

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ESPAÑA

19 ES	21	NUMERO	10 AI
	21	441.068	
	22	FECHA DE PRESENTACION	
		18.9.75	

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES	32 FECHA	33 PAIS
31 NUMERO		
P 24 44 822.4	19 de septiembre de 1.974	Alemania

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	63 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	CO7D/A01N	

24 TITULO DE LA INVENCION
PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN 2,2-DIOXIDO DE 2,1, 3-BENZO TIADIAZIN (4) ONA SUSTITUIDO.

71 SOLICITANTE (S)
BASF AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana.

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
6700 Ludwigshafen, República Federal Alemana.

72 INVENTOR (ES)
Dr. ADOLF ZEIDLER, Dr. ADOLF FISCHER, Dr. GERHARD HAMPRECHT y Dr. PETER SCHMIDT.

73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE
D. Jaime Gómez-Acebo y Modet.,

BAD ORIGINAL

441068

PATENTE DE INVENCION

O.Z. 30 824.

Memoria Descriptiva

sobre:

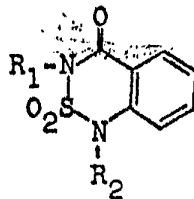
PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN 2,2-DIOXIDO
DE 2,1, 3-BENZOTIADIAZIN (4)ONA SUSTITUIDO.

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

La presente invención se refiere a un procedimiento para preparar nuevos y valiosos 2,2-dióxidos de 2,1,3-benzotiadiazin-(4)-ona con efecto herbicida.

Es conocido utilizar el 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
5 benzotiadiazin-(4)-ona como sustancia activa herbicida (memoria de patente alemana 1 542 836). Sin embargo, su empleo en la práctica conduce a daños en las plantas de cultivo tratadas.

Se ha encontrado que tienen un mejor efecto herbicida que la
10 sustancia activa conocida, los compuestos de la fórmula general



(XXV)

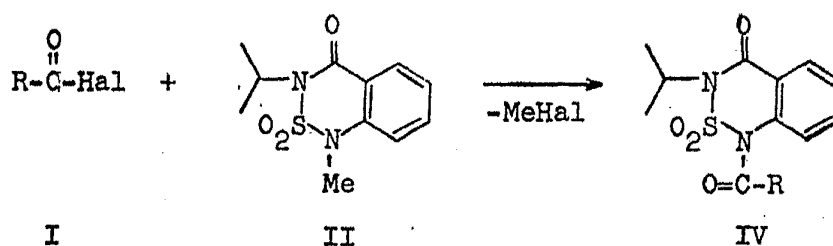
en la que R significa un grupo isopropilo y R² representa

- 5 a) un grupo formilo, un radical propionilo, n-butirilo, valerilo, isovalerilo, sec.-valerilo, capronilo, 1-(α -metilvalerilo), enantilo, un radical acilo con más de 8 átomos de carbono, un radical acilo sustituido por halógeno, el grupo acetoxi o alcoxi, un radical acilo en caso dado sustituido por halogenofenoxi y/o alquilfenoxi, un radical acilo insaturado, en caso dado sustituido por halógeno, un radical cicloacilo o diacilo, o
- 10 b) un radical alcoxi-carbonilo o alquilmercapto-carbonilo, un radical fenoxicarbonilo o fenilmercapto-carbonilo, en caso dado sustituido por grupos alcoxi, un radical bencilmercapto-carbonilo en caso dado sustituido por halógeno, o
- 15 c) un radical dialquilcarbamoilo en caso dado sustituido por grupos alcoxi, un radical dialquiltiocarbamoilo, un radical N-fenil-N',N'-dialquilformamidinilo, o
- d) un radical alquilsulfonilo o un radical arilsulfonilo en caso dado sustituido por átomos de halógeno, grupos nitro o grupos alquilo, o
- 20 e) un radical mono o dialquilsulfamoilo o
- f) un radical N-alquilbenzimidilo o
- g) un radical O,O-dialquil-fosforotioato o O,O-dialquilfosfato o
- 25 h) un radical alquilsulfonilo en caso dado sustituido por halógeno o
- i) un radical fenilo sustituido por grupos nitro.

R₂ puede significar entre otros: formilo, propionilo, n-butirilo, valerilo, isovalerilo, sec.-valerilo, capronilo, α -metilvalerilo, enantilo, pelargonilo, caprinilo, undecanoilo, dodecanoilo, tridecanoilo, tetradecanoilo, pentadecanoilo, palmitoilo, acetoxiacetilo, cloroacetilo, dicloroacetilo, α -cloropropionilo, α,α -dicloropropionilo, α -clorobutirilo, α -clorovalerilo, α -clorocapronilo, β -cloropropionilo, γ -bromobutirilo, acrililo, but-(2)-enoilo-1, pent-(3)-enoilo-1, metoxiacetilo, β -metoxipropionilo, γ -metoxibutirilo, ciclopentanoilo, ciclohexanoilo, benzoilo, α -naftoilo, o, m, p-bromobenzoilo, o,m,p-nitrobenzoilo, fenoxiacetilo, p-clorofenoxiacetilo, 2,4-diclorofenoxiacetilo, 2,4,5-triclorofenoxiacetilo, 2-metil-4-clorofenoxiacetilo, 2,4-diclorofenoxi- α -propionilo, oxalilo, malonilo, succinilo, glutarilo, adipoilo, decano(1,10)-dioilo, α -bromobutirilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, butoxicarbonilo, terc.-butoxicarbonilo, isobutoxicarbonilo, sec.-butoxicarbonilo, n-pentiloxicarbonilo, pentil(3)-oxicarbonilo, ciclopentiloxicarbonilo, n-hexiloxicarbonilo, ciclohexiloxicarbonilo, n-heptiloxicarbonilo, n-octiloxicarbonilo, n-noniloxicarbonilo, n-deciloxicarbonilo, undeciloxicarbonilo, dodeciloxicarbonilo, trideciloxicarbonilo, tetradeciloxicarbonilo, pentadeciloxicarbonilo, hexadeciloxicarbonilo, o-metoxifenoxicarbonilo, metilmercaptocarbonilo, etilmercaptocarbonilo, n-propilmercaptocarbonilo, isopropilmercaptocarbonilo, n-butilmercaptocarbonilo, p-clorobencilmercaptocarbonilo, fenilmercaptocarbonilo, p-metoxifenilmercaptocarbonilo, dimetilcarbamoilo, dietilcar-

bamoilo, di-n-propilcarbamoilo, diisopropilcarbamoilo, di-
n-butilcarbamoilo, di-sec.-butilcarbamoilo, N-metil-N-pro-
poximetilcarbamoilo, 1-piperidinoilo, hexahidro-1'-azepin-1'-
oilo, dimetiltiocarbamoilo, dietiltiocarbamoilo, di-n-propil-
5 tiocarbamoilo, diisopropiltiocarbamoilo, N-fenil-N,N-dimetil-
formamidinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfo-
nilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo, isobutilsulfo-
nilo, sec.-butilsulfonilo, n-pentilsulfonilo, bencenosulfoni-
lo, p-toluenosulfonilo, o,m,p-bromobencenosulfonilo, o, m,
10 p-nitrovenenosulfonilo, β -naftalinsulfonilo, dimetilsulfamoio-
lo, dietilsulfamoilo, di-n-propilsulfamoilo, metilaminosul-
fonilo, etilaminosulfonilo, n-propilaminosulfonilo, isopropil-
aminosulfonilo, n-butilaminosulfonilo, N-metilbenzimidilo, N-
etilbenzimidilo, N-propilbenzimidilo, O,O-dimetil-fosforotioa-
15 to, O,O-dietilfosforotioato, O,O-di-n-propilfosforotioato, O,O-
dimetilfosfatc, O,O-dietilfosfato, perclorometiltio, 2,4,6-
trinitrofenilo.

Los compuestos de la fórmula XXV en la que R₂ significa un ra-
dical acilo o arilo en caso dado sustituido pueden obtener-
20 se, por ejemplo, haciendo reaccionar una sal 1-alcalina (o al-
calinotérrea) o amónica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)-ona de la fórmula II con un haluro de acilo
I en un disolvente polar en un margen de temperatura de - 10
a + 110°C dentro de media hasta 12 horas,

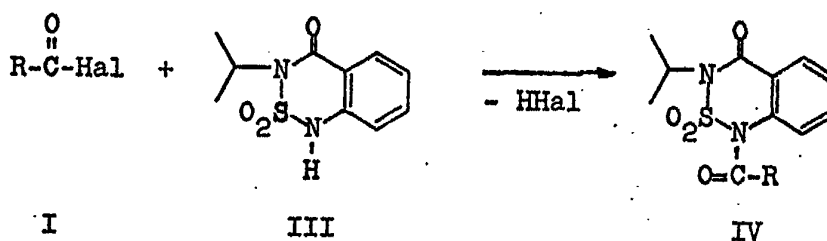


siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o térreo-
alcalino o un ión de amonio y Hal un átomo de cloro o bromo
y teniendo R-CO los significados para R indicados bajo a).

5 = isopropilo.

Para elaborar se separa, en caso dado, de la sal metálica o amó-
nica precipitada y se concentra al vacío. La purificación se
efectúa mediante recristalización o extracción con álcali
diluido y lavado con disolventes inmiscibles con agua. En el
10 último caso se aislan después de secar y concentrar la fase
orgánica los compuestos IV puros.

