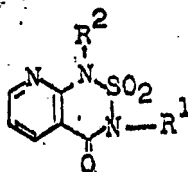
El resultado del experimento se indica en la siguiente tabla.

| sustancia activa | kg/ha<br>a.S. | plantas útiles |                      | plantas<br>indeseadas |
|------------------|---------------|----------------|----------------------|-----------------------|
|                  |               | Avena sativa   | Triticum<br>aestivum | Sinapis<br>arvensis   |
| XIV              | 3             | 0              | 0                    | 100                   |
| XV               | 3             | 0              | 0                    | 100                   |
| XVI              | 3             | 0              | 0                    | 100                   |
| XVII             | 3             | 0              | 0                    | 100                   |
| XVIII            | 3             | 0              | 0                    | 100                   |

NOTA.-

5 Describa suficientemente la naturaleza del inven-  
to, así como la manera de realizarse en la práctica, debe  
hacerse constar que las disposiciones anteriormente indica-  
das son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto  
10 no alteren su principio fundamental. También se hace constar  
que el invento corresponde a una solicitud de Patente presen-  
tada en Alemania, bajo el No. P. 24 30 353.5 de fecha 25 de  
Junio de 1974, acogiéndose por lo tanto a los beneficios que  
15 conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo  
que constituye la esencia del referido invento y, por lo que  
se solicite Patente de Invención por 20 años en España sobre:  
PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE 2,2-DIOXIDOS DE 1H-(PIRI-  
DINO- $\sqrt{3,2-e}$ -2,1,3-TIADIAZIN-(4)-ONA); caracterizándose por  
lo siguiente:

1.- Procedimiento para la obtención de 2,2-dióxido-  
dos de 1H-(piridino- $\sqrt{3,2-e}$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona) sustitui-  
dos de fórmula



20 en la que R<sup>1</sup> significa hidrógeno, un radical alifático con  
hasta 10 átomos de carbono, un radical cicloalifático con 3  
a 7 átomos de carbono, un radical alifático ramificado con  
3 a 10 átomos de carbono o un radical alquilo sustituido por

halógeno con 2 a 10 átomos de carbono y R<sup>3</sup> es hidrógeno, un átomo de metal o un radical amonio en caso dado sustituido, caracterizado porque se hace reaccionar un éster de ácido 2-aminonicotínico con un haluro de aminosulfonilo sustituido de fórmula

5



En la que R<sup>1</sup> tiene los significados arriba mencionados e Y representa un átomo de halógeno, en un disolvente orgánico inerte en un margen de temperatura de 10 a 100°C en presencia de una base auxiliar terciaria, y se calienta, a continuación en presencia de una base alcohólica.

10

2.- Procedimiento para la obtención de 2,2-dióxidos de 1H-(piridino- $\sqrt{3,2-e7}$ -2,1,3-tiadiazin-(4)-ona), tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

15

Esta Memoria consta de 39 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 24 JUN. 1975

BASF AKTIENGESELLSCHAFT.

L. GOMEZ ACEVES Y MUÑOZ  
p. Firmado: L. Gaeta Fernández

