

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

6 NOV. 1978

Concedido el Registro de acuerdo
con los datos que figuran en la presente descripción y según el contenido de la Memoria adjunta.

19	ES	21	NUMERO	465.929	10	A 1
22	FECHA DE PRESENTACION		12-1-1.978			



MNL

ESPAÑA

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
758.996	13-1-1977	U.S.A.
851.731	17-11-1977	"

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D//A01N	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
------------------------	--	--------------------------------------

64 TITULO DE LA INVENCION

UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVOS DERIVADOS BICICLICOS DE TRIAZOL.

71 SOLICITANTE (S)

E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY,

DOMICILIO DEL SOLICITANTE

Wilmington, Delaware, ESTADOS UNIDOS

72 INVENTOR (ES)

Anthony David Wolf, de nacionalidad estadounidense.

73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE

D. BERNARDO UNGRIA GOIBURU

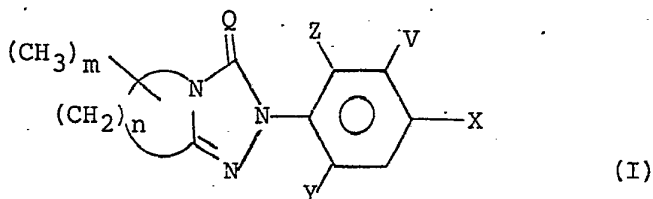
1

RESUMEN DE LA INVENCION

5

Compuestos de triazol bicíclicos sustituidos, esencialmente descritos en la fórmula I, composiciones agrícolas que los contienen y el método de uso de estos compuestos como herbicidas para el control de la vegetación indeseable en los cultivos:

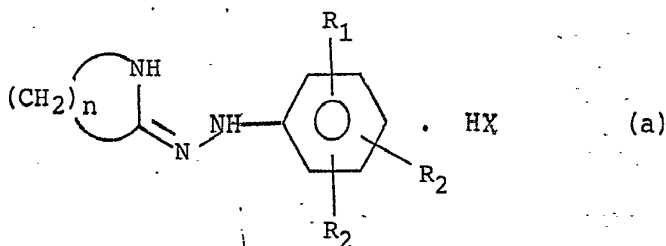
10



ANTECEDENTES DE LA INVENCION

15

En la solicitud de patente alemana publicada 1.957.783 se describen las amidrazonas (a) y se afirma que son útiles como anti-hipertensores:



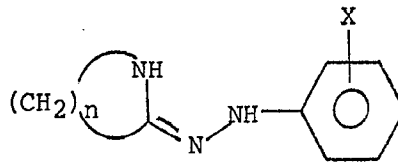
20

donde R₁, R₂ y R₃ son hidrógeno, flúor, cloro, bromo, trifluormetilo o alquilo de 1 a 3 átomos de carbono y n es 3, 4 o 5.

25

En las patentes belgas 802.446 y 802.447 se describen las arilamidrazonas sustituidas (b) como fungicidas:

1



(b)

5

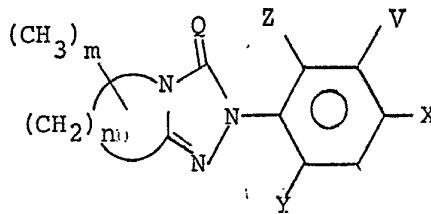
donde X puede ser flúor, cloro, bromo, yodo, nitro, metoxi, etoxi, metiltio, dimetilamino, trifluormetilo o metilsulfo- nilo y n puede ser 3, 4 o 5.

DESCRIPCION DE LA INVENCION

10

Esta invención se refiere a nuevos triazoles bicíclicos sustituidos de Fórmula I, a composiciones agrícolas que los contienen y al método de uso de estos compuestos como herbicidas para el control de la vegetación indesea- ble en importantes cultivos como maíz, remolacha azucarera y trigo:

15



(I)

20

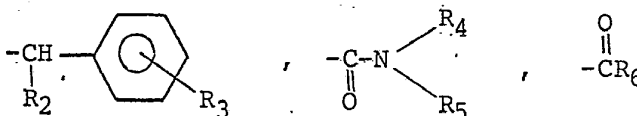
donde

V es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, hidroxí, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono u -OR₁, donde

R₁ es alquil de 1 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de flúor, cloro o bro-

25

1 mo, cicloalquilo de 4 a 6 átomos de carbono,
cicloalquilalquilo de 4 a 7 átomos de carbono,
alqueno de 3 a 6 átomos de carbono opcionalmen
5 te sustituido con 1 a 3 átomos de flúor, cloro o
bromo, alquino de 3 a 6 átomos de carbono,
CHR₇R₈ o



donde

R₂ es hidrógeno o metilo;

R₃ es hidrógeno, cloro, bromo, metilo o metoxi;

R₄ es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

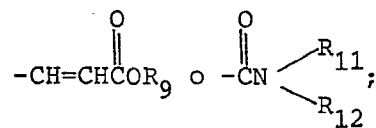
15 R₅ es hidrógeno, metilo o metoxi;

R₆ es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o alco-
xi de 1 a 4 átomos de carbono;

R₇ es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de
carbono;

20

R₈ es CO_2R_9 , CH_2OR_9 , $\text{CH}_2\text{-O-C(=O)R}_{10}$, CN , -C(=O)CH_3 ,



25

R₉ es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de
carbono;

- 1 R_{10} es alquilo de 1 a 3 átomos de carbono;
 R_{11} es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de
carbono, alquenilo de 3 o 4 átomos de car-
bono o alcoxi de 1 o 2 átomos de carbono y
5 R_{12} es hidrógeno o alquilo de 1 o 2 átomos de
carbono;

X es flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, metoxi o nitro;

Y es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo;

Z es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

10 n es 3, 4 o 5;

m es 0, 1 o 2 y

Q es oxígeno o azufre;

con la condición de que

- 15 1) cuando V es distinto de hidrógeno, Y debe ser distinto
de hidrógeno;
2) cuando m es 1, n es 4 e Y debe ser distinto de hidró-
geno;
3) cuando m es 2, n es 4, X e Y son cloro y V es $-OR_1$ don-
de R_1 es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;
20 4) cuando Q es azufre, m es 0;

y sus sales agrícolamente adecuadas.

Son preferidos por su gran actividad herbicida y/o
su precio de coste favorable los compuestos de Fórmula I
definidos anteriormente, donde, independientemente o en com-
25 binación:

1 V es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, hidróxi, metilo u
-OR₁;

X es flúor, cloro, bromo, metilo o nitro;

Y es flúor, cloro, bromo o metilo;

5 Z es hidrógeno, flúor o cloro;

n es 4 o 5 y

m es 0.

Más preferidos por su mayor actividad herbicida y/o
su precio de coste más favorable son los compuestos preferi-
10 dos anteriormente donde, independientemente o en combina-
ción:

V es hidrógeno, cloro, bromo u -OR₁ y R₁ es alquilo de 1
a 4 átomos de carbono;

X es flúor, cloro o bromo y

15 Z es hidrógeno.

Los más preferidos por su actividad herbicida inclu-
so mayor y/o su precio de coste excepcionalmente favorable
son los compuestos anteriormente preferidos donde n es 4.

Más preferidos por su notable actividad herbicida y/o
20 su precio de coste altamente favorable son los compuestos
preferidos entre todos anteriormente, donde independiente-
mente o en combinación:

V es hidrógeno, cloro u -OR₁;

X es cloro o bromo e

25 Y es flúor, cloro o bromo.

1 En especial esta combinación es la más preferida.

Son específicamente preferidos por su notabilísima actividad herbicida y/o su precio de coste altamente favorable los siguientes compuestos:

5 2-(2,4-dicloro-5-hidroxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo {4,3-A}piridin-3(2H)-ona, p.f. 211-212°C

2-(2,4-dicloro-5-propargiloxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona, p.f. 167-169°C

10 2-{2,4-dicloro-5-(1-metiletoxi) fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona (aceite)

2-(2,4-dicloro-5-metoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona, p.f. 160-163°C

2-(2,4-dicloro-5-etoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona, p.f. 130-132°C

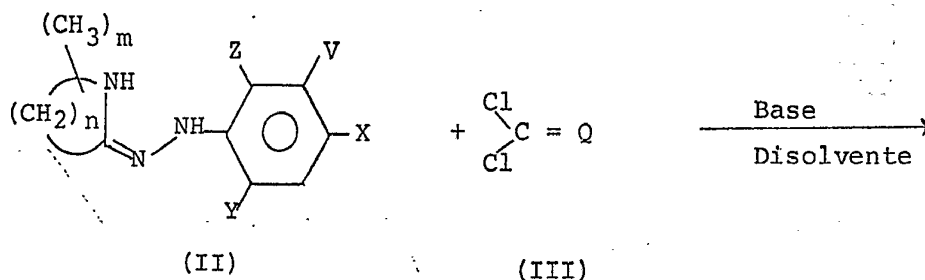
15 2-{2,4-dicloro-5-(1-metiletoxi) fenil}-2,5,6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo{4,3-A}azepin-3-ona (aceite)

SINTESIS DE LOS COMPUESTOS

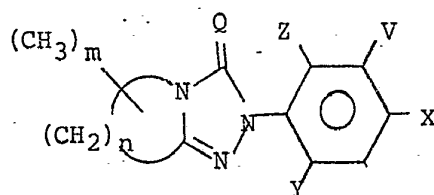
Los compuestos de esta invención pueden ser sintetizados como se describe en las ecuaciones A a G:

20

A.



1



5

(I)

10

15

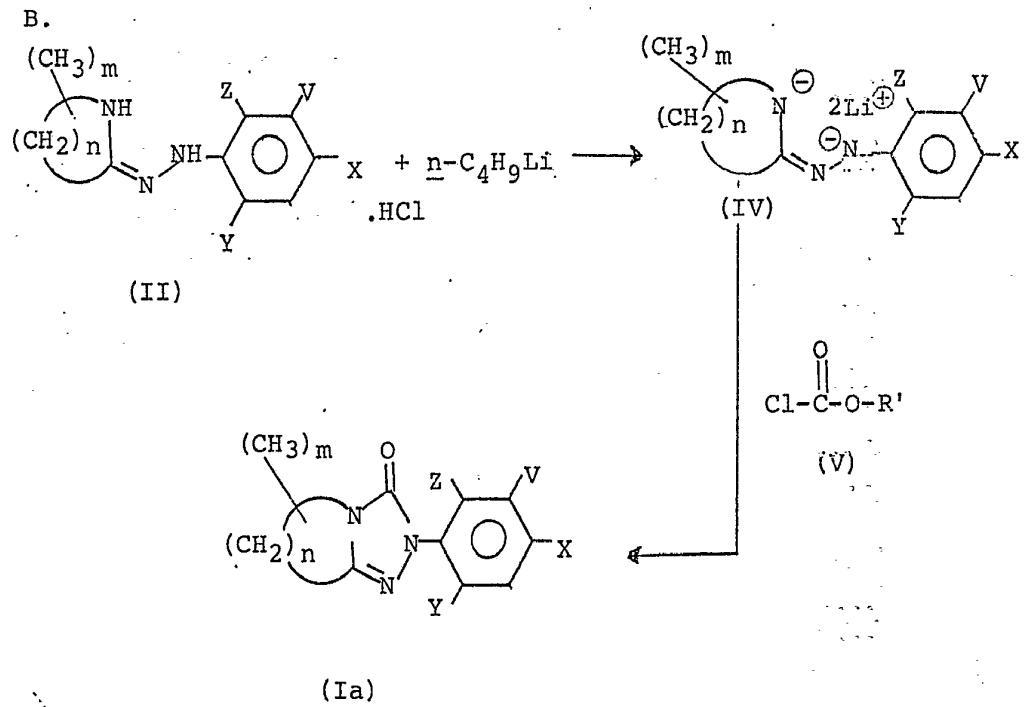
20

25

La conversión de las amidrazonas II, o de sus sales de ácido (v.g. hidroclo-
ruros), en los compuestos de Fórmula I se consigue por reacción con fosgeno (Q en la Fórmula
III es oxígeno) que da lugar a la formación de los compues-
tos de Fórmula I donde Q es oxígeno, o con tiofosgeno (Q
en la Fórmula III es azufre) que da lugar a los compuestos
de Fórmula I donde Q es azufre. La reacción se lleva a ca-
bo en un disolvente orgánico inerte adecuado, v.g. un hi-
drocarburo aromático como benceno o tolueno, un alcano clo-
rado como cloroformo o cloruro de metileno o un disolvente
de tipo etéreo como tetrahidrofurano. Para neutralizar el
ácido liberado durante la reacción, se emplea una base
adecuada tal como una amina terciaria, v.g. piridina o trietil
amina (con los disolventes hidrocarbonados, v.g. tolueno o
xileno, no es necesaria una base). Se adoptan las precau-
ciones habituales para excluir la humedad de la reacción. Para
completar la reacción, algunas veces es necesario calentar
la mezcla a reflujo durante un periodo de 1 a 24 horas. El
producto de la reacción se aísla vertiendo la mezcla de reac-
ción en agua y extrayendo el producto con un disolvente ade-

1 cuando, v.g. éter o cloruro de metileno. El extracto orgánico del producto se seca por adición de un agente desecante, v.g. sulfato sódico anhidro y el disolvente se separa por destilación o evaporación a presión reducida, quedando el
5 producto crudo. La purificación del material crudo se realiza por las técnicas habituales, v.g. cristalización, cromatografía o destilación.

Los compuestos de Fórmula I donde Q es oxígeno pueden prepararse fácilmente por el procedimiento mostrado en la
10 Ecuación B.



15

20

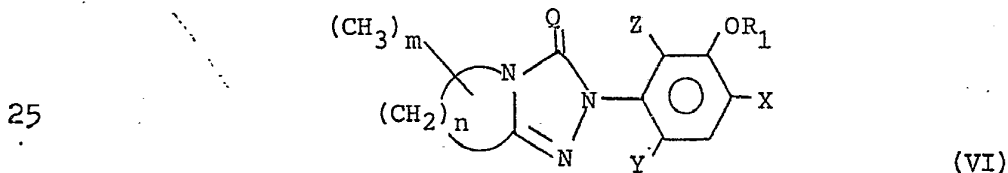
25

La sal de ácido de la amidrazona II en un disolvente adecuado, v.g. tetrahidrofurano anhidro, se hace reaccionar

1 con tres equivalentes de n-butil-litio que genera el dianión
de amidrazina IV. Si se emplea la base libre de amidrazona,
solamente son necesarios dos equivalentes de n-butil-litio
5 para generar el dianión IV. Por lo demás, en todas las reac-
ciones de la Ecuación B pueden utilizarse las mismas condi-
ciones. La temperatura de reacción se mantiene entre -10° y
 $+10^{\circ}$ C. Una vez completada la adición del n-butil-litio, la
mezcla de reacción se agita durante un breve periodo de tiem-
10 po (v.g. entre 5 y 30 minutos) mientras se mantiene la misma
temperatura. Después se agrega un equivalente de un cloroformiato
de alquilo donde R' es un grupo alquilo de 1 a 3 áto-
mos de carbono, v.g. cloroformiato de metilo, manteniendo de
nuevo la temperatura entre -10° y $+10^{\circ}$ C. La reacción se ter-
mina agitando a la temperatura ambiente o a reflujo de la mez-
15 cla de reacción durante un periodo de 1 a 24 horas. El produc-
to Ia puede ser aislado como se ha descrito antes.

Para las amidrazonas que contienen un grupo reactivo en
el anillo bencénico, v.g. bromo, ciano o nitro, el método con
butil-litio de la Ecuación B puede no funcionar bien. En ese
20 caso, puede utilizarse el método del fosgeno descrito en la
Ecuación A.

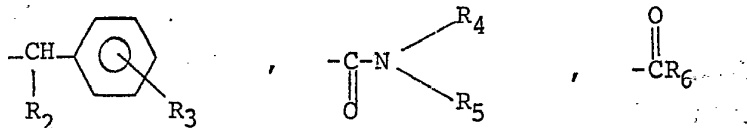
Los compuestos de esta invención de Fórmula VI:



1 donde n, m, Q, X, Y y Z son los determinados en la Fórmula I
y V es OR₁,

donde

5 R₁ es alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, opcionalmente
sustituído con 1 a 3 átomos de flúor, cloro o bromo,
cicloalquilo de 4 a 6 átomos de carbono, cicloalquil-
alquilo de 4 a 7 átomos de carbono, alqueno de 3
a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido con 1
a 3 átomos de flúor, cloro o bromo, alquino de 3 a
10 6 átomos de carbono, -CHR₇R₈ o



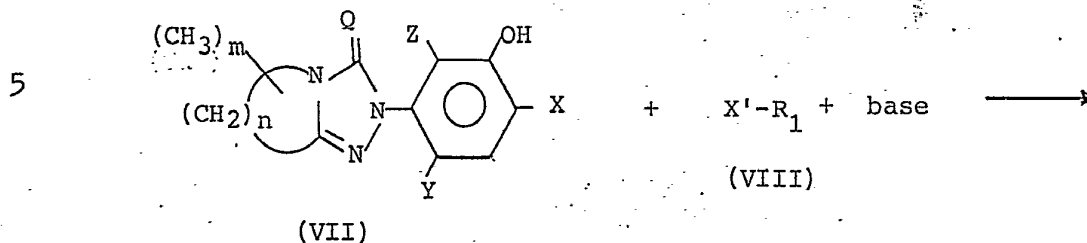
donde

15 R₂ es hidrógeno o metilo;
R₃ es hidrógeno, cloro, bromo, metilo o metoxi;
R₄ es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;
R₅ es metilo o metoxi;
R₆ es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi
20 de 1 a 4 átomos de carbono;
R₇ es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de car-
bono;

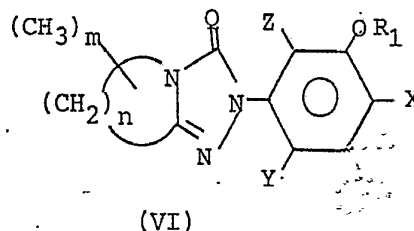
25 R₈ es CO₂R₉, CN, $\overset{\text{O}}{\parallel}\text{-CCH}_3$, $\text{-CH=CH}\overset{\text{O}}{\parallel}\text{COR}_9$ y
R₉ es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,

1 se preparan lo mejor posible en la forma descrita en la Ecuación C.

C.



10



15

El fenol VII se combina con un haluro VIII apropiado, donde R₁ tiene el significado definido para los compuestos de Fórmula VI, X' es halógeno, v.g. bromuro o yoduro, y una cantidad equivalente de una base adecuada, v.g. carbonato potásico, hidróxido sódico, hidruro sódico, etc, en un disolvente, v.g. acetonitrilo, acetona, dimetilformamida, etc. La adición de un yoduro de metal alcalino, v.g. yoduro sódico, puede facilitar la reacción. La mezcla de reacción se calienta a reflujo durante varias horas, v.g. 1-24 horas. Se obtiene el producto crudo vertiendo la mezcla de reacción en agua. El producto se extrae en un disolvente, v.g. cloruro

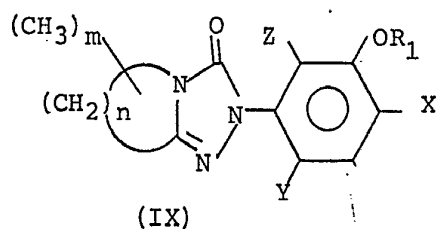
25

1 de metileno. La solución del producto se seca con un agente
desecante, v.g. sulfato sódico anhidro y después se separa el
disolvente por evaporación en un evaporador rotatorio. El pro-
ducto crudo así obtenido puede ser purificado de nuevo por
5 las técnicas habituales, v.g. cromatografía o cristalización.