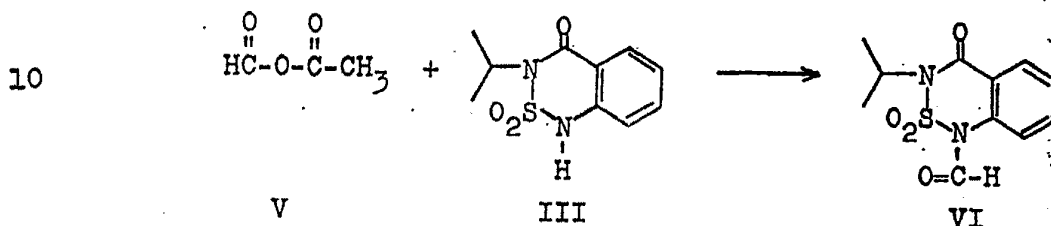
En lugar de la sustancia de partida II también se puede hacer
reaccionar de una vez la sustancia que la forma de la fórmula
III con un haluro de acilo I en presencia de una base terciaria
15 bajo las condiciones arriba indicadas,



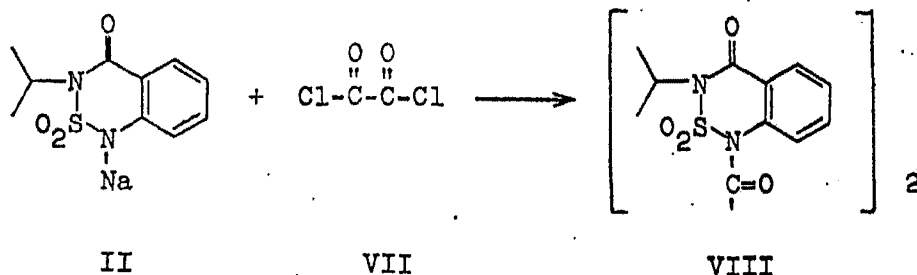
siendo Hal un átomo de cloro o bromo y teniendo R-CO- los significados arriba indicados para R₂ bajo a).

Se purifica en forma usual por extracción del hidrocloruro básico y elaboración según el método indicado.

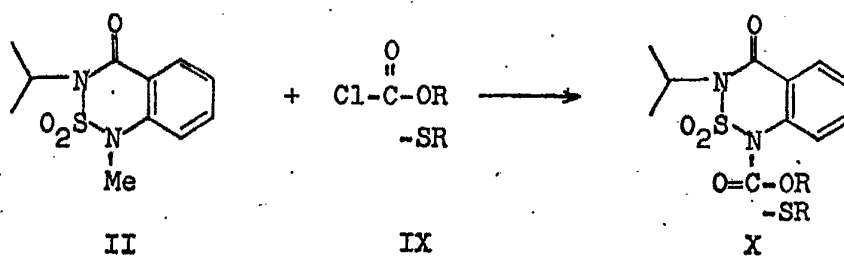
5 En caso de preparar el 2,2-dióxido de 1-formil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona VI se realiza la síntesis por reacción de la sustancia de partida III con el anhídrido de ácido fórmico-ácido acético mezclado V y se elabora según el método arriba indicado,



Haciendo reaccionar 2 equivalentes de la sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-(4)-ona II con un equivalente de cloruro de oxalilo VII como representante más simple de los haluros de diácilo inferiores según las condiciones de reacción arriba indicadas, se obtiene el compuesto de la fórmula VIII

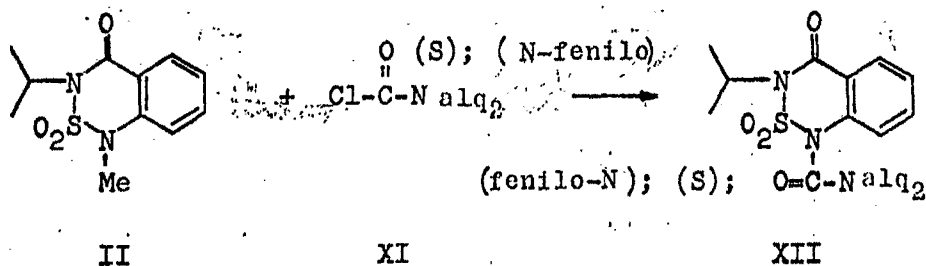


Para la obtención de 2,2-dióxidos de 1-alcoxi o ariloxycarbonyl o alquilmercapto-carbonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona X se hacen reaccionar las sales de partida de la fórmula II con ésteres de ácido clorofórmico IX sustituidos en forma correspondiente según las condiciones de reacción arriba indicadas, significando Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o un ión de amonio y teniendo -CO-OR o -CO-SR los significados para R₂ indicados bajo b)



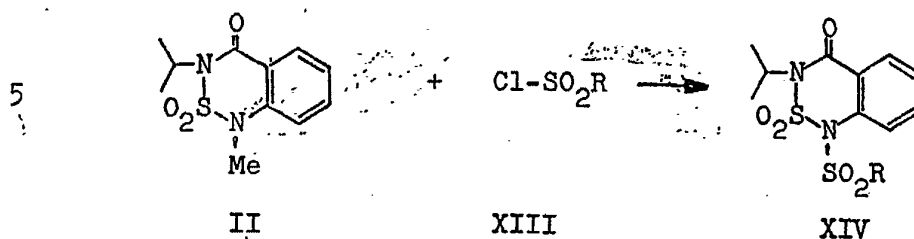
10 En forma análoga se obtiene haciendo reaccionar los compuestos II con cloruros de dialquilcarbamoilo, de dialquiltiocarbamoilo o N-fenil-N',N'-dialquilcloroformamidinas XI los compuestos XII. siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y teniendo O(S) (N-fenilo) -C-N alq₂

15 los significados para R₂ indicados bajo c):



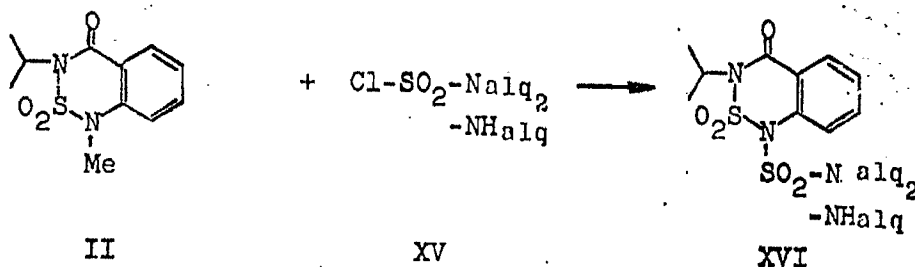
Haciendo reaccionar los cloruros de alquilsulfonilo o arilsulfonilo en caso dado sustituidos XIII con los compuestos de

partida II se obtiene en forma análoga los compuestos de la fórmula XIV, siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y teniendo -SO₂R los significados indicados para R₂ bajo d):



En caso de utilizar cloruros de mono o dialquilsulfamoilo XV se obtiene en la forma descrita los compuestos XVI, siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y teniendo -SO₂-N alq₂ los significados para -NH alquilo

10 R₂ indicados bajo e):

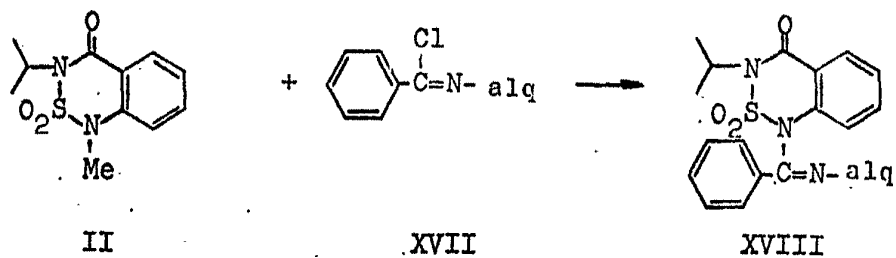


Haciendo reaccionar cloruros de N-alquilo-benzimida XVII en forma análoga con las sales de partida II, se obtienen los 2,2-dióxidos de 1-(N-alquil-benzimidil)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona de la fórmula XVIII, siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y teniendo -C=N-alquilo los significados para R₂

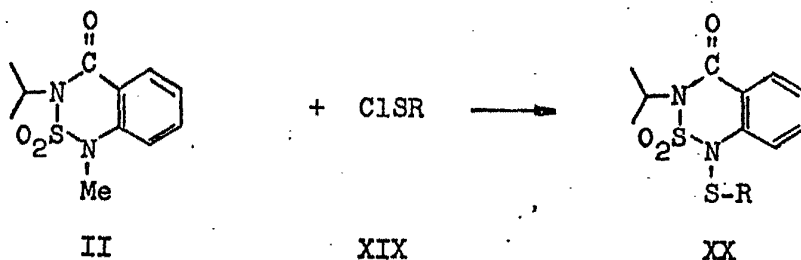
15

indicados bajo f):



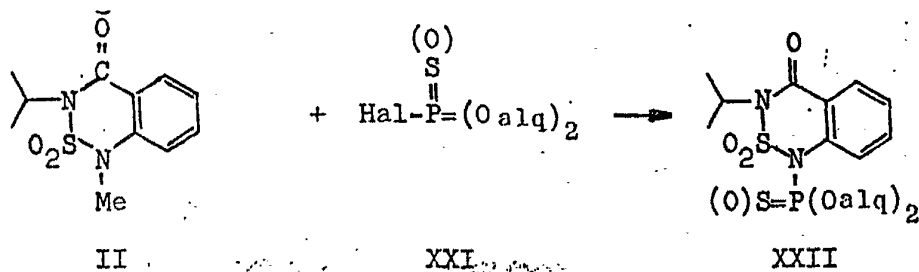


Utilizando haluros de alquilsulfonilo en caso dado halogenados XIX se obtiene bajo las condiciones de reacción arriba indicadas los 2,2-dióxidos de 1-alquiltio-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona XX, siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y teniendo -SR los significados para R₂ indicados bajo h):