Los fenoles VII de la Ecuación C (o sus sales agrícola-
mente adecuadas, v.g. sodio, potasio, litio, trietilamonio,
etc) son compuestos nuevos y herbicidas activos. Los fenoles
de Fórmula VII se preparan a partir de las correspondientes
10 amidrazonas (Fórmula II donde V es OH) como se ha descrito
en la Ecuación A. Adicionalmente, los fenoles de Fórmula X
(Q es oxígeno en la Fórmula VI) pueden prepararse por hidrólisis
ácida de un compuesto de Fórmula IX (donde R₁ es alqui-
lo de 1 a 6 átomos de carbono) como muestra la Ecuación D.

15

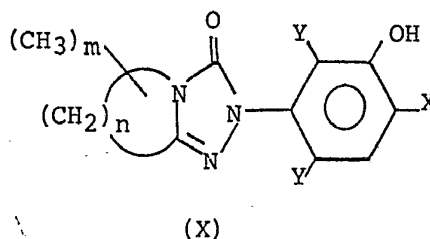
D.



hidrólisis ácida



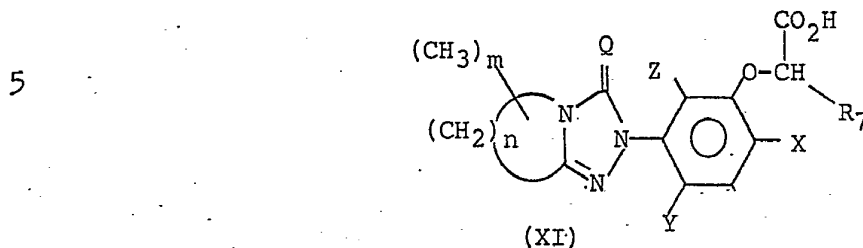
20



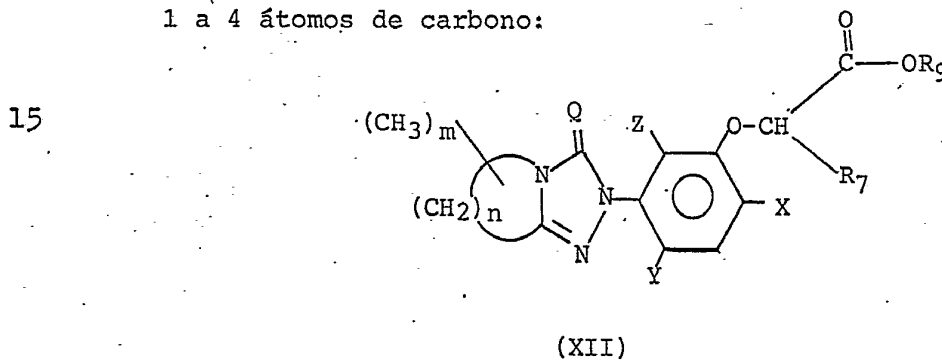
25

1 Entre los ácidos adecuados se encuentran el ácido sulfúrico concentrado y el ácido bromhídrico concentrado.

Los ácidos carboxílicos de Fórmula XI:



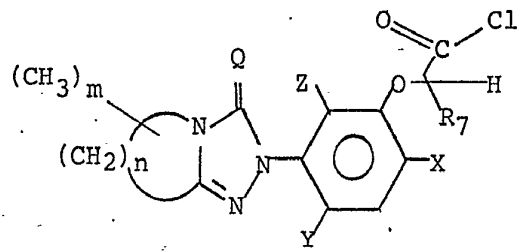
10 preparados como se ha descrito en la Ecuación C, donde n, m, O, X, Y, Z y R₇ son los definidos en la Fórmula I, se preparan más fácilmente por hidrólisis ácida o básica de ésteres relacionados de Fórmula XII donde R₉ es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono:



20 Cuando se hacen reaccionar los ácidos carboxílicos XI con cloruro de tionilo, en condiciones muy conocidas en este campo para la conversión de un ácido carboxílico en un cloruro de ácido carboxílico, se obtienen los compuestos de

25 Fórmula XIII:

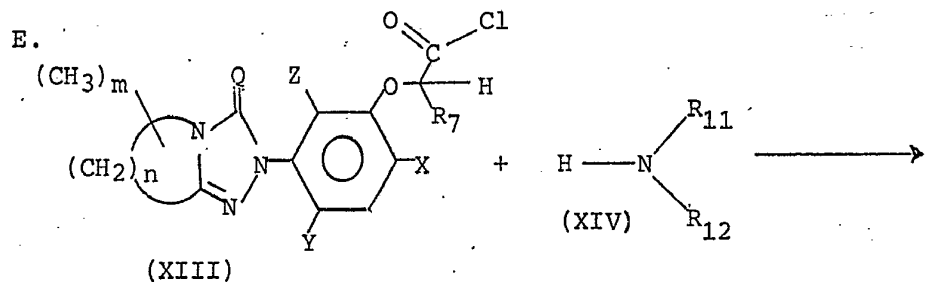
1



5

Por reacción de los compuestos XIII con una amina IV, donde R_{11} y R_{12} son los definidos para los compuestos de fórmula I, de acuerdo con la Ecuación E, empleando condiciones muy conocidas en la bibliografía para la conversión de cloruros de ácido en amidas, se obtienen las amidas de ácido carboxílico de Fórmula XV:

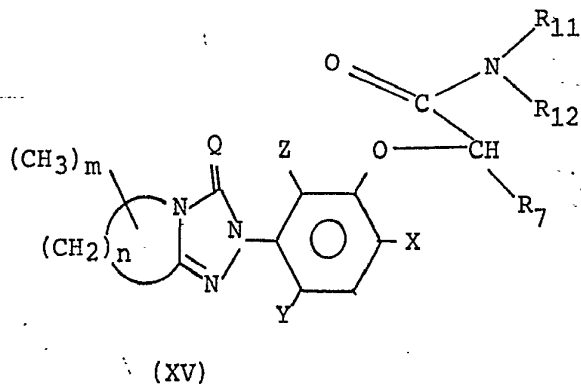
10



15

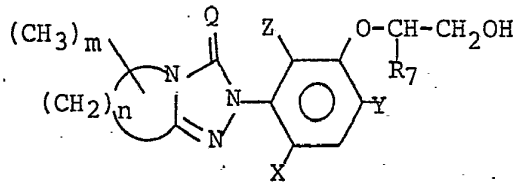
20

25



1

Los compuestos de esta invención de Fórmula XVI:



5

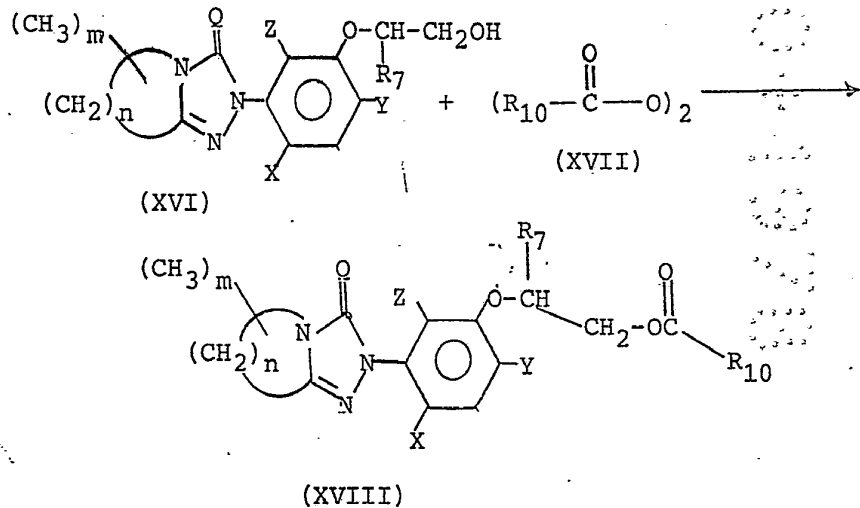
donde n , m , Q , X , Y , Z y R_7 son los definidos en la Fórmula I, pueden prepararse por reducción directa de ésteres de ácidos carboxílicos XII con un agente reductor adecuado, v.g. borohidruro de litio, en un disolvente apropiado, v.g. tetrahidrofurano.

10

Por tratamiento de los alcoholes XVI con el anhídrido XVII apropiado se forma el éster XVIII de esta invención, donde R_{10} es el definido en la Fórmula I (Ecuación F).

15

F.



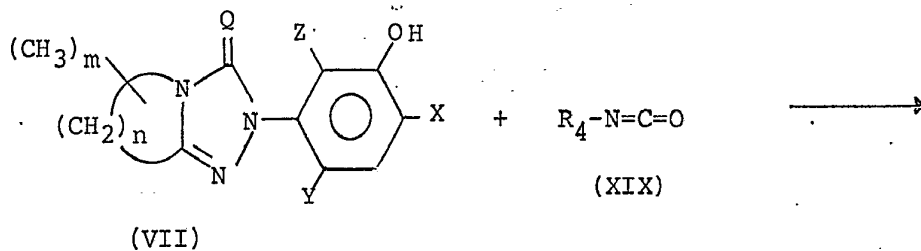
20

25

1 Por reacción de los fenoles VII con los isocianatos
apropiados XIX, donde R_4 es alquilo de 1 a 4 átomos de car-
bono, se forma el compuesto XX donde R_4 es el definido en
la Fórmula I (Ecuación G).

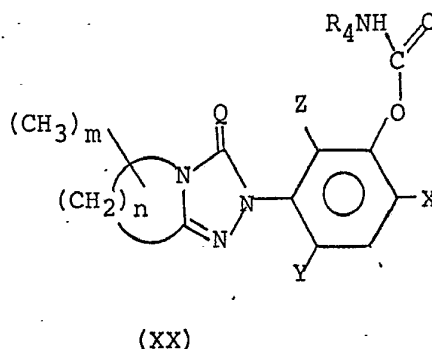
5

G.



10

15



20

Los siguientes ejemplos ilustran mejor la preparación
de los compuestos de esta invención. Salvo indicación en con-
trario, todas las partes se dan en peso y todas las tempera-
turas en grados centígrados.

EJEMPLO 1

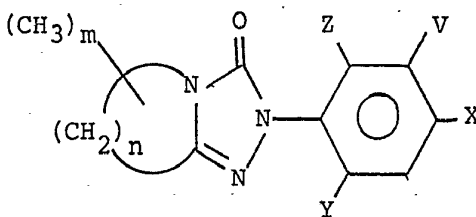
Preparación de 2-(2,4-diclorofenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-
triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)ona

25

Se combinan 9,0 partes del hidrocioruro de 2,4-diclorofe

1 nilhidrazona de la 2-piperidona, preparado por métodos si-
 milares a los descritos en la solicitud de patente alemana
 publicada 2.235.113 y en la solicitud de patente alemana
 publicada 2.235.177, con 200 partes de tetrahidrofurano seco
5 y se enfría a -10°C en atmósfera de nitrógeno. A esta solu-
 ción se añaden gota a gota 37,2 partes de una solución de
 1,6 moles de n-butil-litio ($d = 0,68$) en hexano, mientras se
 mantiene la temperatura de la reacción entre -10° y $+10^{\circ}\text{C}$.
 La mezcla de reacción se agita durante unos 15 minutos des-
10 pués de la adición del n-butil-litio. Después se añaden go-
 ta a gota 3,0 partes de cloroformiato de metilo mientras se
 mantiene la temperatura entre -10° y $+10^{\circ}\text{C}$. Una vez comple-
 tada la adición del cloroformiato, la mezcla de reacción se
 deja calentar a la temperatura ambiente sin refrigerar. Des-
15 pués se agita durante 30 minutos. La mezcla de reacción cru-
 da se vierte en 500 partes de agua. La solución acuosa se
 extrae tres veces con 200 partes de cloruro de metileno. Los
 extractos crudos se combinan y se secan sobre sulfato sódi-
 co anhidro y después se filtran. Se separa el disolvente del
20 filtrado por evaporación a una presión reducida de 50-300 mm
 en un evaporador rotatorio. El producto crudo se purifica por
 cromatografía en columna seca sobre alúmina y se obtienen
 5,4 partes de producto en forma de aceite que solidifica des-
 pués de permanecer en reposo durante 3 días (p.f. $100-104^{\circ}\text{C}$).
25 Empleando un procedimiento análogo al del Ejemplo 1,

1 con las amidrazonas apropiadas y cloroformiato de metilo,
pueden prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I,
(donde Q es oxígeno) (salvo indicación en contrario, en la
columna titulada "Propiedades", se da el punto de fusión
5 en °C).



15

20

25

1

		Propiedades físicas				
n	Y	X	V	Z	m	
4	H	CH ₃	H	H	0	Cera - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,5 (s, 3H), 2,5 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 7,9 (A, A', B, B', 4H)
4	Cl	Cl	Cl	H	0	Ácete - RMN (CDCl ₃) δ : 2,1 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,9 (m, 4H), 7,95 (s, 1H), 8,02 (s, 1H)
4	CH ₃	Cl	H	H	0	117-118°
4	F	Cl	H	H	0	134-137°
4	H	Cl	H	H	0	120-122°
4	H	OCH ₃	H	H	0	110-113°
4	F	F	H	F	0	116-118°
4	Cl	CH ₃	H	H	0	91-92°
4	Cl	Cl	H	Cl	0	Ácete - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,8 (m, 2H), 3,8 (m, 2H), 7,3 (s, 2H)
4	Cl	Cl	F	H	0	
4	Cl	Cl	CH ₃	H	0	
4	Cl	Cl	CH ₃	H	0	
4	Cl	Cl	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -	H	0	
4	Cl	Cl	-CH-(CH ₃) ₂ -	H	0	

10

15

20

25

1

5

10

15

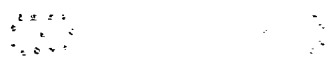
20

25

<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>
4	H	CH ₃	H	H	0
4	Cl	Cl	Cl	H	0
4	CH ₃	Cl	H	H	0
4	F	Cl	H	H	0
4	H	Cl	H	H	0
4	H	OCH ₃	H	H	0
4	F	F	H	F	0
4	Cl	CH ₃	H	H	0
4	Cl	Cl	H	Cl	0
4	Cl	Cl	F	H	0
4	Cl	Cl	CH ₃	H	0
4	Cl	Cl	CH ₃	H	0
4	Cl	Cl	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -	H	0
4	Cl	Cl	-CH-(CH ₃) ₂ -	H	0

<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Propiedades físicas</u>
H	0	Cera - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,5 (s, 3H), 2,5 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 7,9 (A, A', B, B', 4H)
H	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,1 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,9 (m, 4H), 7,95 (s, 1H), 8,02 (s, 1H)
H	0	117-118°
H	0	134-137°
H	0	120-122°
H	0	110-113°
F	0	116-118°
H	0	91-92°
Cl	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,8 (m, 2H), 3,8 (m, 2H), 7,3 (s, 2H)
H	0	
H	0	
H	0	
H	0	
H	0	

CH₂-
2-



1

n	Y	X	V	Z	m	Propiedades físicas
4	Cl	Cl	-CH-(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	0	Aceite - Bandas IR: 1725, 1600 cm ⁻¹
4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,9 (n, 4H), 4,0 (m, 5H), 7,4 (s, 1H), 7,9 (s, 1H)
3	Cl	Cl	OCH ₃	H	0	
3	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	0	
3	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 1,4 (d, 6H), 3,0 (m, 4H) (t, 2H), 4,6 (m, 1H), 7,3 (s, 1H) (s, 1H)
3	Cl	Cl	H	H	0	Aceite - Bandas IR: 1720, 1620, 865, 830 cm ⁻¹
5	Cl	Cl	OCH ₃	H	0	100-102°
5	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	0	
5	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	0	Aceite - Bandas IR: 1690, 1240, 1120 cm ⁻¹
5	Cl	Cl	O(CH ₂) ₂ CH ₃	H	0	
5	Cl	Cl	H	H	0	123-126°
5	Cl	Cl	Cl	H	0	
5	F	Cl	H	H	0	125-128°
5	H	F	H	H	0	72-77°

20

25

1

<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	
4	Cl	Cl	-CH-(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	
4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	
5	3	Cl	Cl	OCH ₃	H
3	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	
3	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	
3	Cl	Cl	H	H	
5	Cl	Cl	OCH ₃	H	
5	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	
5	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	
15	5	Cl	Cl	O(CH ₂) ₂ CH ₃	H
5	Cl	Cl	H	H	
5	Cl	Cl	Cl	H	
5	F	Cl	H	H	
5	H	F	H	H	

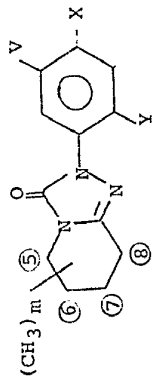
20

25

CH₂CH₃

Z	m	Propiedades físicas
H	0	
H	0	Aceite - Bandas IR: 1725, 1600 cm ⁻¹
H	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,9 (n, 4H), 4,0 (m, 5H), 7,4 (s, 1H), 7,9 (s, 1H)
H	0	
H	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 1,4 (d, 6H), 3,0 (m, 4H) (t, 2H), 4,6 (m, 1H), 7,3 (s, 1H) (s, 1H)
H	0	Aceite - Bandas IR: 1720, 1620, 865, 830 cm ⁻¹
H	0	100-102°
H	0	
H	0	Aceite - Bandas IR: 1690, 1240, 1120 cm ⁻¹
H	0	
H	0	123-126°
H	0	
H	0	125-128°
H	0	72-77°

3



Propiedades físicas

n	Y	X	V	Z	m	Propiedades físicas
4	Cl	Cl	OCH ₃	H	5-CH ₃	Aceite - Bandas IR: 1680, 1515 cm ⁻¹ 98-101'
4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	5-CH ₃	
4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	6-CH ₃	
4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	6-CH ₃	
4	Cl	Cl	OCH ₃	H	6-CH ₃	
4	Cl	Cl	OCH ₃	H	7-CH ₃	
4	Cl	Cl	H	H	7-CH ₃	
4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	7-CH ₃	
4	Cl	Cl	H	H	8-CH ₃	
4	Cl	Cl	H	H	8-CH ₃	

Aceite - Bandas IR: 1680,
1515 cm⁻¹

98-101'

Aceite - Bandas IR: 1690,
1560 cm⁻¹

1

5

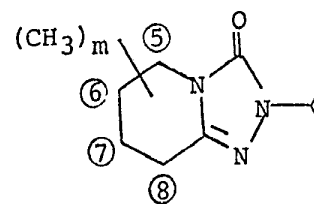
10

15

20

25

1

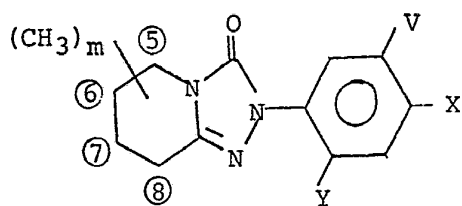


5

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>
	4	Cl	Cl	OCH ₃
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
10	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
	4	Cl	Cl	OCH ₃
	4	Cl	Cl	OCH ₃
15	4	Cl	Cl	H
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	4	Cl	Cl	H