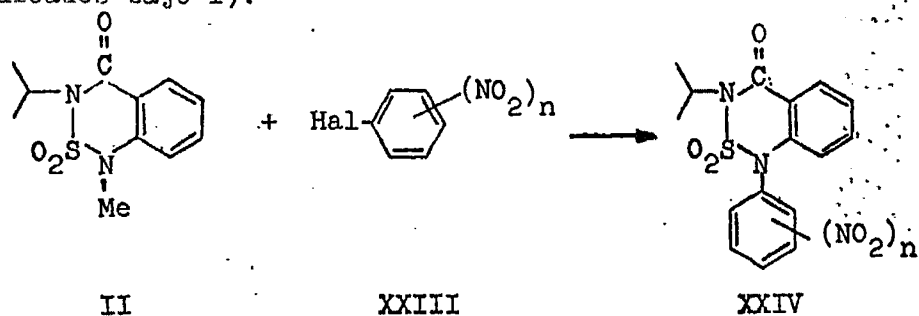
Haciendo reaccionar en forma análoga las sales de partida II con un haluro de éster de ácido dialquilsulfónico, se obtiene 1-(O,O-dialquilsulfonatos o bien sulfatos) de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona XXII, siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y teniendo -P(=O alquilo)_2 los significados para R₂

indicados bajo g):



Finalmente, haciendo actuar en forma análoga haluros de nitrofenilo XXIII sobre las sales de partida II se obtienen los 2,2-dióxidos de 1- $\left[\text{nitrofenil} \right]$ -3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona XXIV, siendo Me un equivalente de un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o de amonio y Hal un radical halógeno y teniendo los significados para R₂

indicados bajo i):



Las sustancias de partida II o bien III se pueden hacer reaccionar con los cloruros de ácido deseados en cantidades estequiométricas o en un exceso en cloruro de ácido, preferentemente en una proporción de 0,01 a 1,2 mol de cloruro de ácido por mol de sustancia de partida II o bien III. La obtención de los materiales de partida II y III se describe en la memoria de patente estadounidense 3 041 336 y la memoria de patente alemana 1 542 836.

Como base terciaria para las reacciones de las sustancias de partida III se prestan, por ejemplo, la trimetilamina, la trietilamina, la piridina, la α, β -picolina, la lutidina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetilciclohexilamina, la
5 quinolina, la isoquinolina, la quinazolina, la tri-n-butilamina, la tri-n-propilamina y la N-propil-diisopropilamina.

Como disolventes polares se puede utilizar el clorobenceno, el o,m, ó p-diclorobenceno, el nitrobenzeno, anisol, tolueno, el cloruro metilénico, el cloroformo, el 1,1 y 1,2-tetracloro-
10 etano, el 1,1,2,2-tricloroetano, el 1,1,2,2 y 1,1,1,2-tetracloroetano, las carbonamidas sustituidas, tales como la N-metil y N,N-dimetilformamida, cetonas, tales como acetona, metiletiletona, acetofenona, ciclohexanona, ésteres, tales como metilacetato, isobutilacetato, éteres, tales como dietil-
15 éter, di-n-propiléter, dioxano, tetrahidrofurano y nitrilos, tales como acetonitrilo, isobutironitrilo y benzonitrilo.

Las reacciones se efectúan, por lo general, en un margen de temperatura de - 10 a + 70°C, preferentemente, 0 a + 40°C; tratándose de cloruros de ácido menos reactivos puede ser
20 necesario calentar hasta a 110°C.

EJEMPLO 1

2,2-dióxido de 1-formil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona

32 partes (partes en peso) de una solución al 30 por ciento
5 (por ciento en peso) del anhídrido de ácido acético-ácido fórmico mezclado (obtenido a partir de cantidades equimolares de ácido fórmico y anhídrido de ácido acético) en una mezcla de ácido fórmico-ácido acético se introducen a temperatura ambiente en una solución de 24 partes de 2,2-dióxido de 3-
10 isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-(4)-ona en 120 partes de acetónitrilo. La mezcla de reacción se agita por 3 horas a 50°C y, a continuación, se concentra al vacío. El residuo se absorbe en cloruro metilénico, se extrae cuatro veces con sosa caústica 0,5 normal y con agua y se seca en presencia
15 de sulfato de magnesio. Después de concentrar al vacío se obtienen 24 partes (90 por ciento de la teoría) de 2,2-dióxido de 1-formil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona en forma de cristales incoloros con un p.f. de 90 a 99°C (descomp.).

20

EJEMPLO 2

2,2-dióxido de 1-(2',4'-diclorofenoxi- γ -butiril)-3-isopropil-
2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona

29,5 partes de cloruro de 2,4-diclorofenoxi γ -butirilo se introduce en el curso de 15 minutos a 15 hasta 20°C y bajo
25 agitación en una solución de 26,2 partes de sal 1-sódica de

2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en 120 partes de acetonitrilo. La mezcla de reacción se agita por una hora a 20°C y luego se elimina el disolvente al vacío. El residuo se absorbe en cloruro metilénico y se extrae cuatro veces con solución de carbonato sódico al 5 por ciento, se lava con agua y se seca en presencia de sulfato de magnesio. Después de concentrar al vacío se obtienen 38 partes (81 por ciento de la teoría) de 2,2-dióxido de 1-(2',4'-diclorofenoxi-butiril)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona como aceite incoloro, viscoso. Después de triturar en ciclohexano se obtienen cristales incoloros con un p.f. de 106 a 109°C.

En forma análoga se obtienen los siguientes compuestos:

- 2,2-dióxido de 1-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 103 a 105°C
- 15 2,2-dióxido de 1-butiril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 69 a 73°C
- 2,2-dióxido de 1-valeril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 39 a 44°C
- 2,2-dióxido de 1-isovaleril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 42 a 44°C
- 20 2,2-dióxido de 1-capronil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 67 a 69°C
- 2,2-dióxido de 1-(Δ -metil-valeril)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 42 a 50°C

- 2,2-dióxido de 1-enantil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1-pelargonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadia-
zin(4)-ona, $n^{25} = 1,5128$
- 5 2,2-dióxido de 1-caprinil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1-undecanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadia-
zin(4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1-dodecanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
10 (4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1-tridecanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1-tetradecanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona
- 15 2,2-dióxido de 1-pentadecanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadia-
zin(4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1-palmitoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona, p.f. 65 a 67°C
- 2,2-dióxido de 1-acetoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadia-
20 zin(4)-ona, p.f. 69 a 73°C
- 2,2-dióxido de 1-cloroacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-
(4)-ona, p.f. 106 a 109°C
- 2,2-dióxido de 1-dicloroacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadia-
zin(4)-ona,
- 25 2,2-dióxido de 1-~~l~~-cloro-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotia-
diazin(4)-ona, p.f. 83 a 85°C
- 2,2-dióxido de 1-~~l~~-~~l~~-dicloropropionil-3-isopropil-2,1,3-benzo-
tiadiazin(4)-ona,

- 2,2-dióxido de 1- α -clorobutiril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona,
- 2,2-dióxido de 1- α -clorovaleril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 5 2,2-dióxido de 1- α -clorocapronil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1- β -cloropropionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1- γ -bromobutiril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 10 2,2-dióxido de 1-acriloil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 71 a 76°C
- 2,2-dióxido de 1-but-2'-enoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 15 2,2-dióxido de 1-pent-3'-enoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, $n^{25}_D=1,5334$
- 2,2-dióxido de 1-metoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1- β -metoxipropionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 20 2,2-dióxido de 1- γ -metoxibutiril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1-benzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 127 a 131°C
- 25 2,2-dióxido de 1- α -naftoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 120 a 125°C

- 2,2-dióxido de 1-o-bromobenzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1-p-bromobenzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 5 2,2-dióxido de 1-m-bromobenzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1-p-nitrobenzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1-m-nitrobenzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 10 2,2-dióxido de 1-o-nitrobenzoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1-fenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 11 a 116°C
- 15 2,2-dióxido de 1-p-clorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 106 a 111
- 2,2-dióxido de 1-2',4'-diclorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 138 a 143,
- 2,2-dióxido de 1,2',4',5'-triclorofenoxiacetil-3-isopropil-
- 20 2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 164 a 170°C
- 2,2-dióxido de 1-2'-metil-4'-clorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 161 a 163°C
- 2,2-dióxido de 1-2',4'-diclorofenoxi-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 105 a 108
- 25 2,2-dióxido de 1-ciclopentanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de 1-ciclohexanoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 94 a 96°C

- 2,2-dióxido de oxalil-bis-1-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 223 a 224 (descomp.)
- 2,2-dióxido de malonil-bis-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 5 2,2-dióxido de succinil-bis-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de glutaril-bis-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 10 2,2-dióxido de adipoil-bis-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona
- 2,2-dióxido de decan-(1,10)-dioil-bis-1'-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 128 a 135

EJEMPLO 3

15 2,2-dióxido de 1- Δ -bromobutiril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona

22,9 partes de bromuro de ácido Δ -bromobutírico se introduce en el curso de 10 minutos a 10°C y bajo agitación en una solución de 24 partes de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona y 10,1 partes de trietilamina en 130 partes de acetonitrilo. La mezcla de reacción se agita por 10 minutos a 20°C y, a continuación, se filtra por succión. Ahora se concentra el filtrado al vacío, se absorbe en benceno y se lava 2 veces con solución de hidrogenocarbonato sódico al 5 por ciento y se lava con agua. Después de secar y concentrar al vacío se obtiene el 2,2-dióxido de 1- Δ -bromobutiril-

20

25

3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona como aceite incoloro ($n_D^{25} = 1,5552$) que cristaliza al tritularlo en petroléter con p.f. 73 a 78°C.

EJEMPLO 4

5 1-n-butilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona.

En una solución de 26,2 partes de sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en 120 partes de acetonitrilo se introduce bajo agitación en el curso de 15 minutos una solución de 15 partes de n-butiléster de ácido clorofórmico en 15 partes de acetonitrilo a 15 a 20°C. La mezcla de reacción se agita por una hora a 20°C y por 2 horas a 65°C. Después de concentrar al vacío se absorbe el residuo en cloruro metilénico, se extrae tres veces con sosa caústica 0,3 normal y con agua y se seca en presencia de sulfato de magnesio. Al concentrar al vacío se obtiene el 1-n-butil-carbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona como aceite viscoso que se cristaliza cuando se tritura en petroléter con un p.f. de 48 a 54°C.

20 En la misma forma se obtienen los siguientes compuestos:

1 metilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 103 a 105°C

1-etilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 109 a 120°C

25 1-n-propilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona

- 1-n-isopropilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona
- 1-isobutilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)-ona
- 5 1-sec.-butilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)-ona
- 1-terc.-butilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)-ona
- 10 1-n-pentilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)-ona
- 1-(3'-pentilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)-ona
- 1-ciclopentilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona
- 15 1-n-hexilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona
- 1-n-ciclohexilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona
- 1-n-heptilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
20 benzotiadiazin(4)ona
- 1-n-octilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona
- 1-n-nonilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona
- 25 1-n-decilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona

- 1-undecilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 1-dodecilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 5 1-tridecilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 1-tetradecilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 1-pentadecilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 10 1-hexadecilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 66 a 68°C
- 1-fenilcarbamato de 2,2 dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 111 a 115°C
- 15 1-o-metoxifenilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 130 a 133°C
- 1-metilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 117 a 121°C
- 1-etilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20 1-n-propilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, $n_D^{25} = 1,5553$
- 1-isopropilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 25 1-n-butilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

- 1-p-clorobencilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 98 a 100°C
- 1-fenilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 5 1-p-metoxifenilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

EJEMPLO 5

2,2-dióxido de 1-dimetilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

- 10 13,9 partes de la sal de potasio de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona se calientan por 5 horas en 15 partes de cloruro de ácido dimetilcarbámico a 100 hasta 110°C. Se añaden 150 partes de una mezcla 1:2 de benceno y éter y se filtra del cloruro de potasio (3,6 partes).
- 15 filtrado se mezcla con 100 partes de una mezcla 1:2 de éter y petroléter, a continuación, se filtra el producto cristalino por succión y se recristaliza a partir de ciclohexano. Se obtiene el 2,2-dióxido de 1-dimetilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona, p.f. 83 a 85,5°C.
- 20 En la misma forma se obtienen los siguientes compuestos:
- 2,2-dióxido de 1-dietilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 100 a 104°C
- 2,2-dióxido de 1-di-n-propilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)-ona

- 2,2-dióxido de 1-diisopropilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 150 a 152°C
- 2,2-dióxido de 1-n-dibutilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 5 2,2-dióxido de 1-di-sec.-butilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-N-metil-N-n-propoximetil-carbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, $n_D^{25} = 1,5239$
- 2,2-dióxido de 1-[1'-piperidinoil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 81 a 84°C
- 10 2,2-dióxido de 1-[hexahidro-1'-H-azepin-1'-oil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 100 a 103°C
- 2,2-dióxido de 1-dimetilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 78 a 81°C
- 15 2,2-dióxido de 1-dietiltiocarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-di-n-propiltiocarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadaizin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-diisopropiltiocarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20 2,2-dióxido de 1-[N'-fenil-N'',N''-dimetilformamidinil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 137°C

EJEMPLO 6

25 2,2-dióxido de 1-metilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

En una solución de 26,2 partes de la sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en 120 par-

tes de acetónitrilo se introducen bajo agitación a 20°C en el curso de 10 minutos 12,6 partes de cloruro de metanosulfonilo. La mezcla de reacción se agita por media hora a 20°C y por 2 horas a 60 a 65°C. Ahora se filtra por succión de la sal común precipitada y se concentra el filtrado al vacío. El residuo se tritura en éter, se filtra por succión y se lava con agua hasta quedar neutral; obteniéndose el 2,2-dióxido de 1-metilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en forma de cristales incoloros con p.f. de 156 hasta 158°C.

10 En forma análoga se obtienen los siguientes compuestos:

2,2-dióxido de 1-etilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 110 a 112°C

2,2-dióxido de 1-n-propilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

15 2,2-dióxido de 1-isopropilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

2,2-dióxido de 1-butilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

20 2,2-dióxido de 1-sec.-butilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

2,2-dióxido de 1-isobutilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 103 a 110°C

2,2-dióxido de 1-pentilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

25 2,2-dióxido de 1-bencenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 162 a 166°C

- 2,2-dióxido de 1-p-toluenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 141 a 143°C
- 2,2-dióxido de 1-p-bromobenzenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 163 a 168°C
- 5 2,2-dióxido de 1-o-bromobenzenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-m-bromobenzenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-p-nitrobenzenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 160 a 175°C
- 10 2,2-dióxido de 1-o-nitrobenzenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-m-nitrobenzenosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 15 2,2-dióxido de 1-β-naftalinsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 106°C

EJEMPLO 7

- 2,2-dióxido de 1-dimetilsulfamilo-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
-
- 20 En una solución de 26,2 partes de la sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en 120 partes de acetonitrilo se introducen bajo agitación a 20°C en el curso de 10 minutos 15,8 partes de cloruro de dimetilsulfamilo en 15 partes de acetonitrilo. La mezcla de reacción
- 25 se agita por 4 horas a 65°C. Después de filtrar por succión

de la sal común precipitada se concentra el filtrado al vacío y se digiere en 50 partes de metanol caliente. Ahora se filtra por succión en caliente del material insoluble y se tritura el filtrado enfriado. Después de filtrar por succión se obtienen cristales incoloros del 2,2-dióxido de 1-dimetil-sulfamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona con p.f. de 135 a 141°C.

En forma análoga se obtienen los siguientes compuestos:

- 10 2,2-dióxido de 1-dietilsulfamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-di-n-propilsulfamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-metilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 151 a 153°C
- 15 2,2-dióxido de 1-etilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 2,2-dióxido de 1-n-propilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20 2,2-dióxido de 1-isopropilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 151 a 153°C
- 2,2-dióxido de 1-n-butilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

EJEMPLO 8

2,2-dióxido de 1-[N-metil-benzimidil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

Una solución de 26,2 partes de la sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en 120 partes de acetónitrilo se introducen a 15 a 20°C en el curso de 10 minutos y bajo agitación en 15,4 partes de cloruro de N-metilbenzimidida en 120 partes de acetónitrilo. La mezcla de reacción se agita ulteriormente por una hora a 20°C y se concentra al vacío. El residuo se absorbe en cloruro metilénico, se extrae cuatro veces con solución de carbonato sódico al 10 por ciento, se lava con agua y se seca. Después de concentrar al vacío se aísla el 2,2-dióxido de 1-[N-metil-benzimidil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona como aceite viscoso que se cristaliza cuando se tritura en petroléter; p.f. 85 a 95°C. Una prueba recristalizada a partir de ciclohexano funde a 96 a 103°C.

En forma análoga se obtienen los siguientes compuestos:

2,2-dióxido de 1-[N-etil-benzimidil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

2,2-dióxido de 1-[N-n-propilbenzimidil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

EJEMPLO 9

1-[o,o-dietilfosforotioato] de 2,2-dióxido de 3-isopropil-
2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

18,9 partes de cloruro de ácido o,o-dietiltiofosfórico se
introducen a temperatura ambiente en una solución de 26,2
5 partes de la sal 1-sódica de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona en 120 partes de acetonitrilo. La mez-
cla de reacción se agita por 12 horas a reflujo. A continua-
ción, se concentra al vacío, se absorbe en benceno y se ex-
trae dos veces con agua, solución de hidrogenocarbonato sódico
10 al 10 por ciento y agua. Después de secar y concentrar
se obtiene el 1-[o,o-dietilfosforotioato] de 2,2-dióxido
de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona como aceite visco-
so con $n_D^{25} = 1,5219$.

En forma análoga se obtienen los siguientes compuestos:

15 1-[o,o-dimetilfosforotioato] de 2,2-dióxido de 3-isopropil-
2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, $n_D^{25} = 1,5424$
1-[o,o-di-n-propilfosforotioato] de 2,2-dióxido de 3-isopro-
pil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
1-[o,o-dimetilfosfato] de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
20 benzotiadiazin(4)ona
1-[o,o-dietilfosfato] de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-
benzotiadiazin(4)ona

EJEMPLO 10

2,2-dióxido de 1-perclorometiltio-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

5 En una solución de 26,2 partes de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona en 52 partes de acetona se introduce bajo agitación a temperatura ambiente dentro de 10 minutos 19,5 partes de cloruro de perclorometilsulfenilo. La mezcla de reacción se agita por una hora, a 20°C y, a continuación, se separa de la sal precipitada. Después de concentrar al vacío se absorbe el residuo en cloruro metilénico, se lava 3 veces con sosa cáustica 0,3 normal y con agua y se seca, a continuación, en presencia de sulfato de magnesio. Después de concentrar al vacío se obtiene el 2,2-dióxido de 1-perclorometiltio-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona como aceite viscoso; triturando con petroléter se cristaliza la sustancia con el p.f. de 77 a 80°C.

EJEMPLO 11

2,2-dióxido de 1-(2',4',6'-trinitrofenil)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

20 27,8 partes de la sal de potasio de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona se suspenden a 20°C en 150 partes en volumen de acetonitrilo y se introduce gota a gota una solución de 27,1 partes de cloruro de picrilo en 50 partes en volumen de acetonitrilo. Después de hervir por tres horas

a reflujó se filtra el cloruro de potasio por succión (6,2 partes) y se concentra el filtrado. El residuo cristaliza al triturarlo con una mezcla de éter y petroléter. Se obtienen cristales anaranjados del 2,2-dióxido de 1-(2',4',6'-trinitrofenil)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, p.f. 110 a 115°C, después de recristalizar a partir de tetracloruro de carbono 153 a 157°C.