20

25



<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Propiedades físicas</u>
OCH ₃	H	5-CH ₃	
OCH(CH ₃) ₂	H	5-CH ₃	
OCH(CH ₃) ₂	H	6-CH ₃	
OCH ₂ CH ₃	H	6-CH ₃	
OCH ₃	H	6-CH ₃	
OCH ₃	H	7-CH ₃	Aceite - Bandas IR: 1680, 1515 cm ⁻¹
H	H	7-CH ₃	98-101~
OCH(CH ₃) ₂	H	7-CH ₃	
H	H	8-CH ₃	Aceite - Bandas IR: 1690, 1560 cm ⁻¹

1

	<u>n</u>	<u>y</u>	<u>x</u>	<u>v</u>	<u>z</u>	<u>m</u>	<u>Propiedades físicas</u>
5	4	Cl	Cl	OCH ₃	H	8-CH ₃	Aceite - ₁ Bandas IR: 1700, 1570 cm ⁻¹
	4	Cl	Cl	O-CH(CH ₃) ₂	H	8-CH ₃	Aceite - ₁ Bandas IR: 1700, 1580 cm ⁻¹
10	4	Cl	Cl	OCH ₃	H	6-(CH ₃) ₂	Aceite - ₁ Bandas IR: 1710, 1580 cm ⁻¹
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	8-(CH ₃) ₂	Aceite - ₁ Bandas IR: 1710, 1570 cm ⁻¹

15

20

25

1

5

<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>
4	Cl	Cl	OCH ₃
4	Cl	Cl	O-CH(Cl
4	Cl	Cl	OCH ₃

10

4	Cl	Cl	OCH(CH ₃
---	----	----	---------------------

15

20

25

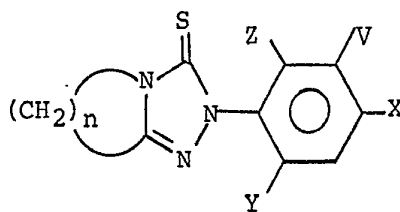
<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Propiedades físicas</u>
Cl	OCH ₃	H	8-CH ₃	Aceite - Bandas IR: 1700, 1570 cm ⁻¹
Cl	O-CH(CH ₃) ₂	H	8-CH ₃	Aceite - Bandas IR: 1700, 1580 cm ⁻¹
Cl	OCH ₃	H	6-(CH ₃) ₂	Aceite - Bandas IR: 1710, 1580 cm ⁻¹
Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	8-(CH ₃) ₂	Aceite - Bandas IR: 1710, 1570 cm ⁻¹

EJEMPLO 2

Preparación de 2-(2,4-diclorofenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3-(2H)tiona

Se combinan 4,5 partes del hidrocloreuro de la 2,4-diclorofenilhidrazona de la piperidona con 100 partes de tetrahidrofurano seco y 4,6 partes de trietilamina. A esta mezcla se añaden 2,1 partes de tiofosgeno. La mezcla de reacción se calienta a reflujo durante 5 horas, transcurridas las cuales se filtra la mezcla a través de 200 partes de alúmina de grado de actividad II (adquirida de la ICN Life Science, Cleveland, Ohio). El producto crudo se separa de la alúmina por lavado con 500 partes de tetrahidrofurano. El filtrado se concentra a una presión reducida de 50-300 mm en un evaporador rotatorio. El producto crudo obtenido se cristaliza en una mezcla de benceno-hexano. Se obtienen 1,0 partes del producto que funde a 118-120°C.

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 2, con la amidrazona apropiada y tiofosgeno, pueden prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I (donde Q es azufre).

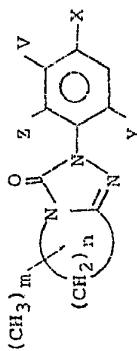


Propiedades físicas						
L	n	y	x	v	z	
	4	Cl	Cl	H	H	118-120°
	4	H	NO ₂	H	H	171-172°
	4	H	Cl	H	H	136-140°
5	4	Cl	Cl	OCH ₃	H	
	4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	
	4	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	H	
	4	F	Cl	H	H	112-116°
10	5	Cl	Cl	H	H	Cera - Bandas IR: 1605, 855 cm ⁻¹
	5	H	NO ₂	H	H	Aceite - Bandas IR: 1610, 1030, 800 cm ⁻¹
	5	H	Cl	H	H	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 1,9 (m, 6H), 3,0 (m, 2H), 4,0 (s, 3H), 4,4 (m, 2H), 7,3 (s, 1H), 7,8 (s, 1H)
	5	Cl	Cl	OCH ₃	H
15	5	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	
	5	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H
	5	Cl	Br	OCH ₃	H

1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>
	4	Cl	Cl	H
	4	H	NO ₂	H
	4	H	Cl	H
5	4	Cl	Cl	OCH ₃
	4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	4	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
	4	F	Cl	H
10	5	Cl	Cl	H
	5	H	NO ₂	H
	5	H	Cl	H
	5	Cl	Cl	OCH ₃
15	5	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
	5	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	5	Cl	Br	OCH ₃
20				

		<u>Propiedades físicas</u>
<u>V</u>	<u>Z</u>	118-120°
H	H	
H	H	171-172°
H	H	136-140°
OCH ₃	H	
OCH ₂ CH ₃	H	Aceite - Bandas IR: 1580, 1240, 1120 cm ⁻¹
OCH(CH ₃) ₂	H	
OCH ₂ CH ₃	H	112-116°
H	H	
H	H	Cera - Bandas IR: 1605, 855 cm ⁻¹
H	H	Aceite - Bandas IR: 1610, 1030, 800 cm ⁻¹
H	H	Aceite - RMN. (CDCl ₃) δ : 1,9 (m, 6H), 3,0
OCH ₃	H	(m, 2H), 4,0 (s, 3H), 4,4 (m, 2H), 7,3
		(s, 1H), 7,8 (s, 1H)
	
OCH ₂ CH ₃	H	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 1,5 (d, 6H), 2,0
OCH(CH ₃) ₂	H	(m, 6H), 3,0 (m, 2H), 4,1-5,0 (m, 3H),
		7,5 (s, 1H), 8,0 (s, 1H)
OCH ₃	H	

1 Empleando un procedimiento análogo al del Ejemplo 2, con la amidrazona apropiada y fosgeno, pueden prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I (donde Q es oxígeno).



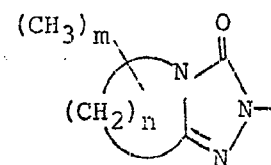
n	Y			X	V			Z			m	Propiedades físicas
	n	Y	X		n	V	Z	m				
4	4	F	Br	H	0							
	4	Cl	NO ₂	H	0							204-209°
10	4	H	CN	H	0							164-165°
	4	Cl	Br	H	0							136-139°
	4	Cl	NO ₂	OCH(CH ₃) ₂	0							141-143°
	4	Cl	Cl	OH	0							198-201°
	4	Cl	Cl	OCH ₃	0							152-153°
15	4	Br	Cl	H	0							Aceite - RMN (DMSO-d ₆) δ : 1,9 (m, 4H), 2,7 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 7,6 (m, 2H), 7,9 (m, 1H)
	4	Cl	Cl	H	0							Vidrio - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,8 (m, 2H), 3,8 (m, 2H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H)
	4	Cl	Cl	Br	0							

20

5	Cl	NO ₂	H	0	0	138-141°
5	Cl	Cl	OH	0	0	

25

1 Empleado un procedimiento análogo al del
fosgeno, pueden prepararse los siguientes compuest

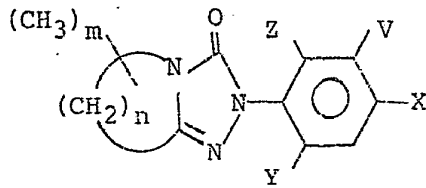


5

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	
	4	F	Br	H	
	4	Cl	NO ₂	H	
10	4	H	CN	H	
	4	Cl	Br	H	
	4	Cl	NO ₂	OCH(CH ₃) ₂	
	4	Cl	Cl	OH	
	4	Cl	Cl	OCH ₃	
15	4	Br	Cl	H	
	4	Cl	Cl	H	
	4	Cl	Cl	Br	
20					
	5	Cl	NO ₂	H	0
	5	Cl	Cl	OH	0

25

diminuto análogo al del Ejemplo 2, con la amidrazona apropiada y los siguientes compuestos de Fórmula I (donde Q es oxígeno).



V	Z	m	Propiedades físicas
H	H	0	
H	H	0	204-209°
H	H	0	164-165°
H	H	0	136-138°
OCH(CH ₃) ₂	H	0	141-143°
OH	Br	0	198-201°
OCH ₃	Br	0	152-153°
H	H	0	Aceite - RMN (DMSO-d ₆) δ : 1,9 (m, 4H), 2,7 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 7,6 (m, 2H), 7,9 (m, 1H)
H	Br	0	
Br	H	0	Vidrio - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,8 (m, 2H), 3,8 (m, 2H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H)
H	O	0	138-141°
OH	O	0	

1

EJEMPLO 3

Preparación de 2-(2,4-dicloro-5-hidroxifenil)-5,6,7,8-tetra-
hidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)ona

5

Se combinan 42,8 partes de 2-(2,4-dicloro-5-(1-metil-
etoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piri-
din-3(2H)-ona, preparada por un procedimiento análogo al
del Ejemplo 1, con 45,6 g de ácido bromhídrico concentrado

10

(al 48 %). La mezcla se calienta a reflujo durante 4 horas.
Se añaden 15 partes de ácido bromhídrico concentrado (48 %)
a la mezcla a reflujo y se continúa calentando durante 3
horas más. La mezcla de reacción se deja enfriar a la tem-

15

peratura ambiente, después de lo cual se vierte en 1 litro
de agua. El producto crudo obtenido por filtración se agre-
ga después sobre 500 partes de agua. Se ajusta el pH a 12-
14 con una solución acuosa de hidróxido sódico al 50 %. Des-
pués la solución acuosa del producto se extrae tres veces con
250 partes de cloruro de metileno. Se desprecian los extrac-

20

tos orgánicos. La capa acuosa se acidula con ácido clorhídri-
co concentrado (38 %) a pH 2-3. Precipita el producto que
se filtra. El producto se purifica de nuevo por cristaliza-
ción en una mezcla de metanol y acetato de etilo. El rendi-
miento es de 15,5 partes de producto con un punto de fusión
de 211-212°.

25

1

EJEMPLO 4

Preparación de 2-{2,4-dicloro-5-(2-cloroetoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)ona

5

Se combinan 3,0 partes de 2-(2,4-dicloro-5-hidroxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)ona, preparada como se ha descrito en el Ejemplo 3, 1,4 partes de 1-bromo-2-cloroetano, 1,5 partes de carbonato potásico anhidro y 20 partes de acetonitrilo seco y se calienta a reflujo durante 6 horas seguidas de agitación durante 72 horas a la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vierte en 200 partes de agua. La suspensión acuosa del producto se extrae tres veces con 200 partes de cloruro de metileno. Los extractos orgánicos del producto se secan con sulfato sódico anhidro. Se destila el disolvente para separarlo del producto a presión reducida en un evaporador rotatorio. El aceite oscuro resultante se cristaliza en éter dando 0,2 partes de un sólido pardo pálido, p.f. 148-150°.

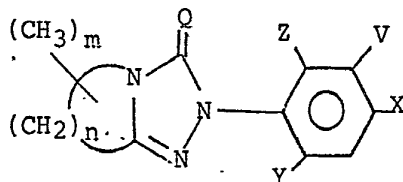
10



15



20

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 4, con el fenol apropiado de Fórmula VII y un haluro de Fórmula VIII, pueden prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I.


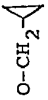
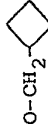
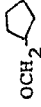

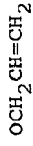
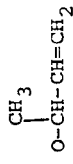
25



l	n	y	x	v	z	m	o	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl	OCH ₃	H	0	0	160-163°
	4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	0	0	130-132°
5	4	Cl	Cl	O-CH(CH ₃) ₂	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1725, 1250, 1120 cm ⁻¹
	4	Cl	Cl	O-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	0	0	94-96°
	4	Cl	Cl	O-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	0	0	114-116°
	4	Cl	Cl	O-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ: 1,1 (0,1, 6H), 1,9 (m, 5H), 2,8 (m, 2H), 3,8 (m, 4H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
10	4	Cl	Cl	O-CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ: 0,8-2,2 (m, 12H), 2,8 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 4,4 (q, 1H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
	4	Cl	Cl	OCHCH ₂ CH ₂ CH ₃ CH ₃	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ: 0,5-2,5 (m, 14H), 3,0 (m, 2H), 4,0 (m, 2H), 4,6 (m, 1H); 7,5 (s, 1H), 8,0 (s, 1H)
15	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂	H	0	0	
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃	H	0	0	
	4	Cl	Cl	O- 	H	0	0	
20	4	Cl	Cl	O- 	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1680, 1560 cm ⁻¹


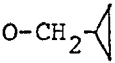
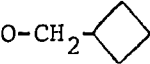
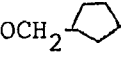
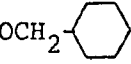
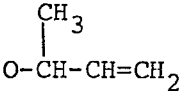
	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>π</u>
1	4	Cl	Cl	OCH ₃	H	0
	4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	H	0
	4	Cl	Cl	O-CH(CH ₃) ₂	H	0
5	4	Cl	Cl	O-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	0
	4	Cl	Cl	O-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	0
	4	Cl	Cl	O-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	H	0
10	4	Cl	Cl	O-CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	0
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{OCHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	0
	4	Cl	Cl	OCH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	0
15	4	Cl	Cl	OCH(CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃	H	0
	4	Cl	Cl		H	0
	4	Cl	Cl		H	0
20	<hr/>					
25						







	Z	m	Q	Propiedades físicas
	H	0	0	160-163°
I ₃	H	0	0	130-132°
(H ₃) ₂	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1725, 1250, 1120 cm ⁻¹
) ₂ CH ₃	H	0	0	94-96°
) ₃ CH ₃	H	0	0	114-116°
·CH(CH ₃) ₂	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 1,1 (0,1, 6H), 1,9 (m, 5H), 2,8 (m, 2H), 3,8 (m, 4H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
H ₃ -CH ₂ CH ₃	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 0,8-2,2 (m, 12H), 2,8 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 4,4 (q, 1H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
CH ₂ CH ₃	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 0,5-2,5 (m, 14H), 3,0 (m, 2H), 4,0 (m, 2H), 4,6 (m, 1H), 7,5 (s, 1H), 8,0 (s, 1H)
2CH ₃) ₂	H	0	0	
3) (CH ₂) ₃ CH ₃	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1680, 1560 cm ⁻¹

	n	Y	X	V	Z	m	C	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl		H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1680, 1560 cm ⁻¹
5	4	Cl	Cl		H	0	0	116-119°
	4	Cl	Cl		H	0	0	
10	4	Cl	Cl		H	0	0	
	4	Cl	Cl		H	0	0	
15	4	Cl	Cl		H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃ -S) δ : 1,9 (m, 4H), 1,7 (m, 2H), 2,7 (m, 2H), 4,6 (m, 2H), 5,2-6,5 (m, 3H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
	4	Cl	Cl		H	0	0	

20

25

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>
1				
	4	Cl	Cl	
5				
	4	Cl	Cl	
	4	Cl	Cl	
10				
	4	Cl	Cl	
	4	Cl	Cl	
15				
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
	4	Cl	Cl	
20	<hr/>			
25				

V	Z	m	Q	Propiedades físicas
	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1680, 1560 cm ⁻¹
-CH ₂ - 	H	0	0	116-119°
-CH ₂ - 	H	0	0	
CH ₂ - 	H	0	0	
CH ₂ - 	H	0	0	
CH ₂ CH=CH ₂	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃ -S) δ : 1,9 (m, 4H), 1,7 (m, 2H), 2,7 (m, 2H), 4,6 (m, 2H), 5,2-6,5 (m, 3H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
 -CH-CH=CH ₂	H	0	0	

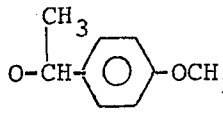
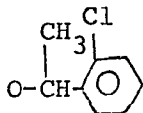
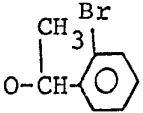
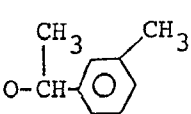
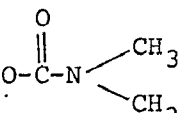
	n	y	x	v	z	m	q	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H	0	0	167-169°
10	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{H} \end{array}$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
15	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	0	0	RMN CDCl_3 , δ : 2,0 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,5 (m, 2H), 5,2 (s, 2H), 7,5-8,0 (m, 7H).

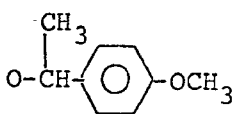
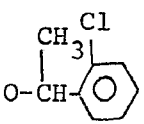
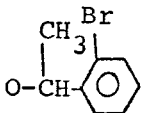
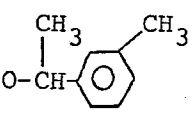
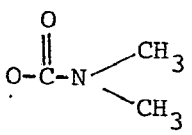
20

25

	<u>n</u>	<u>y</u>	<u>x</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
1	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3 \end{array}$	H
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H
10	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{H} \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3 \end{array}$	H
15	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H
20	<hr/>				
25					

<u>γ</u>	<u>z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
CH-CH ₃	H	0	0	
CH-CH ₂ CH ₃	H	0	0	
CH	H	0	0	167-169°
-CH ₂ CH ₃	H	0	0	
-H	H	0	0	
-CH ₃	H	0	0	
>>	H	0	0	
>	H	0	0	RMN CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 5,2 (s, 2H), 7,5-8,0 (m, 7H).