La aplicación se efectúa, por ejemplo, en forma de soluciones, polvos, suspensiones, también suspensiones acuosas, aceitosas de elevada concentración u otras 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 o aceite Diesel, además aceite de alquitran de carbón etc., así como aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, benceno, tolueno, xilol, parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas o sus derivados, por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol, cloroformo,

tetracloreuro de carbono, ciclohexanol, ciclohexanona, clorobenceno, isoforona etc., disolventes fuertemente polares, por ejemplo, dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, N-metilpiridiona, agua etc.

5 Las formas de aplicación acuosas pueden prepararse mediante la adición de agua a concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables) y dispersiones de aceite pueden homogeneizarse las sustancias como tales o disueltas en un aceite o en un disolvente mediante agentes re-

10 ticulantes, 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.

15 Como sustancias tensioactivas sean mencionadas: sales alcalinas, alcalinotérreas, sales amónicas de ácido ligninosulfónico, ácidos naftalinosulfónicos, ácidos fenosulfónicos, alquilanilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sales alcalinas y alcalinotérreas del ácido dibutilnaftalinosulfónico,

20 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

25 formaldehído, productos de condensación de la naftalina o

- bien de los ácidos naftalinosulfónicos con fenol y formaldehído, polioxietileno-octilfenoléter, isooctilfenol, octilfenol, nonilfenol etoxilados, alquilfenolpoliglicoléter, tributilfenilpoliglicoléter, alcoholes de alquilarilpoliéter, alcohol de isotridacilo, condensados de óxido etilénico de alcohol graso; aceite de ricino atoxilado, polioxietilenoalquiléter, polioxipropileno etoxilado, acetal de poliglicoléter de laurilalcohol, éster sorbítico, lignina, lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.
- 5
- 10 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 silicagel, ácidos silícicos, geles de silicio, silicatos, talco, caolín, attaclay, caliza, caltiza, 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, urcas y productos vegetales, tales como harinas de cereales, de corteza, de materia y de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros soportes sólidos.
- 15
- 20

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

- A las mezclas o a cada sustancia activa se pueda adicionar, en caso dado inmediatamente antes de aplicarlas (mezcla de tanque), aceites de diferente tipo, adhesivos o reticulantes, herbicidas, fungicidas, nematocidas, insecticidas, bactericidas, elementos pizcas, abonos, agentes antiespumantes (por ejemplo síliconas), reguladores de crecimiento, antidotos u otros compuestos de efecto herbicida, tales como
- 5
- 10 amidas e imidas de ácido alquil-sulfonilglicólico sustituidas, amidas e imidas de ácido alquilaminosulfonilglicólico sustituidas, acetanilida o alquilsulfitos sustituidos, anilinas sustituidas, azidas sustituidas,
- 15 ácidos ariloxycarboxílicos sustituidos, ácidos ariloxitiocarboxílicos sustituidos, así como sus ésteres y amidas y tioamidas, alcanoles y alquenoles sustituidos, éteres sustituidos,
- 20 ácidos arsónicos y arsénicos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas, bencenosulfonamidas sustituidas, benzimidazoles sustituidos, benzisotiazoles sustituidos,
- 25 dihidro-benzofuranil-alquilaminosulfonatos sustituidos,

- dioxidos de benztiadiazinona sustituidos,
benzoxacinas sustituidas,
benzoxacinonas sustituidas, benzoxazolintionas sustituidas,
benztiadiazoles sustituidos, ácidos benztiazolínalquil-
5 carbóxicos: sustituidos, así como sus sales, ésteres y ami-
das, biuretes sustituidos,
quinolinas sustituidas,
carbamatos sustituidos,
ácidos carboxílicos, tiocarboxílicos, alifáticos o cicloali-
10 fáticos sustituidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
ácidos carboxílicos, tiocarboxílicos, aromáticos sustituidos,
así como sus sales, ésteres y amidas,
carbamoilalquiltiol o carbamoilalquilditiofosfatos
sustituidos,
15 quinazolines sustituidas,
ácidos cicloalquilamidocarbottílicos sustituidos, así como
sus sales, ésteres y amidas,
cicloalquilcarbonamidatiazoles sustituidos,
ácidos dicarboxílicos sustituidos, así como sus sales,
20 ésteres y amidas,
sulfonatos de dihidrobenzofurenilo sustituidos,
dihidropirandionas sustituidas,
disulfuros sustituidos,
dioxanos sustituidos,
25 sales de dipiridilio sustituidas,
ditiocarbamatos sustituidos, ácidos ditiofosfóricos susti-

- tuidos, así como sus sales, ésteres y amidas,
ácidos fluorencarboxílicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
ureas sustituidas,
- 5 hexahidro-1-H-carbotioatos sustituidos,
hidantoínas sustituidas, hidracidas sustituidas,
sales de hidrazonio sustituidas,
hidrofuranos sustituidos,
isooxazolpirimidonas sustituidas,
- 10 imidazoles sustituidos, amidas de ácido imidazolidindion-
carboxílicas sustituidas,
isotiazolpirimidonas sustituidas,
cetonas sustituidas,
naftoquinonas sustituidas, anhídridos de ácido naftálicos
- 15 sustituidos,
nitrilos alifáticos sustituidos,
nitrilos aromáticos sustituidos,
oxadiazoles sustituidos,
oxadiazolinonas sustituidas,
- 20 oxadiazinonas sustituidas, oxadiazolinas sustituidas,
oxadiazolidindionas sustituidas, oxazolidinas sustituidas,
oxadiazindionas sustituidas, oxazol-pirimidinonas
sustituidas,
fenoles sustituidos, así como sus sales y ésteres,
- 25 ácidos fosfónicos sustituidos, así como sus sales, ésteres

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

- ácidos arilsulfónicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas, sulfamatos sustituidos,
estirenos sustituidos, sulfoniltoluidas sustituidas,
tetrahidro-oxadiazindionas sustituidas,
5 tetrahidro-oxadiazolidionas sustituidas,
tetrahidrometanoindenos sustituidos,
tetrahidro-oxadiazoltionas sustituidas,
tetrahidrotiadiazintionas sustituidas,
tetrahidrotiadiazolidionas sustituidas,
10 amidas de ácido tiocarbónico aromáticas sustituidas,
tiobenzamidas sustituidas,
ácidos tiocarbónicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
tiocarbamatos sustituidos,
15 tioureas sustituidas,
ácidos tiosulfónicos sustituidos, así como sus sales,
ésteres y amidas,
triazinas sustituidas,
triazinonas sustituidas,
20 triazoles sustituidos,
uracilos sustituidos,
uretidindionas sustituidas, cloratos, azetidincarbatoatos
sustituidos.

- Los últimos compuestos herbicidas pueden aplicarse tanto
25 antes de o 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, adhesivos o reticulantes fungicidas, nematocidas, insecticidas, bactericidas, antídotos y reguladores del crecimiento.

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 las plantas indeseadas.

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

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

Los nuevos agentes pueden emplearse en cultivos de cereales, tales como

Avena spp.	Scirghum
Triticum spp.	Zea mays
Hordeum spp.	Panicum miliaceum
Secale spp.	Oryza spp.

5 y en cultivos de dicotiledóneas, tales como
Cruciferae, p.ej.

Brassica spp.	Raphanus spp.
Sinapis spp.	Lepidium spp.

Compositae, p.ej.

10 Lactuca spp.	Carthamus spp.
Helianthus spp.	Scorzonera spp.

Malvaceae, p.ej.

Gossypium hirsutum

Leguminosae, p.ej.

15 Medicago spp.	Phaseolus spp.
Trifolium spp.	Arachis spp.
Pisum spp.	Glycine Max

Chenopodiaceae, p.ej.

Beta vulgaris

20 Spinacia spp.	
------------------	--

Solanaceae, p.ej.

Solanum spp.

Capsicum annum

Nicotiana spp.

Linaceae, p.ej.

25 Linum spp.	
---------------	--

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

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

20 Por malas hierbas o bien plantas indeseadas se 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

- | | | |
|----|------------------|---------------------|
| | Cynodon s.p. | Dactylis spp. |
| | Digitaria spp. | Avena spp. |
| 5 | Echinochloa spp. | Bromus spp. |
| | Setaria spp. | Uniola spp. |
| | Panicum spp. | Poa spp. |
| | Alopecurus spp. | Leptochloa spp. |
| | Lolium spp. | Brachiaria spp. |
| 10 | Sorghum spp. | Eleusine spp. |
| | Agropyron spp. | Cenchrus spp. |
| | Phalaris spp. | Eragrostis spp. |
| | Apera spp. | Phragmites communis |
| | y otros | |

15 Cyperaceae, tales como

- | | |
|--------------|-----------------|
| Carex spp. | Eleocharis spp. |
| Cyperus spp. | |
| Scirpus spp. | y otros. |

males hierbas dicotiledóneas, tales como

20 Malvaceae, por ejemplo

- | | |
|-----------------------|---------------|
| Abutilon theoprastrti | Hibiscus spp. |
| Sida spp. | etc. |
| Malva spp. | |

Compositae, tales como

	Ambrosia spp.	Centaurea spp.
	Lactuca spp.	Tussilago spp.
	Senecio spp.	Lapsana communis
5	Sonchus spp.	Tagetes spp.
	Xanthium spp.	Erigeron spp.
	Iva spp.	Anthemis spp.
	Galinsoga spp.	Matricaria spp.
	Taraxacum spp.	Argemisia spp.
10	Chrysanthemum spp.	etc.
	Bidens spp.	
	Cirsium spp.	

Convolvulaceae, tales como

	Convolvulus spp.	Cuscuta spp.
15	Ipomoea spp.	etc.
	Ipomoea tamnifolia	

Cruciferae, tales como

	Barbarea vulgaris	Arabidopsis thaliana
	Brassica spp.	Descurainia spp.
20	Capsella spp.	Draba spp.
	Sisymbrium spp.	Coronopus didymus
	Thlaspi spp.	Lepidium spp.
	Sinapis arvensis	etc.
	Raphanus spp.	

- Euphorbiaceae, tales como
 Hecurialis annua *Euphorbia* spp.
- Umbelliferae, tales como
 Daucus carota *Anisi majus*
5 *Pethusa cynapium* etc.
- Commelinaceae, tales como
 Commelina spp. etc.
- Labiatae, tales como
 Lamium spp. etc.
10 *Galeopsis* spp.
- Leguminosae, tales como
 Medicago spp. *Sesbania exaltata*
 Trifolium spp. *Cassia* spp.
 Vicia spp. *Aeschynomene* spec.
15 *Vicia* spp. etc.
 Lathyrus spp.
- Plantaginaceae, tales como
 Plantago spp. etc.
- Polygonaceae, tales como
20 *Polygonum* spp. *Fagopyrum* spp.
 Rumex spp. etc.
- Aizoaceae, tales como
 Eollugo verticillata etc.

Amaranthaceae, tales como

Amaranthus spp. etc.

Boraginaceae, tales como

Amsinckia spp. Anchusa spp.

5 Myosotis spp. etc.

Lithospermum spp.

Caryophyllaceae, tales como

Stellaria spp. Silene spp.

Spergula spp. Cerastium spp.

10 Saponaria spp. Agrostemma githago

Sceleranthus annuus etc.

Chenopodiaceae, tales como

Chenopodium spp. Atriplex spp.

Kochia spp. Monolepsis nuttalisana

15 Salsola Kali etc.

Lythraceae, tales como

Cuphea spp. etc.

Oxalidaceae, tales como

Oxalis spp.

20 Ranunculaceae, tales como

Ranunculus spp. Adonis spp.

Delphinium spp. etc.

Papaveraceae, tales como

Papaver spp. etc.

25 Fumaria officinalis

Onagraceae, tales como

Jussicea spp. etc.

Rosaceae, tales como

Alchemilla spp. etc.

5

Potentilla spp.

Potamogetonaceae, tales como

Potamogeton spp. etc.

Najadaceae, tales como

Najas spp. etc.

10

Marsileaceae, tales como

Marsilea quadrifolia etc.

EJEMPLO 12

15

En el invernadero se trata algodón (*Gossypium hirsutum*) que estaba creciendo conjuntamente con bastante *Sinapis arvensis*, cuando tiene una altura de crecimiento de 2 a 10 cm con las siguientes sustancias activas:

20

- I 1-etilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- II 2,2-dióxido de 1-isobutilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- III 2,2-dióxido de 1-etilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- IV 2,2-dióxido de 1-dietilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

La cantidad de aplicación ascendió en cada caso a 1 kg/ ha de sustancia activa. Las sustancias activas estaban en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea. Al cabo de 2 a 3 semanas se constató que los compuestos I a IV mostraron una mejor compatibilidad con la planta de cultivo que XIV 2,2-dióxido de β -isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

sustancia activa	I	II	III	IV	XIV
<u>plantas útiles:</u>					
Gossypium hirsutum	0	0	0	10	30
<u>plantas indeseadas:</u>					
Sinapis arvensis	100	100	100	100	100

0 = sin daño

100 = destrucción total

EJEMPLO 13

En el invernadero se tratan diferentes plantas de ensayo cuando tienen una altura de crecimiento de 2 a 25 cm con las siguientes sustancias activas:

- I 1-etilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- II 2,2-dióxido de 1-isobutilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- III 2,2-dióxido de 1-etilsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

- IV 2,2-dióxido de 1-dietilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- V 2,2-dióxido de 1-dimetilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 5 VI 2,2-dióxido de 1-N-metil-n-propoximetilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- VII 2,2-dióxido de 1-dimetiltiocarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- VIII 2,2-dióxido de 1- β -naftalinsulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 10 IX 2,2-dióxido de 1-isopropilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- X 2,2-dióxido de 1,metilaminosulfonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 15 XI 2,2-dióxido de 1-(2',4',6'-trinitrofenil)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XII 1-metilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XIII 1-fenilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20

La cantidad de aplicación asciende en cada caso a 4 kg/ ha de sustancia activa. Las sustancias activas estaban en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea.

Al cabo de 2 a 3 semanas se comprobó que las sustancias activas mostraron una muy buena compatibilidad con las plantas de cul-

tivo y un buen efecto herbicida.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

sustancia activa	I	II	III	IV	V	VI	VII	VIII
<u>plantas útiles:</u>								
5 Oryza sativa	0	0	0	0	0	0	0	0
Glycine max.	0	0	0	0	0	0	0	0
Sorghum bicolor	0	0	0	0	0	0	0	0
Zea mays	0	0	0	0	0	0	0	0
Triticum aestivum	0	0	0	0	0	0	0	0
10 Hordeum vulgare	0	0	0	0	0	0	0	0
Secale cereale	0	0	0	0	10	0	0	0
Solanum tuberosum	0	0	0	0	0	0	0	0
<u>plantas indeseadas:</u>								
Sinapis arvensis	100	100	100	100	100	100	100	100
15 Cyperus esculentus	80	75	75	90	100	85	90	95

sustancia activa	IX	X	XI	XII	XIII
<u>plantas útiles:</u>					
Oryza sativa	0	0	0	0	0
Glycine max.	0	0	0	0	0
20 Sorghum bicolor	0	0	0	0	0
Zea mays	0	0	0	0	0
Triticum aestivum	0	0	0	0	0
Hordeum vulgare	0	0	0	0	0
Secale cereale	0	0	0	0	0
25 Solanum tuberosum	0	0	0	0	0
<u>plantas indeseadas:</u>					
Sinapis arvensis	100	100	100	100	100
Cyperus esculentus	80	90	75	100	70

0 = sin daño
 30 100 = destrucción total

EJEMPLO 14

En el invernadero se llenan tiestos experimentales con tierra arenosa y arcillosa y se siembran con las semillas de arroz (Oryza sativa), trigo (Triticum aestivum) y Sinapis arvensis. Inmediatamente después se efectúa el tratamiento con las sustancias activas:

- IV 2,2-dióxido de 1-dietilcarbamoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona y
- XII 1-metilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona.

La cantidad de aplicación asciende a 3 kg/ha de sustancia activa. Las sustancias activas estaban 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 IV y XII mostraron una muy buena compatibilidad con las plantas de cultivo y un buen efecto herbicida.

el resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

sustancia activa	IV	XII
<u>plantas útiles:</u>		
Oryza sativa	0	0
Triticum aestivum	0	0
<u>plantas indeseadas:</u>		
Sinapis arvensis	90	90
0 = sin daño		
100 = destrucción total		

Los siguientes compuestos mostraron un efecto biológico correspondiente a las sustancias activas mencionadas en los ejemplos 12 a 14:

- 5 2,2-dióxido de 1-(N'-fenil-N'',N''-dimetilfomamidinil)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona (XV)
1-p-clorobencil-mercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona (XVI)
1-metilmercaptocarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona (XVII)

10

EJEMPLO 15

90 partes en peso del compuesto del ejemplo 1 se mezclan con 10 partes en peso de N-metil- α -pirrolidona obteniendo así una solución apropiada para ser aplicada en forma de gotas minúsculas.

15

EJEMPLO 16

- 20 partes en peso del compuesto del ejemplo 2 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 oleico, 5 partes en peso de la sal cálcica del ácido dodecilbencenosulfónico 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 agua se obtiene un caldo de pulverización.

EJEMPLO 17

20 partes en peso del compuesto del ejemplo 3 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.

EJEMPLO 18

20 partes en peso del compuesto del ejemplo 4 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.

EJEMPLO 19

20 partes en peso de la sustancia activa del ejemplo 5 se mezclan bien con 3 partes en peso de la sal sódica del ácido diisobutilnaftalin- 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 moliduran en un molino de martillos.

EJEMPLO 20

3 partes en peso del compuesto del ejemplo 6 se mezclan inti-

mamente 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 21

5 30 partes en peso del compuesto del ejemplo 7 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
10 adherencia.

EJEMPLO 22

En el invernadero se tratan diferentes plantas cuando tienen una altura de crecimiento de 2 a 18 cm con las siguientes sustancias activas :

- 15 I 2,2-dióxido de 1-fenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- II 2,2-dióxido de 1-p-clorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20 III 2,2-dióxido de 1-2',4'-diclorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- V 2,2-dióxido de 1-2',4'-diclorofenoxi-~~l~~-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- VII 2,2-dióxido de 1-cloroacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

- VIII 2,2-dióxido de 1-acetoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- IX 2,2-dióxido de 1-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 5 X 2,2-dióxido de 1- α -cloropropionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XI 2,2-dióxido de 1- α -bromobutiril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 10 XII 2,2-dióxido de 1-sec.-valeril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XIII 1-(o,o-dimetilfosforotioato) de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XIV 1-(o,o-dietilfosforotioato) de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 15 XV 2,2-dióxido de oxalil-bis-1-(3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona)
- XVI 2,2-dióxido de 1-palmitoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20 XVII 2,2-dióxido de 1-formil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

en cada caso dispersadas o emulsinadas en 500 l de agua por hectárea. La cantidad de aplicación asciende en cada caso a 2 kg/ ha de sustancia activa.