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
1	4	Cl	Cl		H
5	4	Cl	Cl		H
10	4	Cl	Cl		H
15	4	Cl	Cl		H
	4	Cl	Cl		H
20	<hr/>				
25					

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	

	n	y	x	v	z	m	o	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl	<chem>CCN(C)C(=O)O</chem>	H	0	0	
5	4	Cl	Cl	<chem>CCN(C)C(=O)OCC</chem>	H	0	0	
10	4	Cl	Cl	<chem>CCN(C)C(=O)OCCCC</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>CCN(C)C(=O)OC</chem>	H	0	0	
15	4	Cl	Cl	<chem>CC(=O)O</chem>	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,4 (s, 3H), 2,7 (m, 2H), 3,8 (m, 2H), 7,56 (s, 1H), 7,8 (s, 1H)
	4	Cl	Cl	<chem>CC(=O)OCC</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>CC(=O)OC</chem>	H	0	0	

20

25

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>
1	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	0
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	0
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	0
10	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{OCH}_3 \end{array} \end{array}$	H	0
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	0
15	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	H	0
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{l} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{CH} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H	0

20

25

	Z	m	Q	Propiedades físicas
3 2CH ₃	H	0	0	
3 2CH ₂ CH ₃	H	0	0	
3 2CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	0	
3 3	H	0	0	
	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,4 (s, 3H), 2,7 (m, 2H), 3,8 (m, 2H), 7,56 (s, 1H), 7,8 (s, 1H)
	H	0	0	
3 3	H	0	0	

l	n	y	x	v	z	m	o	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	H	0	0	
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	Agente - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 4,1 (s, 3H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H)
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	H	0	0	
10	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}(\text{CH})_3\text{CH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	172-174°
	4	Cl	Cl	OCH_2CN	H	0	0	
	4	Cl	Cl	CH_3 OCH-CN	H	0	0	
15	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_3$	H	0	0	62-64°
	4	Cl	Cl	CH_3 $\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3$	H	0	0	

20

25

1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	H
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$	H
10	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{OCH}(\text{CH})_3\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	OCH_2CN	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH}-\text{CN} \end{array}$	H
15	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_3 \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{C}-\text{CH}_3 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	H

20

25

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
$2-CH_2-CH_3$	H	0	0	
	H	0	0	Aceite - RMN ($CDCl_3$) δ : 2,0 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 4,1 (s, 3H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H)
H_3	H	0	0	
3^2	H	0	0	
$3CH_2CH_3$	H	0	0	172-174°
	H	0	0	
	H	0	0	
3	H	0	0	62-64°
	H	0	0	

l	n	y	x	V	Z	m	Q	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	Acceite - IR: 1700, 1580 cm^{-1}
5	4	Cl	Cl	CH_3 $\text{O}-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
10	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	0	0	
	4	F	Cl	OCH_3	H	0	0	
	4	F	Cl	$\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	0	0	
	4	Cl	Br	OCH_3	H	0	0	
	4	Cl	Br	OCH_2CH_3	H	0	0	
	4	Cl	Br	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	H	0	0	
	4	Cl	Br	$\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	CH_3 $\text{O}-\text{CH}-\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	Acceite - Bandas IR: 1700, 1590 cm^{-1}
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	0	0	

20

25

l	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
1	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\text{CH}=\text{CH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H
	4	F	Cl	OCH_3	H
	4	F	Cl	$\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
10	4	Cl	Br	OCH_3	H
	4	Cl	Br	OCH_2CH_3	H
	4	Cl	Br	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	H
	4	Cl	Br	$\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H
15	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H
20	<hr/>				
25					

V	Z	m	Q	Propiedades físicas
$ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 2 \text{CH}=\text{CH}-\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array} $	H	0	0	Aceite - IR: 1700, 1580 cm^{-1}
$ \begin{array}{c} \text{H}_3 \\ \text{H}-\text{CH}=\text{CH}-\text{C}-\text{OCH}_2\text{CH}_3 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} $	H	0	0	
$ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{C}-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{array} $	H	0	0	
3	H	0	0	
$\text{H}(\text{CH}_3)_2$	H	0	0	
3	H	0	0	
2CH_3	H	0	0	
$(\text{CH}_3)_2$	H	0	0	
$2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H	0	0	
H_3				
$\text{H}-\text{CH}_2\text{OCH}_3$	H	0	0	
$2 \text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 1700, 1590 cm^{-1}
$2 \text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	0	0	
$2 \text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	0	0	

1	n	Y	X	V	Z	m	Q	Propiedades físicas
	4	Cl	Cl	$\text{O}=\text{C}-\text{NHCH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
5	4	Cl	Cl	$\text{O}=\text{C}-\text{NHCH}_3$	H	0	S	
	4	Cl	Cl	$\text{O}=\text{C}-\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	0	0	
10	4	Cl	Cl	$\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H	0	0	163-165°
	5	Cl	Cl	$\text{O}=\text{C}-\text{NHCH}_3$	H	0	0	
	5	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	0	0	
15	5	Cl	Cl	$\text{CH}_3-\text{CH}=\text{CH}_2$	H	0	0	
	5	Cl	Cl	$\text{CH}_3-\text{C}\equiv\text{CH}$	H	0	0	
	5	Cl	Cl	$\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H	0	0	

20

25

1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NHCH}_2\text{CH}_3$	H
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NHCH}_3$	H
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H
10	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H
	5	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NHCH}_3$	H
	5	Cl	Cl	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
15	5	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{ }{\text{C}}}-\text{CH}=\text{CH}_2$	H
	5	Cl	Cl	$\text{OCH}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{ }{\text{C}}}\equiv\text{CH}$	H
	5	Cl	Cl	$\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$	H
20	<hr/>				
25	<hr/>				

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
CH ₃	H	0	0	
	H	0	S	
2) 2CH ₃	H	0	0	
H ₃) ₃	H	0	0	163-165°
	H	0	0	
	H	0	0	
2	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	

l	n	y	x	v	z	m	o	Propiedades físicas
5	5	Cl	Cl	<chem>Oc1ccc(O)cc1</chem>	H	0	0	
5	5	Cl	Cl	<chem>Cc1ccc(O)cc1</chem>	H	0	0	
5	5	Cl	Cl	<chem>CC(C)C(=O)N</chem>	H	0	0	
10	5	Cl	Cl	<chem>CC(C)C#N</chem>	H	0	0	
	5	Cl	Cl	<chem>OCCCl</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>OCC(F)(F)F</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>OCCF</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>OCCCl</chem>	H	0	0	
15	4	Cl	Cl	<chem>OCCCl</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>OCCBr</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>OCCBr</chem>	H	0	0	
	4	Cl	Cl	<chem>OCCCl</chem>	H	0	0	
20	4	Cl	Cl	<chem>CC(Cl)C(Cl)Cl</chem>	H	0	0	

1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	
	5	Cl	Cl	<chem>OCH2-c1ccccc1</chem>	H
5	5	Cl	Cl	<chem>CC(O)c1ccccc1</chem>	H
	5	Cl	Cl	<chem>CC(C)C(=O)OC</chem>	H
10	5	Cl	Cl	<chem>CC(C)C(O)C#N</chem>	H
	5	Cl	Cl	<chem>OCCCl</chem>	H
	4	Cl	Cl	<chem>OCC(F)(F)F</chem>	H
	4	Cl	Cl	<chem>OCCF</chem>	H
	4	Cl	Cl	<chem>OCCCCl</chem>	H
15	4	Cl	Cl	<chem>OCCCCBr</chem>	H
	4	Cl	Cl	<chem>OCCCCBr</chem>	H
	4	Cl	Cl	<chem>OCCCCCl</chem>	H
	4	Cl	Cl	<chem>OCC(Cl)CCCl</chem>	H

20

25

	Z	m	Q	Propiedades físicas
	H	0	0	
	H	0	0	
¹³	H	0	0	
¹³				
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
	H	0	0	
² Cl	H	0	0	

l	n	Y	X	V	Z	m	Q	Propiedades físicas
1	4	Cl	Cl	-OCH ₂ -CH=CHBr	H	0	0	
	4	Cl	Cl	O-CH ₂ -CH=CHF	H	0	0	
	4	Cl	Cl	O-CH ₂ -CCl=CHCl	H	0	0	
5	4	Cl	Cl	O-CH ₂ -CCl=C(Cl) ₂	H	0	0	
	4	Cl	Cl	CH ₂ =CCl-CH-CH ₃ -O	H	0	0	
10	4	Cl	Cl	O-CH ₂ =CCl-CH-CH ₂ CH ₂ Cl Cl	H	0	0	
	4	Cl	Cl	OCH ₂ -CH=C-CH ₂ CH ₂ CH ₃ Cl	H	0	0	

Aceite - RMN (CDCl₃) δ: mezcla de isómeros cis/trans; 2,0 (m, 4H), 2,7 (m, 2H), 3,7 (m, 2H), 4,7-4,9 (2H), 6,5-6,7 (1H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)

15

20

25

1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
	4	Cl	Cl	$-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CHBr}$	H
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CHF}$	H
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{CCl}=\text{CHCl}$	H
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{CCl}=\text{C}(\text{Cl})_2$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{CCl}-\text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ -\text{O} \end{array}$	H
10	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{O}-\text{CH}_2=\text{CCl}-\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{OCH}_2-\text{CH}=\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	H

15

20

25

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
=CHBr	H	0	0	
=CHF	H	0	0	
l=CHCl	H	0	0	
l=C(Cl) ₂	H	0	0	
				Aceite - RMN (CDCl ₃) δ: mezcla de isómeros cis/trans; 2,0 (m, 4H), 2,7 (m, 2H), 3,7 (m, 2H), 4,7-4,9 (2H), 6,5-6,7 (1H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H)
H-CH ₃	H	0	0	
$\begin{array}{c} \text{-CH-CH}_2\text{CH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	H	0	0	
l-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	0	
!l				

1

EJEMPLO 5

Preparación de 2-(2,4-dicloro-5-(1-etoxicarboniletoxi)fenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)-ona

5

Se calientan a reflujo durante 5 horas, 20,1 partes de 2-(2,4-dicloro-5-hidroxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)-ona, preparada como se ha descrito en el Ejemplo 3, 12,1 partes de 2-bromopropionato de etilo, 9,3 partes de carbonato potásico anhidro y 100 partes de acetonitrilo seco. Se enfría la mezcla de reacción y se vierte sobre 250 partes de agua. La suspensión acuosa de producto se extrae tres veces con 250 partes de cloruro de metileno y después la solución se seca con sulfato sódico anhidro. Se separa el disolvente en un evaporador rotatorio a presión reducida. El residuo vítreo se cristaliza en una mezcla de acetato de etilo y éter. El rendimiento es de 16,0 partes de un sólido pardo pálido, p.f. 136-138°.

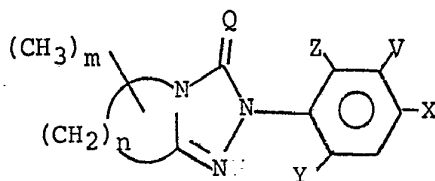
10

15

20

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 5 con un fenol de Fórmula VII y el α -haloéster apropiado de Fórmula VIII, pueden prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I.

25



l	n	y	x	v	z	m	o	Propiedades físicas
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	172-174
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	0	0	
10	5	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
	5	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
15	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_2\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
20	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3}{\underset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	

l	n	y	x	v
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}$
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{C}$
10	5	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$
	5	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
15	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{\text{CH}_2\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$
20	4	Cl	Cl	$\text{O}-\overset{(\text{CH}_2)_3-\text{CH}_3}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$

25

V	Z	m	Q	Propiedades físicas
$\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	172-174
$\text{O}-\overset{\text{CH}_3\text{O}}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{\text{CH}_2\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	
$\text{O}-\overset{(\text{CH}_2)_3-\text{CH}_3}{\mid}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OCH}_3$	H	0	0	

EJEMPLO 6

1 Preparación de 2-{2,4-dicloro-5-(1-carboxietoxi)fenil}-5,6,-
5 7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona

Se combinan 10,8 partes de 2-{2,4-dicloro-5-(1-etoxi-
5 carboniletoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}
piridin-3(2H)-ona, 20,6 partes de ácido clorhídrico concen-
trado (38 %) y 175 partes de dioxano y se calienta a 80°
durante 30 horas. Después de enfriar, la solución se vierte
en 750 partes de agua. El pH de la solución se eleva a 8-9
10 por adición de bicarbonato sódico sólido. Después la solu-
ción acuosa del producto se extrae tres veces con 250 partes
de cloruro de metileno. Se desprecian los extractos orgáni-
cos. La solución acuosa del producto se acidula después a
pH 1 por adición de ácido clorhídrico concentrado (38 %).
15 La solución acuosa de producto se extrae tres veces con
250 partes de cloruro de metileno y la solución de producto
se seca con sulfato sódico anhidro. Se separa el disolvente
en un evaporador rotatorio a presión reducida. El residuo
vítreo se tritura con éter. Se obtienen 4,4 partes de un
20 sólido blanco, p.f. 183-185°.

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 6
con el éster apropiado de Fórmula XII, pueden prepararse los
siguientes compuestos de Fórmula I.

l	n	Y	X	V	- Z	m	Q	Propiedades físicas
4	4	Cl	Cl	OCH ₂ CO ₂ H	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 3400-2200 (ancha), 1750-1600 (ancha), 1560 cm ⁻¹
5	4	Cl	Br	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CO}_2\text{H} \end{array}$	H	0	0	
4	4	F	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CO}_2\text{H} \end{array}$	H	0	0	
5	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CO}_2\text{H} \end{array}$	H	0	0	

10

15

20

25

1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
	4	Cl	Cl	OCH ₂ CO ₂ H	H
5	4	Cl	Br	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CO}_2\text{H} \end{array}$	H
	4	F	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CO}_2\text{H} \end{array}$	H
	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CO}_2\text{H} \end{array}$	H

10

15

20

25

<u>V</u>	<u>- Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
H	H	0	0	Aceite - Bandas IR: 3400-2200 (ancha), 1750-1600 (ancha), 1560 cm ⁻¹
¹ / ₂ H	H	0	0	
¹ / ₂ H	H	0	0	
¹ / ₂ H	H	0	0	

1

EJEMPLO 7

Preparación de 2-{2,4-dicloro-5-(1-N-metoxi-N-metilcarbamoil-
etoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piri-
din-3(2H)-ona

5

a) Preparación de 2-{2,4-dicloro-5-(1-clorocarboniletoxi)fe-
nil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-
ona

10

Se combinan y calientan a reflujo durante 3 horas 3,7 partes de 2-{2,4-dicloro-5-(1-carboxietoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona, 15 partes de cloroformo y 1,2 partes de cloruro de tionilo. La mezcla de reacción se agita durante 12 horas más a la temperatura ambiente. El disolvente y el exceso de cloruro de tionilo se separan del producto por evaporación en un evaporador rotatorio a presión reducida. Se obtienen 4,0 partes de producto crudo que se utiliza en la siguiente etapa sin purificarlo.

15

b) Preparación de 2-{2,4-dicloro-5-(1-N-metoxi-N-metilcarba-
moiletoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}
piridin-3(2H)-ona

20

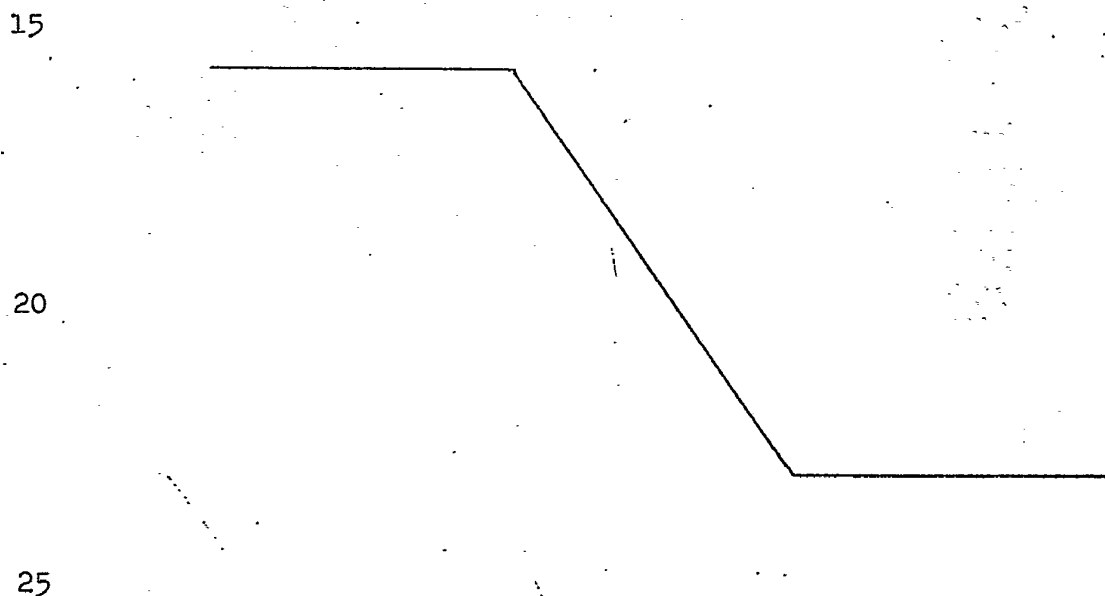
Se disuelven 4,0 partes del cloruro de ácido crudo del Ejemplo 7a en 50 partes de tolueno conteniendo 2,2 partes de trietilamina y 1,3 partes de N-metoxi-N-metilamina. La mezcla de reacción se agita durante 3 horas a la temperatura ambiente. Se añaden 50 partes de agua a la mezcla y se agita durante 10 minutos más. Se separa la fase orgánica y des-

25

1 pués se lava dos veces con 25 partes de solución saturada
de bicarbonato sódico y una vez con 25 partes de agua. La
capa orgánica se seca con sulfato sódico saturado. Se sepa-
ra el disolvente en un evaporador rotatorio a presión reduci-
5 da, dando 1,4 partes de un sólido vítreo con el siguiente
espectro de RMN:

CDCl_3 (δ): 1,7 (d, 3H), 2,0 (m, 4H), 2,7 (m, 2H), 3,2
(s, 3H), 3,7 (m, 5H), 5,2 (q, 1H), 7,1 (s, 1H), 7,5 (1H).

10 Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 7b
con el cloruro de ácido apropiado de Fórmula XIII, prepara-
do como se ha descrito en el Ejemplo VIIa, y una amina apro-
piada de Fórmula XIV, pueden prepararse los siguientes com-
puestos de Fórmula I.



1	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
	4	Cl	Cl	$\text{OCH}_2 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{NH}_2$	H
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{NHCH}_3 \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H
10	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O-CH} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H
	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown (\text{CH}_2)_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H
15	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H
	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{OCH} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} - \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{OCH}_3\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	H

20

25

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
NH ₂	H	0	0	205-207°
- NHCH ₃	H	0	0	
- N $\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
- N $\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
- N $\begin{array}{l} \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ (\text{CH}_2)_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
- N $\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
- N $\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{OCH}_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>
1					
	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{C} - \text{N} \begin{array}{l} / \text{CH}_3 \\ \backslash \text{CH}_3 \end{array} \\ \\ \text{O} \end{array}$	H
5	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{C} - \text{N} \begin{array}{l} / \text{CH}_3 \\ \backslash \text{OCH}_3 \end{array} \\ \\ \text{O} \end{array}$	H
	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{C} - \text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array}$	H
10	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{C} - \text{NH}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array}$	H
	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{C} - \text{NH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array}$	H
15	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{C} - \text{N} \begin{array}{l} / \text{CH}_3 \\ \backslash \text{CH}_3 \end{array} \\ \\ \text{O} \end{array}$	H

20

25

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	0	0	
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{OCH}_3 \end{array}$	H	0	0	
$\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	0	0	
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{NH}-\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}_2 \end{array}$	H	0	0	
NH_2	H	0	0	
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	0	S	

1

EJEMPLO 8

Preparación de 2-(2,4-dicloro-5-hidroxifenil)-5,6,7,8-tetra-
hidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)-ona, metilcarbamato

5

Se calienta a reflujo durante 4 horas una mezcla de
25 partes de cloruro de metileno, 1,1 partes de isocianato
de metilo, 3,0 partes de 2-(2,4-dicloro-5-hidroxifenil)-5,6,-
7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)-ona y 0,05
partes de 1,4-diazobiciclo 2.2.2 heptano. Se separa el disol-
vente en un evaporador rotatorio a presión reducida y el pro-
ducto crudo obtenido se cristaliza en acetonitrilo dando 2,5
partes de un producto sólido, p.f. 167-170°.

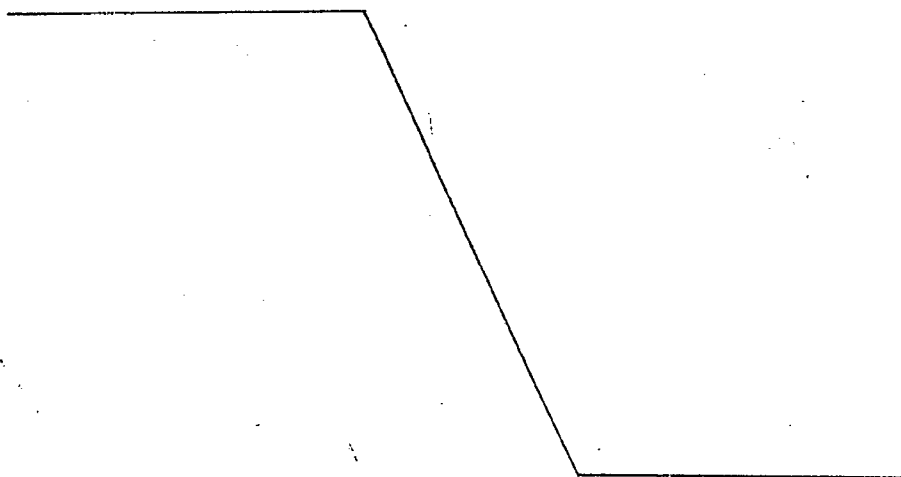
10

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 8
con un fenol de Fórmula VII y el isocianato apropiado, pueden
prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I.