25 Al cabo de 2 a 3 semanas se comprobó que las sustancias activas mostraron un buen efecto herbicida teniendo una muy buena compatibilidad con las plantas de cultivo.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

sustancia activa	I	II	III	V	VII	VIII	IX	X
kg/ha	2	2	2	2	2	2	2	2
<u>plantas útiles:</u>								
5 Triticum aestivum	0	0	0	0	0	0	0	0
Hordeum vulgare	0	0	0	0	0	0	0	0
Secale cereale	0	0	0	0	0	0	0	0
Oryza sativa	0	0	0	0	0	0	0	0
Glycine max.	0	0	0	0	0	0	0	0
<u>plantas indeseadas:</u>								
10 Sinapis arvensis	95	100	90	95	100	100	90	95
sustancia activa	XI	XII	XIII	XIV	XV	XVI	XVII	
kg/ha	2	2	2	2	2	2	2	
<u>plantas útiles:</u>								
15 Triticum aestivum	0	0	0	0	0	0	0	
Hordeum vulgare	0	0	0	0	0	0	0	
Secale cereale	0	0	0	0	0	0	0	
Oryza sativa	0	0	0	0	0	0	0	
Glycine max.	0	0	0	0	0	0	0	
<u>plantas indeseadas:</u>								
20 Sinapis arvensis	95	100	100	95	90	90	90	
0 = sin daño								
100 = destrucción total								

EJEMPLO 23

25 En el invernadero se llenan tiestos experimentales con tierra arenosa y arcillosa y se siembran con diferentes semillas.

Inmediatamente después de realizar el tratamiento con las sustancias activas:

- II 2,2-dióxido de 1-p-clorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 5 III 2,2-dióxido de 1-2',4'-diclorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- IV 2,2-dióxido de 1-2'-metil-4'-clorofenoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- V 2,2-dióxido de 1-2',4'-diclorofenoxi- α -propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 10 VIII 2,2-dióxido de 1-acetoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- IX 2,2-dióxido de 1-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 15 X 2,2-dióxido de 1- α -cloropropionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XIII 1-(o,o-dimetilfosforotioato) de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- XIV 1-(o,o-dietilfosforotioato) de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- 20

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

25 Al cabo de 4 a 5 semanas se comprobó que las sustancias activas mostraron un buen efecto herbicida teniendo una muy

buena compatibilidad con las plantas de cultivo.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

sustancia activa	II	III	IV	V	VIII	IX	X	XIII	XIV
kg/ha	3	3	3	3	3	3	3	3	3
<u>plantas útiles:</u>									
5 Zea mays	0	0	0	0	0	0	0	0	0
Triticum aestivum	0	0	0	0	0	0	0	0	0
Oryza sativa	0	0	0	0	0	0	0	0	0
Glycine max.	0	0	0	0	0	0	0	0	0
10 Gossypium hirsutum	0	0	0	0	0	0	0	0	0
<u>plantas indeseadas:</u>									
Sinapis arvensis	100	95	95	100	80	90	80	80	100

0 = sin daño
 100 = destrucción total

15 EJEMPLO 24

En el invernadero se tratan diferentes plantas cuando tienen una altura de crecimiento de 2 a 10 cm con las siguientes sustancias activas:

- 20 VII 2,2-dióxido de 1-cloroacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- VIII 2,2-dióxido de 1-acetoxiacetil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona
- X 2,2-dióxido de 1- α -cloro-propionil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

XIII 1-(o,o-dimetilfosforotioato) de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

en comparación con la sustancia activa

XIX 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

5

en cada caso dispersadas o emulsinadas en 500 l de agua por hectárea.

La cantidad de aplicación ascendió en caso de la planta de cultivo a 1 kg/ha de sustancia activa y en caso de las plantas indeseadas a 0,8 kg/ha.

10

Al cabo de 2 a 3 semanas se constató que las sustancias activas VII, VIII, X y XIII con 1 kg/ha de sustancia activa mostraron una mejor compatibilidad con la planta de cultivo, y con 0,8 kg/ha de sustancia activa, el mismo efecto herbicida para con las plantas indeseadas que la sustancia activa XIX.

15

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

sustancia activa kg/ha	VII 0,8 l	VIII 0,8 l	X 0,8 l	XIII 0,8 l	XIX 0,8 l
---------------------------	--------------	---------------	------------	---------------	--------------

20

plantas útiles:

Gossypium hirsutum - 0 - 10 - 0 - 0 0 30

plantas indeseadas:

Sinapis arvensis 100 - 95 - 95 - 100 - 95 -

Matricaria chamomilla 100 - 96 - 95 - 100 - 95 -

25 0 = sin daño; 100 = destrucción total

Tienen la misma eficiencia biológica que los compuestos de los ejemplos 22 a 24:

el 2,2-dióxido de 1-pelargonil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

5 y

el 2,2-dióxido de 1-pent-3'-enoil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

EJEMPLO 25

10 En el invernadero se tratan diferentes plantas cuando tienen una altura de crecimiento de 5 a 15 cm con las siguientes sustancias activas:

A 2,2-dióxido de 1-sec.-valeril-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

15 B 1-fenilcarbamato de 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

C 2,2-dióxido de 1[N-metil-benzimidil]-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

20 con, en cada caso, 2,0 kg/ha dispersado o emulsionado en 500 l de agua per hectárea. Durante el ensayo se dan 20 mm de precipitación con excepción de Zea mays que recibe 60 mm y Glycine max. que recibe 180 mm.

Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas A, B, C mostraron una buena compatibilidad con Zea mays, causaron un daño aún justificable en Gossypium hirsutum y mos-

traron un fuerte efecto herbicida sobre *Bidens pilosa* y *Chrysanthemum segetum*. El compuesto A también mostró un buen efecto herbicida frente a *Anthemis nobilis*, mientras que los compuestos B y C tuvieron un efecto inferior en este caso.

El ejemplo confirma que se pueden combatir las especies de gramíneas y soja (*Glycine max.*). El resultado del ensayo se aprecia en la siguiente tabla:

Tabla

10	sustancia activa kg/ha	A 2,0	B 2,0	C 2,0
	<u>plantas útiles:</u>			
	Glycine max.	10 (3)	15 (2)	20 (1)
	Zea mays	6,6(3)	10 (2)	0 (1)
15	<u>plantas indeseadas:</u>			
	Anthemis nobilis	95 (1)	60 (1)	40 (1)
	Bidens pilosa	90 (1)	95 (1)	95 (1)
	Chrysanthemum segetum	95 (1)	95 (1)	95 (1)

() = número de ensayos, en caso de varios ensayos, valor medio.

EJEMPLO 26

En el invernadero se tratan diferentes plantas de una altura de crecimiento de 10a.17 cm con la siguiente sustancia activa:

25 C 2,2-dióxido de 1- \int N-metil-benzimidil \int -3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona

con 1,0 kg/ha de s.a. emulsionada en 500 l de agua por hectárea. Durante el ensayo la planta *Oryza sativa* recibe 280 a 300 mm de precipitación y *Ammania coccinea* 50 a 60 mm.

Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que la sustancia activa C mostró un fuerte efecto herbicida teniendo una buena compatibilidad con la planta de cultivo.

El ejemplo indica que con el compuesto C se pueden combatir las malas hierbas palustres o acuáticas que crecen en los campos de arroz.

El resultado del experimento se indica en la tabla siguiente:

Tabla

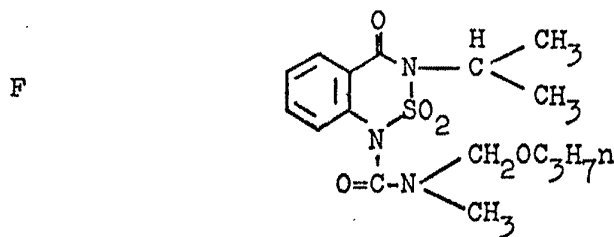
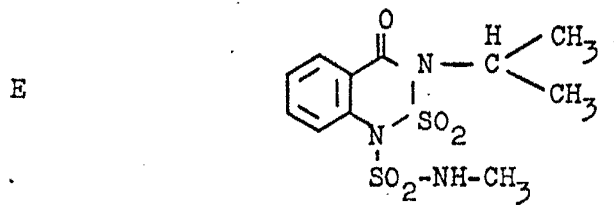
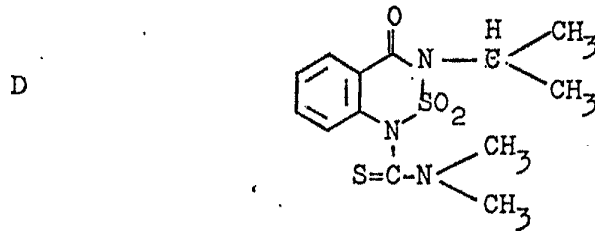
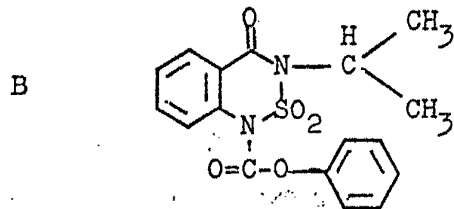
sustancia activa	C
kg/ha	1,5
<hr/>	
<u>plantas útiles:</u>	
<i>Oryza sativa</i>	5 (2)
<u>plantas indeseadas:</u>	
<i>Ammania coccinea</i>	97,5 (2)

() = número de ensayos, en caso de varios ensayos, valor medio.

20

EJEMPLO 27

En el campo abierto se tratan diferentes plantas cuando tienen una altura de crecimiento de 2 a 14 cm con las siguientes sustancias activas:



5 conteniendo en cada caso 3,0 kg/ha y adicionalmente, en cada caso, 2 l/ha de reticulante, cada vez dispersadas o emul-

sionadas en 500 l de agua por hectárea. Durante el ensayo se dieron 20 a 30 mm de precipitación.

Al cabo de 3 a 4 semanas se verificó que los compuestos B, D, E, F mostraron un efecto herbicida bueno hasta muy

5 bueno frente a las malas hierbas dicotiledóneas: *Chenopodium album*, *Galinsoga parviflora*, *Galium aparine*, *Matricaria chamomilla*, *Polygonum persicaria*, *Sinapis arvensis*, *Stellaria media*. Las sustancias B, D y E también tuvieron un buen

10 efecto contra *Amaranthus retroflexus*, mientras que la sustancia F fue menos eficiente. La planta de cultivo *Oryza sativa* solamente sufrió un ligero deterioro causado por los compuestos B, D, E, F.