15

20

25



1	n	y	x	v	z	m	o
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{C}(\text{NHCH}_2\text{CH}_3)$	H	0	oxígeno
5	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{C}-\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	0	azufre
	5	Cl	Cl	$\text{O}-\text{C}-\text{NH}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	0	oxígeno
10	5	Cl	Cl	$\text{O}-\text{C}-\text{NHCH}_3$	H	0	oxígeno

15

20

25

<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>
	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{CNHCH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	oxígeno
	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	azufre
	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{NH}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	oxígeno
	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{O}-\text{C}-\text{NHCH}_3 \end{array}$	H	0	oxígeno

EJEMPLO 9

Preparación de 2-{2,4-dicloro-5-(1-hidroximetiletoxi)fenil}-
5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona

Se tratan 4,0 partes de 2-{2,4-dicloro-5-(1-etoxicarbo-
niletoksi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}pi-
ridin-3(2H)-ona, preparada como se ha descrito en el Ejemplo
5, en 75 partes de tetrahidrofurano con 0,3 partes de boro-
hidruro sódico y 0,3 partes de cloruro de litio. La mezcla
de reacción se calienta a 40° durante 6 horas. Transcurrido
este tiempo, se añaden 0,6 partes de borohidruro sódico y
0,5 partes de cloruro de litio y después la mezcla se agita
durante 12 horas a la temperatura ambiente. Se calienta la
mezcla de reacción a reflujo y se agregan poco a poco otras
3,0 partes de borohidruro sódico y 2,8 partes de cloruro de
litio, a lo largo de 48 horas. Se enfría la mezcla y se agre-
ga lentamente sobre 100 partes de agua, formándose algo de
espuma. El producto se extrae tres veces con 200 partes de
éter. Después el éter se extrae dos veces con 100 partes de
agua. La capa etérea se seca con sulfato sódico. El éter se
separa en un evaporador rotatorio a presión reducida y el
residuo se tritura con cloruro de metileno dando 0,35 partes
de un sólido de color tostado, p.f. 54-57°.

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 9 con el
ácido carboxílico apropiado de Fórmula XI, pueden prepararse
los siguientes compuestos de Fórmula I.

1

		Propiedades físicas				
n	Y	X	V	Z	m	Q
4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	0
5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	H	0	0
5	Cl	Cl	O-CH ₂ CH ₂ OH	H	0	0

Acetate - RMN (CDCl₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,8 (m, 3H), 3,5-4,5 (m, 6H), 7,4 (s, 1H), 7,8 (s, 1H)

10

15

20

25

1

<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>	
5	4	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₂ OH
	5	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}_2\text{OH} \end{array}$
	5	Cl	Cl	O-CH ₂ CH ₂ OH

10

15

20

25

<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>	<u>Propiedades físicas</u>
OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	0	Aceite - RMN (CDCl ₃) δ : 2,0 (m, 4H), 2,8 (m, 3H), 3,5-4,5 (m, 6H), 7,4 (s, 1H), 7,8 (s, 1H)
$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}_2\text{OH} \end{array}$	H	0	0	
O-CH ₂ CH ₂ OH	H	0	0	

1

EJEMPLO 10

Preparación de 2-{{5-(2-acetiloxi)etoxi}-2,4-diclorofenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona

5

10

15

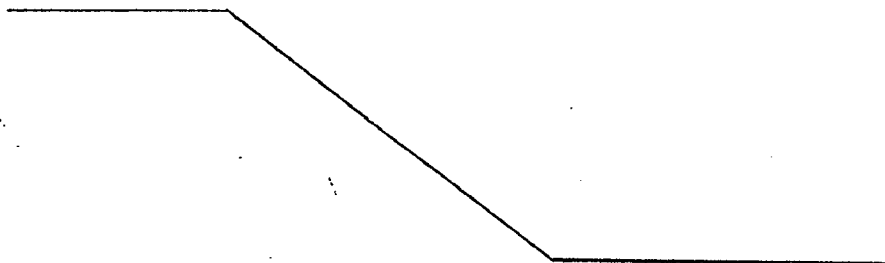
20

25

Se combinan 3,8 partes de 2-{2,4-dicloro-5-(2-hidroxietoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona, preparada por un procedimiento análogo al del Ejemplo 9, con 2,2 partes de acetato sódico anhidro y 2,8 partes de anhídrido acético en 15 partes de tolueno. La mezcla de reacción se calienta a 80° durante 3 horas y después se enfría a la temperatura ambiente. Se vierte la mezcla de reacción en agua y la fase orgánica se recoge en 200 partes de cloruro de metileno y se seca con sulfato sódico anhidro. El disolvente se separa en un evaporador rotatorio a presión reducida. Se obtienen 3,0 partes de un aceite.

RMN (CDCl₃) δ : 1,8-2,4 (m, 7H), 2,8 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 4,3-4,8 (m, 4H), 7,4 (s, 1H), 7,9 (s, 1H).

Siguiendo un procedimiento similar al del Ejemplo 10 con el alcohol apropiado de Fórmula XVI y el anhídrido XVII, pueden prepararse los siguientes compuestos de Fórmula I.



1

	n	y	x	v	z	m	o
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	oxígeno
10	5	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	H	0	oxígeno
	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}_3$	H	0	oxígeno

15

20

25

1

	<u>n</u>	<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>V</u>
5	4	Cl	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{CH}_2 - \text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_3 \end{array}$
	5	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2\text{CH}_3$
10	4	Cl	Cl	$\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-(\text{CH}_2)_2\text{C}$

15

20

25

<u>X</u>	<u>V</u>	<u>Z</u>	<u>m</u>	<u>Q</u>
1	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{O}-\text{CH} - \text{CH}_2 - \text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	0	oxígeno
1	$\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2\text{CH}_3$	H	0	oxígeno
1	$\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	0	oxígeno

1 Formulaciones

5 Entre las formulaciones útiles de los compuestos de
Fórmula I se encuentran los polvos finos, gránulos esféri-
cos y cilíndricos, soluciones, suspensiones, emulsiones,
10 polvos mojables, concentrados emulsionables y similares.
Muchas de estas formulaciones pueden aplicarse directamente.
Las formulaciones rociables pueden ser diluídas en medios
adecuados y utilizadas a los volúmenes de rociada desde
algunos litros a varios centenares de litros por hectárea.
15 Las formulaciones concentradas se emplean fundamentalmente
para preparar formulaciones más diluídas para aplicación
en campo. En sentido amplio, las formulaciones están cons-
tituídas esencialmente por alrededor de 0,05 a 99 % en pe-
so de ingredientes activos y como mínimo uno de los si-
15 guientes ingredientes: (a) alrededor de 0,1 a 20 % de uno
o varios agentes tensoactivos y (b) alrededor de 1 a 99,95%
de uno o varios diluyentes sólidos o líquidos. Más especí-
ficamente, en general están constituídas esencialmente
por estos ingredientes en las siguientes proporciones apro-
20 ximadas:

25

1	Porcentaje en peso			
	Ingrediente activo	Diluyente(s)	Agente(s) tensoactivo(s)	
	Polvos mojables	5-90	1-94	1-10
5	Suspensiones, emulsiones o soluciones oleosas, (incluidos los concentrados emulsionables)	5-50	40-95	0-15
	Suspensiones acuosas	5-50	40-94	1-20
	Polvos finos	0,05-25	70-99,95	0-5
10	Gránulos y granzas	0,05-95	1-99,95	0-15
	Composiciones concentradas	90-99	0,10	0-2

Estas formulaciones pueden contener cualquiera de los compuestos de Fórmula I.

15 Naturalmente, puede haber presente proporciones menores o mayores de ingrediente activo según el uso que se pretenda dar a las formulaciones y las propiedades físicas del compuesto. Algunas veces son convenientes unas relaciones mayores de agente tensoactivo a ingrediente activo, que se consiguen por incorporación a la formulación o mezclando en tanque.

20 Los diluyentes sólidos típicos han sido descritos en la obra de Watkins y colaboradores, "Handbook on Insecticide Dust Diluents and Carriers", segunda edición, 25 Dorland Books, Caldwell, N.J. Los diluyentes adecuados

1 incluyen los sólidos finamente divididos o granulados cla-
sificados como atapulgitas, productos botánicos, calcitas,
diatomitas, dolomitas, yeso, caolinitas, piedras calizas,
mica, montmorillonoides, fosfatos, pirofilitas, azufre,
5 arena, talcos, tripolitas, vermiculita y productos sintéti-
cos como dióxido de silicio hidratado precipitado, silica-
to cálcico hidratado precipitado, carbonato cálcico preci-
pitado y productos orgánicos sintéticos. Los diluyentes
más absorbentes son los preferidos para los polvos mojables
10 y los más densos para los polvos finos. Los diluyentes y
disolventes líquidos típicos están descritos en la obra de
Marsden, "Solvents Guide", segunda edición, Interscience,
New York, 1950. Para los concentrados en suspensión se pre-
fiere una solubilidad inferior al 0,1 %; es preferible que
15 los concentrados en solución sean estables a la separación
de fases a 0°C. En las obras " McCutcheons Detergents and
Emulsifiers 1975 Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood, New
Jersey, así como en la de Sisely y Wood, "Encyclopedia of
Surface Active Agents", Chemical Publ. Col, New York, 1964,
20 se encuentran listas de agentes tensoactivos y de las apli-
caciones recomendadas para los mismos. Todas las formulacio-
nes pueden contener cantidades minoritarias de aditivos pa-
ra reducir la formación de espuma, el apelmazamiento, la
corrosión, el crecimiento microbiológico, etc o para mar-
25 car visualmente la zona que ha sido tratada.

1 Las soluciones se preparan mezclando simplemente
los ingredientes. Las composiciones de sólidos finos se
preparan mezclando y habitualmente moliendo, por ejemplo
5 en un molino de martillos o de energía fluída. Las suspen-
siones se preparan por molienda en mojado (véase, por
ejemplo, la patente estadounidense 3.060.084 de Littler.

Los gránulos pueden prepararse por diversos métodos.
Por ejemplo, el ingrediente activo puede ser rociado sobre
vehículos granulados preformados. Los vehículos granulados
10 preformados adecuados incluyen los diluyentes adecuados
antes citados con un intervalo de tamaños de partícula
comprendido entre 74 micras (tamiz n° 200 de las Normas
Estadounidenses) y 2000 micras (tamiz n° 10). El tamaño
preferido de partícula es de 105 micras (tamiz n° 140) a
15 840 micras (tamiz n° 20). Según la naturaleza del vehícu-
lo, el ingrediente activo puede permanecer sobre la super-
ficie del mismo o ser absorbido en el vehículo. Habitual-
mente, cuando el ingrediente activo permanece sobre la
superficie del vehículo, se utiliza un agente ligante pa-
20 ra mantener el ingrediente activo sobre dicha superficie.
El agente ligante debe adherir el ingrediente activo a la
superficie con fuerza suficiente para que no más del
10 % del ingrediente activo sea desprendido durante las
operaciones normales de transporte y manipulación. Entre
25 los agentes ligantes adecuados se encuentran los materia-

1 les que son por lo menos parcialmente solubles en cualquie-
ra de los líquidos empleados en la manufactura de los grá-
nulos y que se adhieren a la superficie granular. Se pre-
fieren los ligantes solubles en agua. Los ligantes adecua-
5 dos incluyen, aunque sin limitarse a ellos solamente, los
polímeros solubles en agua como los alcoholes poliviníli-
cos, polivinilpirrolidonas y polioxietilenos. Otros ligantes
adecuados son los ligninsulfonatos, almidones, azufres y
ciertos agentes tensoactivos citados en "McCutcheons Deter-
10 gents and Emulsifiers 1975 Annual", MC Publ. Corp., Ridge-
wood, New Jersey.

El ingrediente activo puede pulverizarse sobre los
gránulos en forma de solución en un disolvente adecuado,
que puede o no ser separado después de la formulación. Si
15 el ingrediente activo es un líquido, puede ser pulverizado
sobre el vehículo o mezclado con este último directamente.
Si es sólido, puede ser fundido y aplicado directamente en
forma líquida. Si se desean gránulos de muy poca concentra-
ción, el ingrediente activo puede atomizarse sobre el vehí-
20 culo. Los gránulos también pueden prepararse por técnicas
de aglomeración. Por ejemplo, pueden mezclarse el ingredien-
te activo y un diluyente sólido finamente dividido y aglo-
merarse por técnicas conocidas, por ejemplo por pulverización
con un líquido en un lecho fluidificado o en un granulador
25 de bandeja. El ingrediente activo y el diluyente también

1 pueden mezclarse con otros ingredientes de la formulación
y grancearse. Las granzas pueden después machacarse hasta
el tamaño de gránulo deseado. También pueden prepararse
5 granzas por técnicas de aglomeración. Véase la obra de
J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4
de Diciembre de 1967, págs. 147ff y "Perrys Chemical Engi-
neers Handbook", cuarta edición, McGraw-Hill, N.Y. 1963,
págs. 8-59ff.

10 Para más información relativa a la formulación,
véanse por ejemplo las siguientes referencias:

H.M. Loux, patente estadounidense 2.235.361, 15 de Febrero
de 1966, columna 6, línea 16 a columna 7, línea 19 y Ejem-
plos 10 a 41.

15 R.W. Luckenbaugh, patente estadounidense 3.309.192, 14 de
Marzo de 1967, columna, 5, línea 43 a columna 7, línea 62
y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140,
162-164, 166, 167, 169-182.

H. Gysin y E. Knusli, patente estadounidense 2.891.855,
20 23 de Junio de 1959, columna 3, línea 66 a columna 5, línea
17 y Ejemplos 1 a 4.

G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and
Sons, Inc., New York, 1961, págs. 81-96.

25 J.D. Fryer y S.A. Evans, "Weed Control Handbook", quinta
edición, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968,
págs. 101-103.

1

EJEMPLO 11

Polvo mojable

5

2-(2,4-Dicloro-5-etoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona	25 %
Lingninsulfonato sódico	2 %
Alquilnaftalensulfonato sódico	2 %
Sílice amorfa sintética	3 %
Caolinita	68 %

10

Los ingredientes se mezclan bien, se muelen en un molino de aire para producir un tamaño medio de partícula inferior a 15 micras, se mezclan de nuevo y se tamizan a través de un tamiz de 50 mallas de las Normas Estadounidenses (apertura de 0,3 mm) antes de embalarlos.

15

EJEMPLO 12

Solución

2-{2,4-dicloro-5-(1-metiletoksi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona	20 %
Dimetilformamida	80 %

20

Los ingredientes se combinan y agitan para producir una solución que puede ser utilizada para aplicaciones de bajo volumen.

25

EJEMPLO 13

Granzas extruídas

2-(2,4-dicloro-5-etoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona	1 %
--	-----

1	Sulfato sódico anhidro	10 %
	Ligninsulfonato cálcico crudo	5 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	1 %
	Polioxietileno (peso molecular promedio 4×10^6)	1 %
5	Bentonita cálcica/magnésica	82 %

Los ingredientes se mezclan, se muelen a martillo y después se humedecen con alrededor del 12 % de agua. La mezcla se extruye como cilindros de unos 3 mm de diámetro que se cortan para producir granzas de unos 3 mm de longitud. Estas pueden utilizarse directamente después de secar o bien las granzas secas pueden machacarse hasta que atraviesan un tamiz de 20 mallas de las Normas Estadounidenses (aperturas de 0,84 mm). Los gránulos retenidos sobre un tamiz de 40 mallas (aperturas de 0,42 mm) pueden ser embalados para uso y los finos reciclados.

EJEMPLO 14

Concentrado emulsionable

	2-(2,4-Dicloro-5-(1-metoxietoxi)fenil)-2,5,6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo[4,3-A]azepin-3-ona	25 %
20	Mezcla de sulfonatos solubles en aceite y éteres polioxietilénicos	4 %
	Xileno	71 %

Los ingredientes se combinan y agitan hasta que la disolución es completa. Se incluye un filtro fino en la operación de embalaje para garantizar la ausencia de cualquier material extraño no disuelto en el producto.

1

EJEMPLO 15

Suspensión acuosa

	2-(2,4-Dicloro-5-etoxifenil)-5,6,7,8-tetra- hidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3- (2H)-ona	50,0 %
5	Acido poliacrílico espesante	0,3 %
	Eter dodecilsulfónico de polietilenglicol	0,5 %
	Fosfato disódico	1,0 %
	Fosfato monosódico	0,5 %
	Alcohol polivinílico	1,0 %
10	Pentaclorofenol	0,4 %
	Agua	46,3 %

Los ingredientes se muelen en un molino de arena para producir partículas, prácticamente todas ellas de un tamaño inferior a 5 micras.

15

EJEMPLO 16

Polvo mojable

	2-(2,4-Dicloro-5-metoxifenil)-5,6,7,8-tetra- hidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3-(2H)-ona	50 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	2 %
20	Ligninsulfonato sódico	2 %
	Sílice amorfa sintética	3 %
	Caolinita	43 %

25

Los ingredientes se mezclan bien, se pasan por un molino neumático para producir un tamaño medio de partícula inferior a 15 micras, se mezclan de nuevo y se tamizan por un tamiz de 50 mallas de las Normas Estadounidenses (0,3 mm

1 de apertura) antes de embalar.

EJEMPLO 17

Concentrado de gran potencia

5 2-(2,4-Dicloro-5-metoxifenil)-5,6,7,8-tetrahi-
dro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona 99 %
Eter trimetilnonílico de polietilenglicol 1 %

10 El agente tensoactivo se pulveriza sobre el ingre-
diente activo en una mezcladora y la mezcla se tamiza por
un tamiz de 40 mallas (aperturas de 0,42 mm) antes de emba-
larla. El concentrado puede ser formulado de nuevo para
su aplicación en campo.

EJEMPLO 18

Gránulos de poca concentración

15 2-{2,4-Dicloro-5-(1-metoxietoxi)fenil}-2,5,6,7,8,9-
hexahidro-3H-1,2,4-triazolo{4,3-A}azepin-3-ona 0,5 %
Gránulos de atapulgita (bajos en materias volátiles;
0,59-0,25 mm, es decir, de número de malla 30-60) 99,5 %

20 Se atomizan lentamente 40 g de una solución que con-
tiene 2,5 % de 2-{2,4-dicloro-5-(1-metiletoxi)fenil}-2,5,-
6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo{4,3-A}azepin-3-ona en
alcohol metílico sobre un lecho fluidificado de 199 g de
gránulos de atapulgita. La fluidificación de los gránulos
se prosigue después de completada la atomización y hasta
que se ha evaporado de los gránulos la totalidad del alco-
hol metílico. Los gránulos se embalan para su uso.

25

1

EJEMPLO 19

Granzas extruídas

	2-(2,4-Dicloro-5-metoxifenil)-5,6,7,8-tetra- hidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3-(2H)-ona	25 %
5	Sulfato sódico anhidro	10 %
	Ligninsulfonato cálcico crudo	5 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	1 %
	Bentonita cálcica/magnésica	59 %

Los ingredientes se mezclan, se muelen a martillos y se humedecen con alrededor de 10-12 % de agua. Después la mezcla se extruye en forma de cilindros de unos 3 mm de diámetro que se cortan a unos 3 mm de longitud. Estas granzas pueden utilizarse directamente después de secas o bien las granzas secas pueden ser machacadas hasta que atraviesan un tamiz de 20 mallas de las Normas Estadounidenses (aperturas de 0,84 mm). Las granzas retenidas en un tamiz del n° 40 (0,42 mm de apertura) pueden ser embaladas para uso y los finos reciclados.

15

EJEMPLO 20

20

Gránulos de baja concentración

	2-(2,4-Dicloro-5-etoxifenil)-5,6,7,8-tetra- hidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3(2H)-ona	0,2 %
	Sulfato sódico anhidro	10 %
	Ligninsulfonato cálcico crudo	5 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	1 %
25	Arcilla atapulgítica finamente dividida	83,8 %

1 Los ingredientes se mezclan, se muelen a martillos y
se introducen en un granulador de lecho fluidificado. Se as-
pira agua en el lecho fluidificado de polvo hasta que se
5 forman pequeños gránulos. Después se interrumpe la aspira-
ción de agua pero se prosigue la fluidificación para secar
los gránulos formados. Los gránulos se sacan del granulador
y se tamizan hasta que atraviesan un tamiz de 20 mallas
(aperturas de 0,84 mm). Los gránulos retenidos sobre un ta-
miz de 40 mallas (aperturas de 0,42 mm) se embalan para uso.
10 Los gránulos mayores de 0,84 mm se muelen y reciclan. Los
finos menores de 0,42 mm también pueden ser reciclados.

EJEMPLO 21

Granzas extruídas

15	2-(2,4-Dicloro-5-metoxifenil-5,6,7,8-tetra- hidro-1,2,4-triazolo[4,3-A]piridin-3(2H)-ona	0,1 %
	Sulfato sódico anhidro	10 %
	Ligninsulfonato cálcico crudo	5 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	1 %
	Polioxietileno (peso molecular promedio 4×10^6)	1 %
20	Bentonita cálcica/magnésica	82,9 %

Los ingredientes se mezclan, se muelen a martillos
y después se humedecen con alrededor del 12 % de agua. La
mezcla húmeda se extruye en forma de cilindros de aproxima-
damente 1 mm de diámetro y unos 2 mm de longitud. Estas pe-
25 queñas granzas se secan y embalan. Se aplican directamente.

1

EJEMPLO 22

Gránulos de baja concentración

5

2-{2,4-Dicloro-5-(1-metiletoxi)fenil}-5,6,-
7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piri-
din-3(2H)-ona 0,05 %

Dimetilformamida 5 %

Gránulos de atapulgita (bajos en materia
volátil; 0,59-0,25 mm, es decir con un
tamaño de 30-60 mallas de las Normas Es-
tadounidenses) 94-95

10

Se disuelven 0,1 g de 2-{2,4-dicloro-5-(1-metil-
etoxi)fenil}-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}pi-
ridin-3(2H)-ona en 9,9 g de dimetilformamida. Esta solu-
ción se atomiza muy lentamente sobre 190,1 g de un lecho
de gránulos de atapulgita volteados rápidamente. Una vez
completada la aplicación del ingrediente activo, la formu-
lación se mezcla durante algunos minutos más. La dimetilfor-
mamida no se separa de la formulación. Los gránulos se em-
balan para uso.

15

EJEMPLO 23

Concentrado emulsionable

20

2-{2,4-Dicloro-5-(1-metiletoxi)fenil}-5,6,7,8-
tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}piridin-3-
(2H)-ona 10 %

Mezcla de sulfonatos solubles en aceite con
éteres polioxietilénicos 6 %

25

Disolvente hidrocarbonado aromático con un pun-
to de ignición en vasija cerrada Tag entre
100 y 115°F (38 y 46°C) 84 %

Los ingredientes se combinan y se agitan hasta que

1 la disolución es completa. Se filtra la solución por un filtro fino antes de embalarla para eliminar cualquier materia extraña no disuelta.

EJEMPLO 24

5 Gránulos de baja concentración

2-{2,4-Dicloro-5-(1-metiletoxi)fenil}-2,5,6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo{4,3-A}azepin-3-ona	0,1 %
Ligninsulfonato sódico	5 %
Gránulos de arena preformados con una distribución de tamaños de partícula desde el tamiz n° 140 (150 micras) hasta el tamiz n° 50 (297 micras)	94,9 %

10

Se disuelven 0,5 g de 2-{2,4-dicloro-5-(1-metiletoxi)fenil}-2,5,6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo{4,3-A}azepin-3-ona y 25 g de ligninsulfonato sódico en 50 g de agua. Esta solución se pulveriza lentamente sobre un lecho volteado de los gránulos de arena (474,5 g). Una vez completada la pulverización, los gránulos volteados se calientan para eliminar el agua. Los gránulos resultantes se embalan para uso.

15

20

Los compuestos de Fórmula I también pueden combinarse con otros herbicidas y son especialmente útiles en combinación con la s-triazinas tales como atrazina 2-cloro-4-(etil-amino)-6-(isopropilamino)-s-triazina, linuron 3-(3,4-diclorofenil)-1-metoxi-1-metilurea, alachlor 2-cloro-2',6'-diethyl-N-(metoximetil)acetanilina, bromacil 3-(sec-butil)-5-bromo-6-metiluracilo, diuron 3-(sec-butil)-5-bromo-6-me-

25

1 tiluracilo, 3-ciclohexil-1-metil-6-dimetilamino-s-triazin-
2,4(1H,3H)-diona, paraquat (ion 1,1'-dimetil-4,4'-bipiridi-
nio), t-butilcarbamato de m-(3,3-dimetilureido)fenilo, áci-
do 2-metil-4-clorofenoxiacético, sus sales o ésteres, 4-ami-
5 no-6-t-butil-3-metiltio-as-triazin-5(4H)-ona, éteres aril-
4-nitrofenílicos como éter 2,4,6-triclorofenil-4-nitrofení-
lico y éter 2,4-diclorofenil-4-nitrofenílico, m-hidroxicar-
banilato-m-metilcarbanilato de metilo, di-isopropiltiocar-
bamato de s-(2,3,3-tricloroalilo), di-isopropiltiocarbama-
10 to de S-(2,3-dicloroalilo), 3-ciclohexil-5,6-trimetilenura-
cilo, N-etiltiociclohexanocarbamato de S-etilo, 5-amino-4-
cloro-2-fenil-3(2H)-piridazinona, 4-amino-3-metil-6-fenil-
1,2,4-triazin-5(4H)-ona, para el control de un amplio espec-
tro de malas hierbas.

15 UTILIDAD

Los compuestos de Fórmula I son útiles para el con-
trol selectivo de preemergencia de la vegetación indesea-
ble, en cultivos como maíz, remolacha azucarera y trigo.
Los compuestos de esta invención pueden utilizarse como tra-
20 tamientos dirigidos para el control de pre-emergencia o de
post-emergencia de las malas hierbas en diversos cultivos
que incluyen el maíz y el algodón.

La cantidad exacta de compuestos de Fórmula I a uti-
lizar en cualquier situación dada variará con el resultado
25 final particular deseado, el uso implicado, el cultivo y

1 las malas hierbas y el terreno empleado, la formulación
utilizada, la forma de aplicación, las condiciones atmos-
féricas prevalentes, la densidad del follaje y factores
similares. Como intervienen tantas variables, no es posi-
5 ble establecer una proporción de aplicación adecuada para
todas las situaciones. En sentido amplio, los compuestos
de esta invención se utilizan a niveles de alrededor de
0,015 a 15 kg por hectárea, preferiblemente alrededor de
0,03 a 10 kg por hectárea. Las proporciones más bajas de
10 este intervalo se seleccionan en general para las tierras
más ligeras, tierras bajas en materia orgánica, para el
control selectivo de las malas hierbas en cultivos o en
situaciones donde no es necesaria una persistencia máxima.

15 La actividad herbicida de los compuestos de esta in-
vención fué descubierta en diversos ensayos en invernadero.
El procedimiento de ensayo fué el siguiente:

EJEMPLO 25

En un medio de cultivo se siembran semillas de
garranchuelo (Digitaria sp.) cerreig (Echinochloa crusgalli),
20 avena loca (Avena fatua), casia (Cassia tora), ipomea
(Ipomoea sp.), cadillo (Xanthium sp.) sorgo, maíz, soja,
arroz y trigo y tubérculos de juncia real y se someten a un
tratamiento de pre-emergencia con los productos químicos
disueltos en un disolvente no fitotóxico. Al mismo tiempo,
25 se rocían plantitas de algodón con 5 hojas (incluidas las

1 cotiledonarias), frijoles enanos con la tercera hoja
trifoliada en expansión, garranchuelo con dos hojas, cerreig
con 2 hojas, avena loca con 1 hoja, casia con 3 hojas (las
5 cotiledonarias), ipomea con 4 hojas (incluidas las cotile-
donarias), cadillo con 4 hojas (incluidas las cotiledonarias),
sorgo con 3 hojas, maíz con 3 hojas, soja con 2 hojas coti-
ledonarias, arroz con 2 hojas, trigo con 1 hoja y juncia
real con 3-5 hojas. Las plantas tratadas y los controles
se mantienen en un invernadero durante 16 días, después de
10 lo cual se comparan todas las especies con los controles
y se clasifica visualmente su respuesta al tratamiento.
Las clasificaciones se basan en una escala numérica que
se extiende desde 0 = ningún daño hasta 10 = destrucción
completa. Los símbolos descriptivos que acompañan a estas
15 cifras tienen los siguientes significados: B = quemado;
G = retraso del crecimiento; C = clorosis/necrosis; D =
desfoliación; E = inhibición de la emergencia y H = efectos
formativos. Las clasificaciones de pre-emergencia y post-
emergencia para los compuestos ensayados por este proce-
20 dimiento se encuentran en la Tabla I.

Estos datos ilustran la potencia herbicida de los
compuestos reivindicados.

25

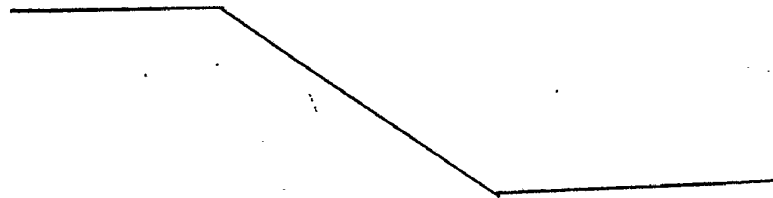
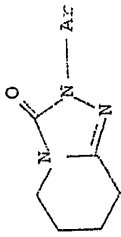


TABLA I



Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción Kg/Ha	Frijol enana	Algodón	Ipmea	Cadillo	Casta	Juncia real	Garranchuelo	Cereyig	Avena loca	Trigo	Maiz	Soja	Arroz	Sorgo
1		Post 2,0 Pre 2,0	9B	9B	8B 8C	7B 8C	6B 8C	6B 8C	8B 8C	8B 8C	6B 8C	6B 8C	8B 8C	9B 9C	7B 8C	9B 8C
2		Post 2,0 Pre 2,0	9B	8B	9B 8C	7B 8C	7B 8C	2B 7C	8C 8C	8C 8C	6B 8C	8B 8C	7B 8C	9B 8C	8B 8C	9B 8C

1

5

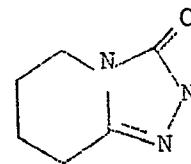
10

15

20

25

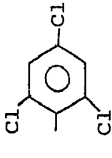
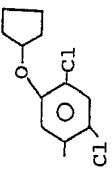
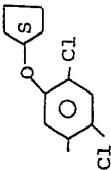
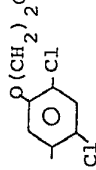
TABLA I



1
5
10
15
20
25

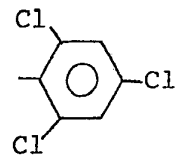
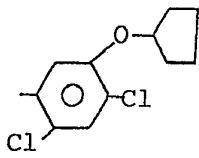
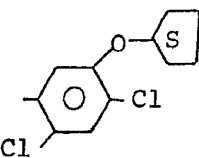
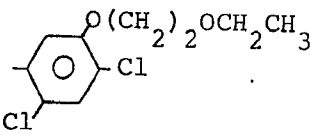
Com- pues- to n°	Ar =	Modo de 'aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enana	Algodón
1		Post	2,0	9B	9B
		Pre	2,0		
2		Post	2,0	9B	8B
		Post	2,0		
		Pre	2,0		

1 TABLA I (continuación)

Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha														
				Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casía	Juncia real	Garranchuelo	Cereylo	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
5		Post	0,4	9B	8B	7B	6B	2B	8B	9B	6B	8B	8B	6B	9B	9B	
		Post	0,4				7C										
		Pre	0,4		8C	8C	8E	8E	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C
10		Post	0,4	8B	8B	9B	7B	6B	7B	6B	8B	8B	8B	8B	8B	8B	
		Pre	0,4		8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C
		Pre	0,4		8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C
15		Post	0,4	8B	8B	8B	7B	5B	9B	9B	9B	9B	9B	9B	9B	9B	
		Pre	0,4		9C	2C	9C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C
		Pre	0,4														3H
20		Post	0,4	8B	8B	8B	4B	8B	4B	9B	7B	8B	4B	9B	8B	9B	
		Post	0,4														8H
		Pre	0,4		8C	8C	9C	9C	8E	8E	8E	8E	8E	8E	8E	8E	8E

1

TABLA I (continua)

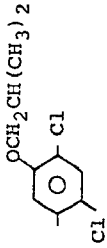
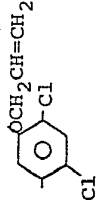
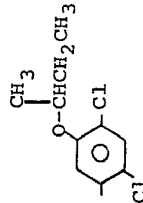
5	Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea
10	3		Post	0,4	9B	9B	&B
			Post	0,4			
			Pre	0,4			&C
	4		Post	0,4	&B	&B	&B
			Pre	0,4			&C
15	5		Post	0,4	&B	&B	&B
			Pre	0,4			9C
			Pre	0,4			
20	6		Post	0,4	&B	9B	&B
			Post	0,4			
			Pre	0,4			&C

25

TABLA I (continuación)

Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	0,4	9B	9B	&B	7B	6B	2B	&B	&B	8B	9B	6B	8B	6B	9B
Post	0,4						7C								
Pre	0,4			&C	&C	&C	&E	&C	&C	&C	&C	9C	9H	&C	&C
Post	0,4	&B	&B	&B	9B	7B	6B	7B	&B	6B	5B	6B	9B	7B	7B
Pre	0,4			&C	9C	9C	&C	&E	&C	9C	9C	9H	9H	9C	&C
Post	0,4	&B	&B	&B	8B	7B	5B	9B	9B	4B	6B	8B	9B	7B	6B
Pre	0,4			9C	2C	9C	8C	&C	&C	9C	1C	9H	8H	&C	9C
Pre	0,4										3H				
Post	0,4	&B	9B	&B	8B	4B	8B	4B	9B	7B	3B	4B	9B	8B	9B
Post	0,4							8H							
Pre	0,4			&C	&C	9C	9C	&E	&E	9C	9C	9H	&H	&C	&E

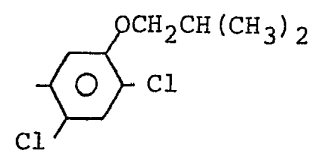
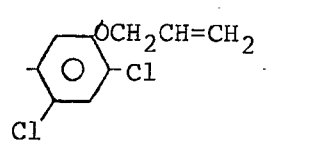
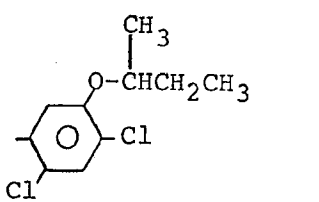
TABLA I (continuación)

Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Príjol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casta	Tunca real	Garranchuelo	Cerezo	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
7		Post	0,4	9B	9B	8B	9B	7B	4B	8B	8B	8B	9B	3B	9B	6B	9B
		Post	0,4											7H			
10		Pre	0,4	8C	1C	0	9C	8E	8E	9C	9C	9C	9C	3C	9H	8C	8C
		Pre	0,4											9H			
15		Post	0,4	8B	8B	9B	8B	9B	8B	8B	8B	8B	9B	8B	8B	8B	8B
		Pre	0,4	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	9H	8H	8C	8C
20		Post	0,4	8B	8B	8B	8B	8B	8B	8B	8B	8B	8B	7B	9B	9B	8B
		Pre	0,4	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	9H	8C	8C	8C

1

TABLA I (conti

5

Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	
7		Post	0,4	9B	9
		Post	0,4		
		Pre	0,4		
		Pre	0,4		
8		Post	0,4	&B	&I
		Pre	0,4		
9		Post	0,4	&B	&I
		Pre	0,4		

10

15

20

25

TABLA I (continuación)

	Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
3) 2	Post	0,4	9B	9B	&B	9B	7B	4B	&B	&B	&B	9B	3B	9B	6B	9B
	Post	0,4											7H			
	Pre	0,4			&C	1C	0	9C	&E	&E	9C	9C	3C	9H	&C	&C
	Pre	0,4				8H							9H			
	Post	0,4	&B	&B	&B	&B	9B	9B	&B	&B	&B	9B	8B	&B	&B	&B
	Pre	0,4			&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9H	&H	&C	&C
	Post	0,4	&B	&B	&B	9B	&B	8B	9B	&B	&B	6B	7B	9B	9B	&B
	Pre	0,4			&C	9H	&C	&C	&C	&C	&C	9C	9H	&C	&C	&C

TABLA I (continuación)

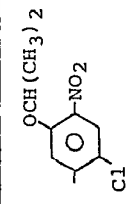
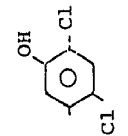
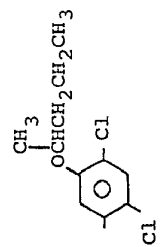
	Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Pirol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casta	Yunca real	Carrizuelo	Cerezo	Avena loca	Trigo	Mán	Soja	Arroz	Sorgo	
1																			
5																			
	10		Post	2,0	9B	8B	8B	9B	8B	9B	8B	8B	8B	8B	8B	9B	8B	8B	8B
			Post	2,0											9H				
10			Pre	2,0				8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C
	11		Post	2,0	9B	8B	8B	6B	5B	4E	8B	8B	8B	7B	6B	9B	8B	8B	8B
			Post	2,0										9H	5H				
15			Pre	2,0			2C	8G	2C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	3C	8C	8C	8C
			Pre	2,0			8G		8G							9H			
20			Post	0,4	8B	8B	9B	6B	6B	3B	7B	8B	4B	5B	5B	9B	6B	9B	9B
			Pre	0,4			1C	0	0	9C	9H	8C	8C	9C	3C	6H	8C	8C	8C
			Pre	0,4			8G								8H				

TABLA I (cont)