El resultado del experimento se desprende de la siguiente tabla:

15 Como reticulante se empleó el producto de adición de 6 a 7 moles de óxido etilénico a 1 mol de isooctilfenol.

sustancia activa		reticulante			
kg/ha		3,0 + 2,0	3,0 + 2,0	3,0 + 2,0	3,0 + 2,0
<u>plantas útiles:</u>					
20	<i>Oryza sativa</i>	5	5	5	5
<u>plantas indeseadas:</u>					
	<i>Amaranthus retroflexus</i>	100	80	95	65
	<i>Chenopodium album</i>	100	100	100	100
	<i>Galinsoga parviflora</i>	100	100	100	100
25	<i>Galium aparine</i>	100	80	100	90
	<i>Matricaria chamomilla</i>	100	100	100	---
	<i>Polygonum persicaria</i>	90	100	100	100
	<i>Sinapis arvensis</i>	100	100	100	100
	<i>Stellaria media</i>	100	80	100	100

Con los compuestos mencionados se logra destruir malas hierbas campestres. Arróz se empleó en los ensayos como representante de cultivos de gramíneas, frente a los cuales los compuestos mencionados resultan eficientes como herbicidas.

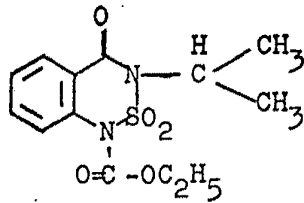
5

EJEMPLO 28

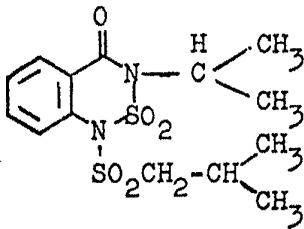
En el campo abierto se tratan diferentes plantas cuando tienen una altura de crecimiento de 2 a 10 cm con las siguientes sustancias activas:

10

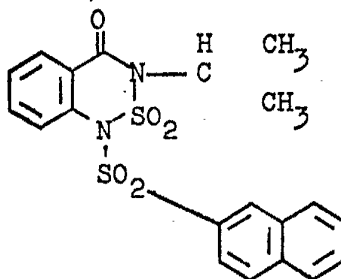
I



K



L



con, cada vez, 1,5 kg/ha y adicionalmente, en cada caso, 2 l/ha de reticulante, en cada caso dispersadas o emulsionadas en 500 l de agua por hectárea. Durante el ensayo cayeron 9 a 11 mm de precipitación.

- 5 Al cabo de 3 a 4 semanas se comprobó que las sustancias activas I, K, L mostraron un fuerte efecto herbicida frente a plantas dicotiledóneas, tales como *Centaurea cyanus*, *Chenopodium album*, *Sinapis arvensis*, *Stellaria media*, *Spérgula arvensis*, mientras que frente a *Amaranthus retroflexus* y *Polygonum persicaria* tuvieron un menor efecto. Desmostraron ser plenamente compatibles con *Glycine max.* los compuestos I y L, mientras que la sustancia K produjo ligeras quemaduras y una inhibición de crecimiento en *Glycine max.*

El resultado del experimento se desprende de la siguiente tabla:

15

Tabla

sustancia activa kg/ha	reticulante		
	1,5 + 2,0	1,5 + 2,0	1,5 + 2,0
<u>plantas útiles:</u> <i>Glycine max</i>	0	10	0
20 <u>plantas indeseadas:</u>			
<i>Amaranthus retroflexus</i>	70	40	30
<i>Centaurea cyanus</i>	100	100	100
<i>Chenopodium album</i>	100	100	100
<i>Polygonum persicaria</i>	0	0	60
25 <i>Sinapis arvensis</i>	100	90	90
<i>Stellaria media</i>	100	100	80
<i>Spérgula arvensis</i>	100	100	80

conteniendo, en cada caso, 1,0 kg/ha de sustancia activa dispersada o emulsionada en 500 l de agua por hectárea. Al caldo de pulverización se adiciona 1 kg/ha de poliacrilato amónico con el fin de mejorar la distribución de la
5 sustancia activa sobre las superficies de las hojas. Durante el ensayo cayeron 10 a 20 mm de precipitación.

Al cabo de 3 a 4 semanas se constató que se logra destruir bien hasta muy bien las plantas indeseadas: *Chenopodium album*, *Galinsoga parviflora*, *Matricaria chamomilla*, *Sinapis arvensis*, *Stellaria media* con los compuestos F,G,H,M. La
10 sustancia M posee, además, un buen efecto frente a *Amaranthus retroflexus*. Además, la sustancia N muestra un muy buen efecto frente a *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album*, *Stellaria media*, mientras que el efecto sobre *Galinsoga* fue menos fuerte. La planta *Amaranthus retroflexus* no
15 sufrió ningún deterioro o solamente un ligero deterioro por las sustancias F,G,H. El compuesto F demostró ser compatible con soja (*Glycine max.*). La sustancia H produjo un pequeño, el producto G un ligero daño en soja, mientras que el daño

causado por el compuesto M y N en soja es más grave.

El resultado del experimento se indica en la siguiente tabla:

Tabla

5	sustancia activa kg/ha	F 1,0	G 1,0	H 1,0	M 1,0	N 1,0
	<u>plantas útiles:</u>					
	Glycine max.	0	20	10	45	25
	<u>plantas indeseadas:</u>					
10	Amaranthus retroflexus	0	20	0	100	100
	Chenopodium album	90	100	95	100	100
	Galinsoga parviflora	100	100	90	100	65
	Matricaria chamomilla	100	---	100	100	---
	Sinapis arvensis	85	80	90	90	75
15	Stellaria media	100	100	100	100	100

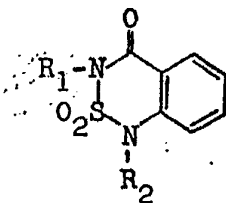
0 = sin daño
100 = destrucción total

El presente ejemplo indica que con las sustancias alistadas se logra destruir malas hierbas latifoliadas. Como cultivo se presta para las sustancias F, H, G soja (Glycine max.). Sin embargo, este cultivo no entra en consideración para los compuestos N y, en especial M, en la presente forma debido al mayor daño que producen.

N O T A

5 Descrita suficientemente la naturaleza del
 invento, así como la manera de realizarse en la prác-
 tica, debe hacerse constar que las disposiciones an-
10 teriormente indicadas, son susceptibles de modifica-
 ciones de detalle, en cuanto no alteren su principio
 fundamental. También se hace constar que el invento co-
 rresponde a una solicitud de Patente presentada en Ale-
 mania, bajo el Número P 24 44 822.4, de fecha 19 de Sep-
15 tiembre de 1974, acogiéndose por lo tanto a los benefi-
 cios que conceden los Convenios Internacionales en vi-
 gor, siendo lo que constituye la esencia del referido
 invento y, por lo que se solicita Patente de Invención
 por 20 años en España, sobre: PROCEDIMIENTO PARA LA OB-
15 TENCION DE UN 2,2-DIOXIDO DE 2,1, 3-BENZOTIADIAZIN (4)
 ONA SUSTITUIDO; caracterizándose por lo siguiente:

1. Procedimiento para la obtención de un 2,2-dióxido de 2,1,3-benzotiadiazin(4)ona sustituido, de fórmula

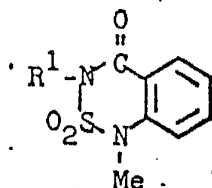


en la que R significa un grupo isopropilo y R² representa

- 5 a) un grupo formilo, un radical propionilo, n-butirilo, valerilo, isovalerilo, sec.-valerilo, capronilo, 1-(Δ -metilvalerilo), enantilo, un radical acilo con más de 8 átomos de carbono, un radical acilo sustituido por halógeno, el grupo acetoxi o alcoxi, un radical acilo en caso
10 dado sustituido por halogenofenoxi y/o alquilfenoxi, un radical acilo insaturado, en caso dado sustituido por halógeno, un radical cicloacilo o diacilo, o
- b) un radical alcoxi-carbonilo o alquilmercapto-carbonilo, un radical fenoxicarbonilo o fenilmercapto-carbonilo,
15 en caso dado sustituido por grupos alcoxi, un radical bencilmercapto-carbonilo en caso dado sustituido por halógeno, o
- c) un radical dialquilcarbamoilo en caso dado sustituido

- por grupos alcoxi, un radical dialquiltiocarbamoilo, un radical N-fenil-N',N'-dialquilformamidinilo, o
- d) un radical alquilsulfonilo o un radical arilsulfonilo en caso dado sustituido por átomos de halógeno, grupos nitro o grupos alquilo, o
- 5 e) un radical mono o dialquilsulfamoilo o
- f) un radical N-alquilbenzimidilo o
- g) un radical O,O-dialquil-fosforotioato o O,O-dialquil-fosfato o
- 10 h) un radical alquilsulfonilo en caso dado sustituido por halógeno o
- i) un radical fenilo sustituido por grupos nitro, caracterizado porque se hace reaccionar durante una media hasta 12 horas un compuesto de fórmula

15



- en la que R¹ significa un radical isopropilo y el radical Me constituye un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o amónico, con un haluro de ácido de fórmula R² Hal, en la que R² tiene el significado arriba indicado y el radical Hal significa un átomo de cloro o bromo, en un disolvente polar y
- 20 en un margen de temperatura de - 10 a 110°C.

2. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque para la obtención de 2,2-dióxido de 1-formil-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona, se hace reaccionar el 2,2-dióxido de 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin(4)ona con una solución del anhídrido de ácido acético -ácido fórmico mezclado.

5

3.- Procedimiento para la obtención de un 2,2-dióxido de 2,1,3-benzotiadiazin(4)ona sustituido, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

10

Esta Memoria consta de 71 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

16 FEB. 1977

BASE AKTIENGESELLSCHAFT

ROMEZ AGEEU Y MODET
por Firmador L. García Fernández