1

5

10

15

20

25

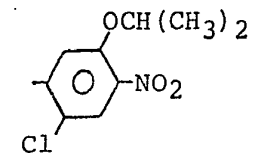
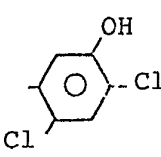
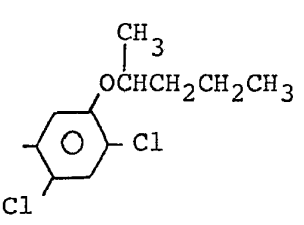
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón
10		Post	2,0	9B	9B
		Post	2,0		
		Pre	2,0		
11		Post	2,0	9B	9B
		Post	2,0		
		Pre	2,0		
		Pre	2,0		
12		Post	0,4	&B	9B
		Pre	0,4		
		Pre	0,4		

TABLA I (continuación)

Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	2,0	9B	9B	&B	9B	&B	9B	&B	&B	&B	&B	8B	9B	&B	&B
Post	2,0											9H			
Pre	2,0			&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C
Post	2,0	9B	9B	&B	6B	5B	4B	&B	&B	&B	7B	6B	9B	&B	&B ¹
Post	2,0										9H	5H			
Pre	2,0			2C	8G	2C	8C	&C	&C	&C	&C	&C	3C	&C	&C
Pre	2,0			8G		8G							9H		
Post	0,4	&B	9B	&B	9B	6B	3B	7B	&B	4B	5B	5B	9B	6B	9B
Pre	0,4			1C	0	0	9C	9H	&C	&C	9C	3C	6H	&C	&C
Pre	0,4			8G								8H			

TABLE I (continuación)

Cont- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Tomate	Cadillo	Casta	Yuca real	Carrachuelo	Cerezo	Avena lora	Trigo	Mate	Soja	Arroz	Sorgo
1																	
5		Post	0,4	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB
		Pre	0,4		εC	εC	4H	εE	9C	εC	εC	εC	εC	2C	1C	9C	εC
														8H	9H		
10		Post	0,4	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB
		Pre	0,4		εC	εC	1C	εC	9C	εC	εC	εC	εC	εC	εH	εC	εC
		Pre	0,4				7H										
15		Post	0,4	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB	εB
		Pre	0,4		εC	εC	9C	εC	εC	εC	εC	εC	εC	εC	εH	9C	εC

20

25

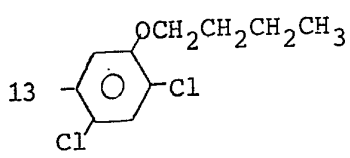
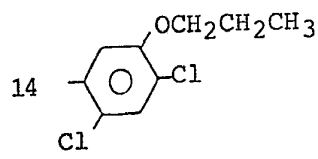
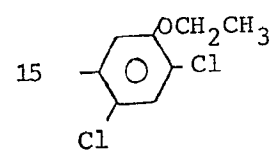
TABLA I (continua)

1

1

1

5

Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea
		Post	0,4	&B	9B	&B
13		Pre	0,4			&C
10		Post	0,4	&B	&B	&B
14		Pre	0,4			&C
		Pre	0,4			
15		Post	0,4	&B	&B	&B
15		Pre	0,4			&C

20

25

TABLA I (continuación)

Nombre de localización	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
st	0,4	&B	9B	&B	8B	9B	8B	&B	&B	9B	5B	8B	9B	7B	9B
e	0,4			&C	4H	&E	9C	&C	&C	&C	&C	2C	1C	9C	&C
												8H	9H		
st	0,4	&B	&B	&B	&B	&B	&B	&B	&B	9B	8B	8B	&B	9B	9B
e	0,4			&C	1C	&C	9C	&C	&C	&C	&C	9H	&H	&C	&C
e	0,4				7H										
st	0,4	&B	&B	&B	9B	9B	9B	&B	&B	&B	9B	9B	9B	9B	&B
e	0,4			&C	9C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9H	&H	9C	&C

1

TABLA I (conti

5

10

15

20

25

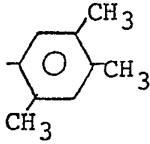
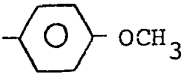
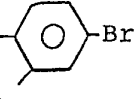
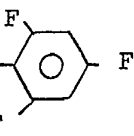
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enaro	Algodón	
		Post	0,4	6B	7B	9
		Post	0,4		6D	
16		Pre	0,4			2
		Pre	0,4			
		Post	2,0	9B	8B	9
17		Post	2,0		8D	
		Pre	2,0			1
		Pre	2,0			3
18		Post	2,0	8B	9B	9
		Pre	2,0			8
19		Post	2,0	8B	8B	7
		Pre	2,0			1
		Pre	2,0			6

TABLA I (continua)

1

5

10

15

20

25

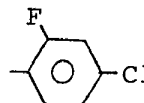
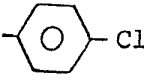
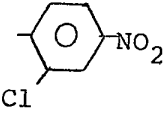
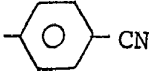
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea
20		Post	0,4	9B	9B	9B
		Post	0,4			
		Pre	0,4			1C
		Pre	0,4			6H
21		Post	0,4	8B	8B	6B
		Pre	0,4			0
		Pre	0,4			
22		Post	2,0	7B	7B	8B
		Post	2,0			
		Pre	2,0			&C
		Pre	2,0			
23		Post	2,0	5B	5B	7B
		Pre	2,0			1C
		Pre	2,0			9H

TABLA I (continuación)

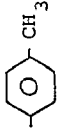
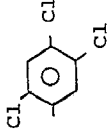
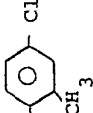
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/ha	Frijol enano	Algodón	Idomea	Cadillo	Casta	Juncia real	Carranchuelo	Cerezo	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
24		Post	2,0	8B	9B	8B	4B	3B	1B	9B	6B	2B	2B	5B	5B	4B	7B
		Pre	2,0			2C	0	-	5C	&C	&C	8C	9C	5C	1C	-	9H
		Pre	2,0											9H	9H		
		Post	0,4	6B	8B	4B	2B	1B	1B	5B	5B	1B	1B	3B	3B	3B	4B
		Pre	0,4			1H	0	-	0	9C	9C	7C	7C	1C	2C	2C	5C
		Pre	0,4											4H			
25		Post	0,4	9B	9B	9B	7B	4B	5B	8B	9B	7B	6B	6B	8B	8B	8B
		Pre	0,4			9H	1C	-	7C	&C	&C	&C	&C	9C	8H	9C	&C
		Pre	0,4														
26		Post	0,4	9B	9B	9B	4B	4B	6B	8B	8B	5B	5B	6B	8B	5B	7B
		Pre	0,4			&C	&C	-	9C	&C	&C	&C	&C	9C	9H	9C	&C

TABLA I (continua)

1

5

10

15

20

25

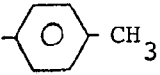
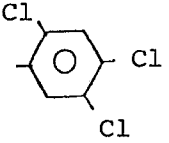
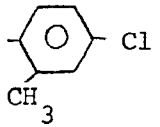
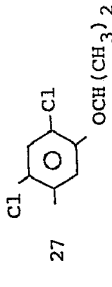
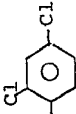
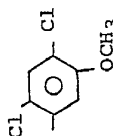
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	
		Post	2,0	8B	9B	8
24		Pre	2,0			2
		Pre	2,0			
		Post	0,4	6B	8B	4
		Pre	0,4			1
		Pre	0,4			
25		Post	0,4	9B	9B	9
		Pre	0,4			9
		Pre	0,4			
26		Post	0,4	9B	9B	9B
		Pre	0,4			&C

TABLA I (continuación)

Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	2,0	8B	9B	8B	4B	3B	1B	9B	6B	2B	2B	5B	5B	4B	7B
Pre	2,0			2C	0	-	5C	&C	&C	8C	9C	5C	1C	-	9H
Pre	2,0											9H	9H		
Post	0,4	6B	8B	4B	2B	1B	1B	5B	5B	1B	1B	3B	3B	3B	4B
Pre	0,4			1H	0	-	0	9C	9C	7C	7C	1C	2C	2C	5C
Pre	0,4											4H			
Post	0,4	9B	9B	9B	7B	4B	5B	&B	9B	7B	6B	6B	8B	8B	8B
Pre	0,4			9H	1C	-	7C	&C	&C	&C	&C	9C	8H	9C	&C
Pre	0,4				3H										
Post	0,4	9B	9B	9B	4B	4B	6B	&B	8B	5B	5B	6B	8B	5B	7B
Pre	0,4			&C	&C		9C	&C	&C	&C	&C	9C	9H	9C	&C

TABLA I (continuación)

Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/ha	Príol enano	Algodón	Isomra	Cadillo	Casla	Juncia real	Carrañuelo	Carrely	Avena loca	Trigo	Malz	Soja	Arroz	Sorgo
27		Post Pre	0,4 0,4		8B 8B	8B 8C	9B 8C	8B 8C	9B 8C	8B 8C	8B 8C	8B 8C	9B 8C	8B 9C	9B 9C	8B 8C	8B 8C
28		Post Pre	2,0 2,0		8B 9C	8B 8C	8B 8C	8B 8C	9B 4B	8B 8B	8B 8B	8B 8B	9B 8B	8B 8B	9B 8B	8B 8B	8B 8B
29		Post Pre	0,4 0,4		9B 9B	8B 8C	7B 8C	8B 8C	8B 8C	8B 8B	8B 8B	8B 8B	8B 8B	8B 8B	9B 9B	9B 9B	8B 8B

20

25

TABLA I (continua)

1

5

10

15

20

25

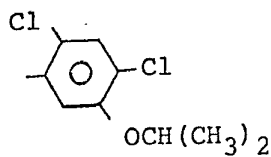
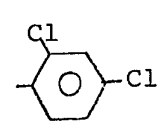
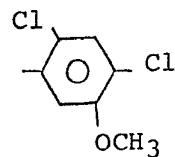
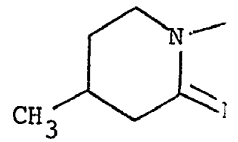
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ycaña
27		Post	0,4	&B	&B	&B
		Pre	0,4			&C
28		Post	2,0	&B	&B	&B
		Pre	2,0			9C
		Post	0,4	9B	9B	&B
		Pre	0,4			9H
29		Post	0,4	9B	9B	&B
		Pre	0,4			&C

TABLA I (continuación)

modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Carreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	0,4	&B	&B	&B	9B	&B	9B	&B	&B	&B	9B	8B	9B	&B	9B
Pre	0,4			&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9C	9C	&C	&C
Post	2,0	&B	&B	&B	8B	&B	9B	&B	&B	&B	9B	&B	9B	&B	&B
Pre	2,0			9C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9C	9C	&C
Post	0,4	9B	9B	&B	7B	5B	4B	&B	&B	9B	8B	8B	8B	7B	9B
Pre	0,4			9H	&E	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9H	9C	&C
Post	0,4	9B	9B	&B	7B	8B	9B	&B	&B	8B	8B	9B	9B	9B	&B
Pre	0,4			&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9C	&C	&C

TABLA I

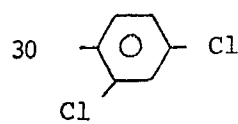


1

5

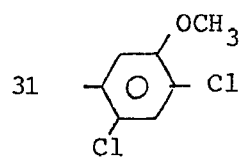
10

Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea
-----------------------	------	----------------------------	-------	-----------------	---------	--------



Post	2,0	9B	9B	&B	9
Pre	2,0			&C	9

15

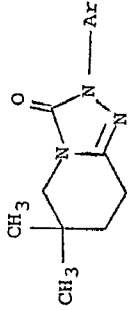


Post	2,0	9B	9B	&B	9
Pre	2,0			&C	8

20

25

TABLA I (continuación)



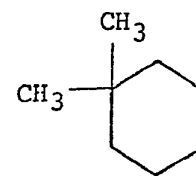
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casía	Juncia real	Garranchuelo	Cereig	Avena loca	Trigo	Matz	Soja	Arroz	Sorgo
32		Post	0,4	9B	9B	8B	5B	5B	5B	9B	9B	5B	5B	8C	9B	7B	9B
		Post	0,4						7C			5H	6H				
		Pre	0,4			8C	3C	9C	9C	8C	8C	8C	8C	9C	9C	9C	8C
		Pre	0,4				6H										

15

20

25

TABLA I (



1

5

10

Com-
pues
to n°

Ar =

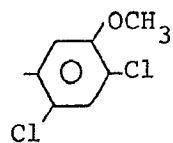
Modo de
aplica-
ción

Kg/Ha

Frijol enano

Algodón

32



Post

0,4

9B

9B

Post

0,4

Pre

0,4

Pre

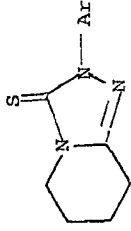
0,4

15

20

25

TABLA I (continuación)



Com- pues- to π°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Junca real	Garranchuelo	Cerealy	Avena loca	Trigo	Maiz	Soja	Arroz	Sorgo
33		Post	0,4	9B	9B	6B	9B	9B	5B	7B	7B	3B	5B	7B	9B	6B	9B
		Pre	0,4			9C	6E	6E	5C	6C	6C	9C	9C	4C	6C	9C	9H
		Pre	0,4														8H

15

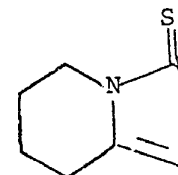
20

25

TABLA I (con

1

5



10

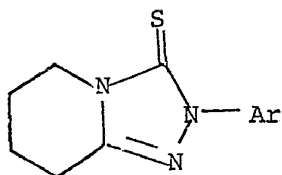
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Tronera
		Post	0,4	9B	9B	&B
33	<p>Chemical structure of a benzene ring with a fluorine atom at the 3-position and a bromine atom at the 4-position.</p>	Pre	0,4			9C
		Pre	0,4			

15

20

25

TABLA I (continuación)



Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	0,4	9B	9B	&B	9B	9B	5B	7B	7B	3B	5B	7B	9B	6B	9B
Pre	0,4			9C	&E	&E	5C	&C	&C	9C	9C	4C	&C	9C	9H
Pre	0,4											8H			

1

5

10

15

20

25

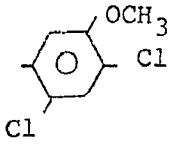
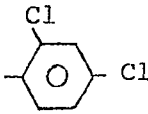
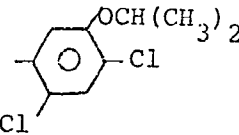
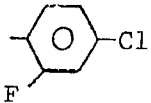
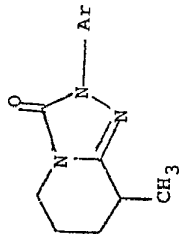
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción
34		Post Pre Pre
35		Post Pre Pre
36		Post Pre Pre
37		Post Pre

TABLA I (continuación)

=	Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Castia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
H ₃ Cl	Post	0,4	&B	&B	&B	&B	8B	5B	9B	8B	6B	6B	5B	9B	8B	9B
	Pre	0,4			&C	&C	&C	8C	&C	&C	&C	&C	9C	2C	&C	&C
	Pre	0,4												9H		
Cl	Post	0,4	9B	9B	&B	8B	9B	&B	9B	8B	7B	5B	5B	8B	6B	7B
	Pre	0,4			2C	1C	&C	8C	&C	&C	&C	&C	2C	2C	9C	9C
	Pre	0,4			8H	8G							8H	9H		
H ₃) ₂	Post	0,4	8B	&B	&B	&B	7B	8B	&B	&B	7B	6B	7B	9B	9B	9B
	Pre	0,4			&C	&E	&C	9C	&C	&C	&C	9C	3C	9H	&C	&C
	Pre	0,4											7H			
-Cl	Post	0,4	&B	&B	&B	&B	&B	5B	9B	7B	6B	5B	5B	9B	9B	8B
	Pre	0,4			9H	&C	&C	9C	&C	&C	&C	&C	9H	9H	9C	9C

TABLA I (continuación)



1

5

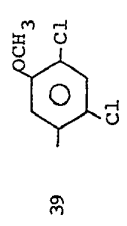
10

15

20

25

Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Trijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casta	Juncia real	Garranchuelo	Cereales	Avena loca	Trigo	Maiz	Soja	Arroz	Sorgo
38		Post	0,4	8B	8B	4B	5B	1B	1B	6B	9B	4F	3B	7B	6B	5B	6B
		Post	0,4		6D												
		Pre	0,4			3C	1C	8C	8C	8C	8C	8C	9C	9H	9H	9C	9C
		Pre	0,4														
		Post	0,4	8B	9B	4B	6B	5B	7B	9B	9B	6B	6B	5B	9B	7B	9B
		Post	0,4		5D							8H		9H			
		Pre	0,4			8C	9C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	8C	9H	8C	8C



1

TABL

5



10

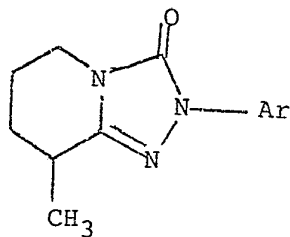
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón
		Post	0,4	8B	8B
38	 <chem>ClC1=CC=CC=C1Cl</chem>	Post	0,4		6D
		Pre	0,4		
		Pre	0,4		
		Post	0,4	8B	9B
39	 <chem>COc1c(Cl)cccc1Cl</chem>	Post.	0,4		5D
		Pre	0,4		

15

20

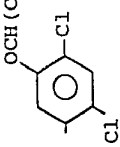
25

TABLA I (continuación)



Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	0,4	8B	8B	&B	5B	1B	1B	6B	9B	4R	3B	7B	6B	5B	6B
Post	0,4		6D												
Pre	0,4			3C	1C	&C	8C	&C	&C	&C	9C	9H	9H	9C	9C
Pre	0,4				9H										
Post	0,4	8B	9B	&B	6B	5B	7B	9B	9B	6B	6B	5B	9B	7B	9B
Post.	0,4		5D							8H		9H			
Pre	0,4			&C	9C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	&C	9H	&C	&C

TABLA I (continuación)

I	Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Cultivos																			
					Trilol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casta	Juncia real	Carranquelo	Cerealis	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Aroz	Sorgo						
5	40		Post	0,4	9B	9B	8B	9B	8B	9B	8B	5B	8B	6B	6B	3B	6B	8B	6B	6B				
			Post	0,4									9H			8H	7H					9H		
			Pre	0,4													8C	9H	9H	8C	9C	9H	9C	
10																								

15

20

25

1

TABLA

5

Com-
pues-
to n°

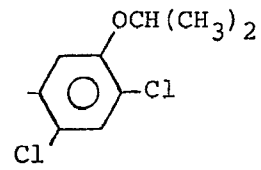
Ar =

Modo de
aplica-
ción

Kg/Ha

Frijol
enano

40



Post

0,4

9B

Post

0,4

Pre

0,4

10

15

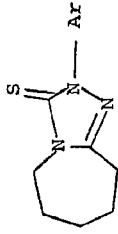
20

25

TABLA I (continuación)

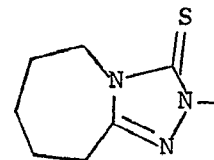
	Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Carranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
3) 2	Post	0,4	9B	9B	&B	8B	9B	&B	5B	&B	6B	6B	3B	6B	8B	6B
	Post	0,4							9H		8H	3H	7H			9H
	Pre	0,4			9H	&E	&C	&C	&C	&C	&C	9C	9H	9H	9C	&C

TABLE I (continuación)



Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casía	Juncia real	Garranchuelo	Gereig	Avena loca	Trigo	Maiz	Soja	Arroz	Sorgo	
10																		
5																		
15	41		2,0	5B 5B 6Y	9B 9B	5B 5B	5B 5B	2B 2B	1B 1B	5B 5B	5B 5B	1B 1B	1B 1B	2B 2B	3B 3B	2B 2B	3B 3B	1C 1C
20	42		2,0	5B 5B	9B 9B	5B 5B	5B 5B	2B 2B	3B 3B	6B 6B	9B 9B	3B 3B	2B 2B	3B 3B	6B 6B	5B 5B	3C 3C	6G 6G
25			2,0	5B 5B	9B 9B	5B 5B	5B 5B	2H 2H	1C 1C	9H 9H	8C 8C	9C 9C	9C 9C	5C 5C	7G 7G	9H 9H	7H 7H	

TABLA I (cc)



1

5

10

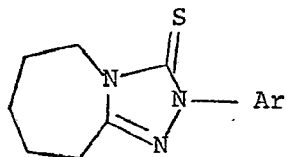
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón
		Post	2,0	5B	9B 5:
41		Post	2,0	6Y	
		Pre	2,0		2:
		Pre	2,0		
		Post	2,0	&B	&B 9F
42		Pre	2,0		5C
		Pre	2,0		

15

20

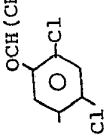
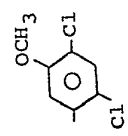
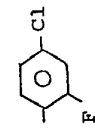
25

TABLA I (continuación)



Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
		Post	2,0	5B	9B	5B	5B	2B	1B	5B	5B	1B	1B	2B	3B
Post	2,0	6Y													
Pre	2,0			2G	0	0	0	5G	9C	8C	7C	6C	1H	9C	1C
Pre	2,0														6G
Post	2,0	8B	8B	9B	9B	3B	3B	6B	9B	3B	2B	3B	6B	6B	5B
Pre	2,0			5G	3G	2H	1C	9H	8C	9C	9C	5C	7G	5C	3C
Pre	2,0						6G					9H		9H	7H

TABLA I (continuación)

Com- pues to, II.	AR =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Cultivos													
				Frijol enano	Algodón	Tronera	Cadillo	Casta	Juncia real	Garranchuelo	Cereales	Avena loca	Trigo	Mais	Soja	Aroz	Sorgo
5	$\text{Ar} = \text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2(\text{Cl})_2$ 	Post	0,4	9B	9B	8B	2B	9B	4B	9B	9B	7B	7B	6B	9B	9B	8B
43		Post	0,4				9H										
		Pre	0,4			5H	0	9C	9C	8C	8C	9C	9C	8H	9H	8C	8C
10	$\text{Ar} = \text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)(\text{Cl})_2$ 	Post	0,4	9B	8B	8B	9B	9B	5B	9B	9B	5B	5B	4B	8B	5B	4B
44		Post	0,4		8D												
		Pre	0,4			9G	1C	0	7C	9C	8C	9C	9C	7C	1C	7C	8C
15	$\text{Ar} = \text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)(\text{Cl})(\text{F})$ 	Post	2,0	9B	9B	9B	7B	5B	7B	8B	8B	9B	8B	7B	9B	9B	7B
		Post	2,0											9H			9H
		Pre	2,0						9C	8C	8C	9C	8C	8H	9H	9C	9C

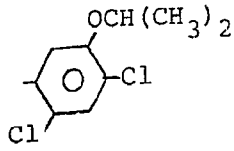
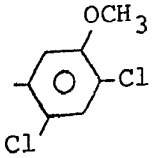
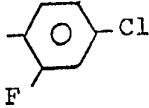
20

25

TABLA I (cont.)

1

5

Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón
43		Post	0,4	9B	9B
		Post	0,4		
		Pre	0,4		
44		Post	0,4	9B	8B
		Post	0,4		8D
		Pre	0,4		
45		Post	2,0	9B	9B
		Post	2,0		
		Pre	2,0		

10

15

20

25

TABLA I (continuación)

Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	0,4	9B	9B	&B	2B	9B	4B	9B	9B	7B	7B	6B	9B	9B	8B
Post	0,4				9H										
Pre	0,4			5H	0	9C	9C	&C	&C	9C	9C	&H	9H	&C	&C
Post	0,4	9B	8B	&B	9B	9B	5B	9B	9B	5B	5B	4B	8B	5B	4B
Post	0,4		8D												
Pre	0,4			9G	1C	0	7C	9C	&C	9C	9C	7C	1C 7G	9C	&C
Post	2,0	9B	9B	9B	7B	5B	7B	&B	&B	9B	8B	7B	9B	9B	7B
Post	2,0											9H			9H
Pre	2,0			9G	&C	&C	9C	&C	&C	&C	&C	&H	9H	9C	9C

TABLA I (continuación)

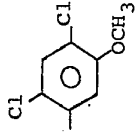
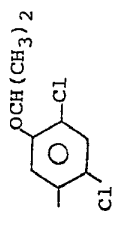
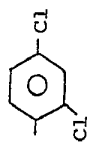
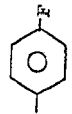
Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/ha	Cultivos																	
				Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Carrizhuale	Cereales	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo				
5		Post	0,4	8B	9B	8B	6B	5B	7B	4B	9H	9B	7B	6B	8B	8B	9B	9B			
		Post	0,4																		
		Pre	0,4	9G		6G	6C	9C	8C				8C	8C	8C	1C	9C	9H	9C	8C	
		Pre	0,4																		9H
10		Post	0,4	9B	9B	8B	9B	8B	9B	9B	8B	9B	8B	7C	6B	9B	8B	9B	9B		
		Pre	0,4																		
		Pre	0,4																		
15		Post	2,0	9B	9B	5B	3B	9B	9B	9B	8B	9B	8B	9B	8B	9B	9B	9B	9B		
		Pre	2,0			9H	8H	8C	9C	8C			8C	8C	8C	9H	1C	9C	9C	8C	8H
20		Post	2,0	3B	5B	1B	1B	0	1B	0	1B	2B	2C	1B	4B	1B	4B	1B	4B		
		Post	2,0	9D																	
		Pre	2,0			1C	0	0	0	5G	9C	8C	5C	1C	2C	2C	5G				
		Pre	2,0																		

TABLA I (conti

1

5

10

15

20

25

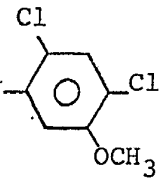
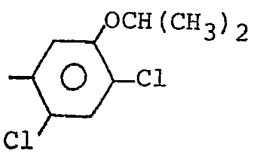
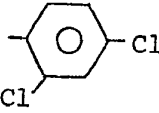
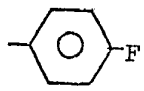
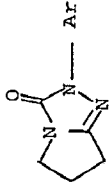
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón		
46		Post	0,4	8B	9B		
		Post	0,4				
		Pre	0,4				
		Pre	0,4				
47		Post	0,4	9B	9B		
		Pre	0,4				
		Pre	0,4				
48		Post	2,0	9B	9B		
		Pre	2,0				
49		Post	2,0	3B	5B		
		Post	2,0			9D	
		Pre	2,0				10
		Pre	2,0				

TABLA I (continuación)

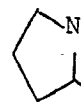
Estado de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Carranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
st	0,4	&B	9B	&B	6B	5B	7B	4B	9B	9B	7B	6B	8B	9B	9B
st	0,4							9H							
re	0,4			9G	6G	6C	9C	&C	&C	&C	&C	&C	1C	9C	&C
re	0,4												9H		
st	0,4	9B	9B	&B	&B	9B	8B	9B	9B	8B	7C	6B	9B	&B	9B
e	0,4			1C	5G	9C	9C	&C	&C	&C	9C	&C	9H	9C	&C
e	0,4			8G											
st	2,0	9B	9B	&B	5B	3B	9B	9B	&B	&B	9B	8B	9B	9B	9B
e	2,0			9H	8H	&C	9C	&C	&C	&C	&C	9H	1C	9C	&C
													8H		
st	2,0	3B	5B	1B	1B	1B	0	1B	2B	2B	2C	1B	4B	1B	4B
st	2,0		9D												
e	2,0			1C	0	0	0	5G	9C	8C	8C	5C	1C	2C	2C
e	2,0												5G		

TABLA I (continuación)



Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Trifol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casta	Juncia real	Garranchuelo	Cereals	Avena loca	Trigo	Maiz	Soja	Arroz	Sorgo	
10		Post	2,0	9B	9B	9B	5B	4B	2B	9B	9B	7B	5B	8B	8B	6B	8B	
		Pre	2,0			5C	4H	&C			&C	&C	&C	&C	9C	1C	9C	&C
		Pre	2,0			9H										9H		
15		Post	0,4	8B	9B	5B	2B	2B	2B	7B	6B	3B	3B	3B	6B	4B	6B	
		Pre	0,4			2H	1H	5C	0	0	&C	&C	9C	9C	5C	1C	5C	8C
		Pre	0,4												9H	5H		
20		Post	0,4	9B	9B	4B	3B	2B	2B	9B	4B	3B	3B	5B	8B	3B	5B	
		Pre	0,4			4C	1C	1C	9C	9C	&C	&C	&C	&C	&C	9H	&C	&C
		Pre	0,4				5G	5G										

TABLA I



1

5

10

15

20

25

Com- pues- to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano
50		Post	2,0	9B
		Pre	2,0	
		Pre	2,0	
		Post	0,4	8B
		Pre	0,4	
		Pre	0,4	
51		Post	0,4	9B
		Pre	0,4	
		Pre	0,4	

TABLA I (continuación)

1

5

10

15

20

25

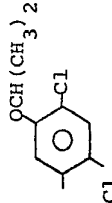
Compuestos to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Ptíjol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casta	Juncia real	Garranchuelo	Cereig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
52		Post	0,4	8B	9B	8B	7B	5B	8B	9B	8B	6B	5B	4B	7B	7B	9B
		Pre	0,4			9C	1C	1C	8C	8C	8C	8C	8C	2C	8E	8C	8C
		Pre	0,4				2H	5G						9H			

TABLA I (cc

1

5

10

15

20

25

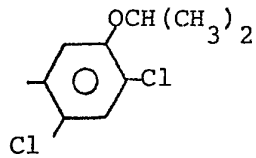
Com- pues to n°	Ar =	Modo de aplica- ción	Kg/Ha	Frijol enano
52		Post	0,4	&B 9I
		Pre	0,4	
		Pre	0,4	

TABLA I (continuación)

Modo de aplicación	Kg/Ha	Frijol enano	Algodón	Ipomea	Cadillo	Casia	Juncia real	Garranchuelo	Cerreig	Avena loca	Trigo	Maíz	Soja	Arroz	Sorgo
Post	0,4	&B	9B	&B	7B	5B	8B	9B	&B	6B	5B	4B	7B	7B	9B
Pre	0,4			9C	1C	1C	&C	&C	&C	&C	&C	2C	&E	&C	&C
Pre	0,4				2H	5G						9H			

1

EJEMPLO 26

Dos bandejas de plástico para bulbos se llenan con marga de alubión de Fallsington fertilizada y calcificada. Una bandeja se siembra con maíz, sorgo y varias malas hierbas grasas. La otra bandeja se siembra con soja, juncia real púrpura (Cyperus rotundus) y varias hierbas de hoja ancha. Se siembra la siguiente maleza herbácea y de hoja ancha: garranchuelo (Digitaria sanguinalis), cerreig (Echinochloa crusgalli), avena loca (Avena fatua), cañota (Sorghum halepense), almorejo gigante (Setaria faberii), pelosa (Poa pratensis), bromo (Bromus secalinus), mostaza (Brassica arvensis), cadillo (Xanthium pennsylvanicum), bledo (Amaranthus retroflexus), ipomea (Ipomoea hederacea), casia (Cassia tora), sida (Sida spinosa), gordolobo (Abutilon theophrasti) y hierba talpera (Datura stramonium). También se llena un vaso de papel de 5" (12,7 cm) de diámetro con tierra preparada y se siembra con arroz y trigo. Otro vaso de 5" (12,7 cm) se siembra con remolacha azucarera. Los cuatro envases anteriores se someten a un tratamiento de pre-emergencia (compuesto rociado sobre la superficie del terreno antes de la germinación de la simiente) con los compuestos de ensayo. Veintiocho días después del tratamiento, se evalúan las plantas y los datos registrados están indicados en la Tabla II: 0 = no hay respuesta; 10 = respuesta máxima.

5

10

15

20

25

1 Estos datos demuestran que se consigue un buen control
de un amplio espectro de malas hierbas a bajas proporciones
y selectividad sobre cultivos como maíz, remolacha azucare-
ra y trigo.

5

10

15

20

25

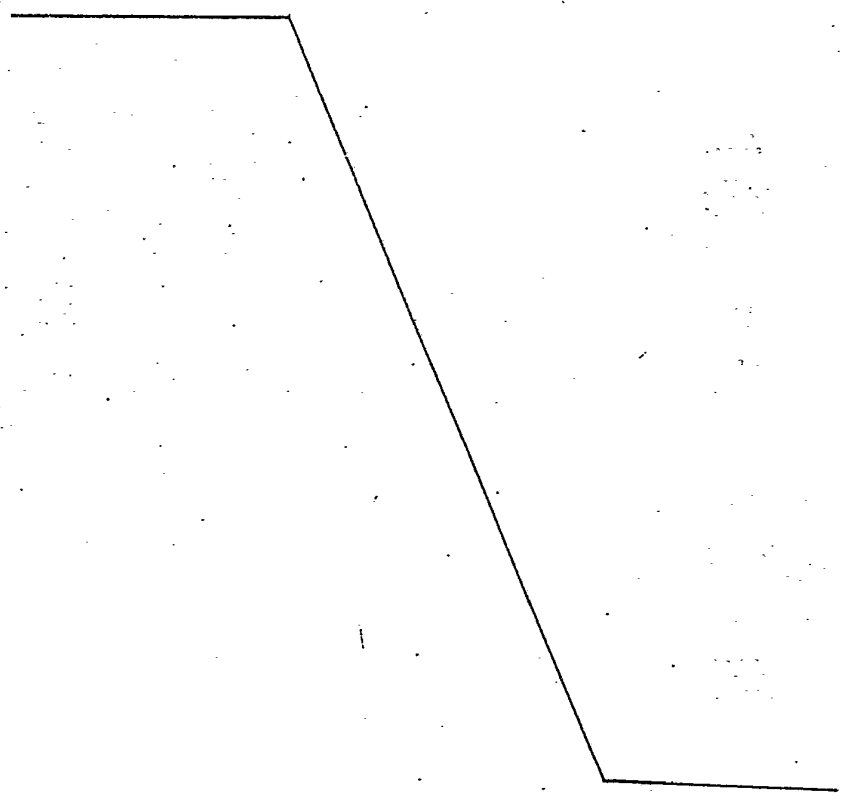
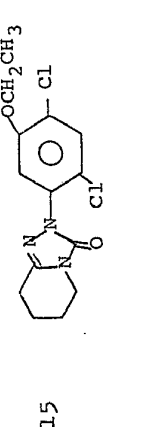
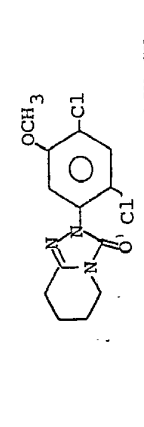
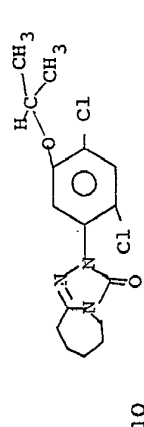
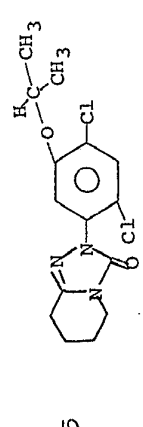


TABLA II

Pre-emergencia sobre marca de alubión de Fallington

Kg/ha	Garran		Avena		Marga		Almoraço		Remolacha	
	chuelo	Cerreig	Sorço	loca	Cañata	rata	gigante	Felosa	Bromo	azucarera
0,03	7H	6H	3H	2H	8H	8H	4H	6H	2H	5H
0,06	10H	10H	4H	6H	10H	9H	8H	8H	5H	6H
0,12	10H	10H	6H	9H	10H	10H	9H	10H	6H	10H
0,12	8H	6H	6H	4H	9H	7H	8H	7H	4H	3H
0,50	10H	10H	10H	8H	10H	9H	10H	10H	7H	6H
0,06	10E	10H	9H	8C	10H	10H	10H	10H	8H	10C
0,12	10E	10H	10H	9C	10H	10H	10E	10E	9H	10C
0,50	10E	10E	10H	10C	10H	10H	10E	10E	10H	10C
0,06	10H	7H	6H	6H	7H	-	10H	9H	2H	9H
0,25	10H	10H	10H	10H	10H	-	10H	10H	9H	10H



20

25

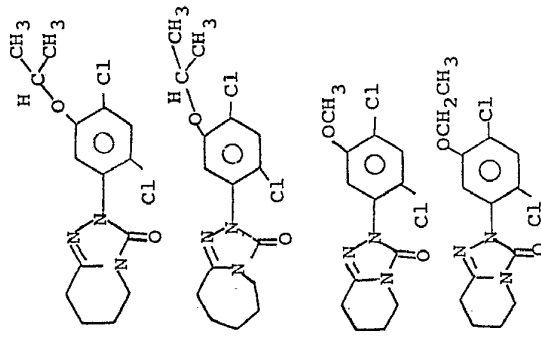
TABLA II

emergencia sobre marga de alubi6n de Fallsington

<u>Kg/Ha</u>	<u>Garran</u> <u>chuelo</u>	<u>Carreig</u>	<u>Sorgo</u>	<u>Avena</u> <u>loca</u>	<u>Cañota</u>	<u>Marga</u> <u>rita</u>	<u>Almorejo</u> <u>gigante</u>	<u>Pelosa</u>	<u>Bromo</u>	<u>Remolacha</u> <u>azucarera</u>
0,03	7H	6H	3H	2H	8H	8H	4H	6H	2H	5H
0,06	10H	10H	4H	6H	10H	9H	8H	8H	5H	6H
0,12	10H	10H	6H	9H	10H	10H	9H	10H	6H	10H
0,12	8H	6H	6H	4H	9H	7H	8H	7H	4H	3H
0,50	10H	10H	10H	8H	10H	9H	10H	10H	7H	6H
0,06	10E	10H	9H	8C	10H	10H	10H	10H	8H	10C
0,12	10E	10H	10H	9C	10H	10H	10E	10E	9H	10C
0,50	10E	10E	10H	10C	10H	10H	10E	10E	10H	10C
0,06	10H	7H	6H	6H	7H	-	10H	9H	2H	9H
0,25	10H	10H	10H	10H	10H	-	10H	10H	9H	10H

TABLA II (continuación)

Kg/Ha	Mosta Cadi		Indi	Ico	Cordo Hierba		Soja	Arroz	Trigo		
	Maíz	za			mea	Sida				lobo	talpera
0,03	0	9H	0	0	0	0	0	0	3H	2H	
0,06	2C	10H	0	2H	0	5H	10H	10H	0	5H	3H
0,12	2C	10H	0	5H	2H	10H	10H	10H	0	8H	5H
0,12	0	4G	0	5H	8H	9H	10H	10H	3H	4H	0
0,50	4H	10H	10C	2H	4H	2H	10H	10H	3G	7H	5H
0,06	0	10E	0	10C	0	10E	10E	10C	0	10H	5H
0,12	0	10E	7C	2C	10C	0	10E	10E	2C	10H	8H
0,50	5H	10E	6C	10E	10C	10C	10E	10E	5C	10H	10H
0,06	0	10C	4C	10C	0	10C	10C	8C	0	6H	5H
0,25	4H	10C	5C	10C	4C	10C	7C	10C	8H	9H	7H



1

5

10

15

20

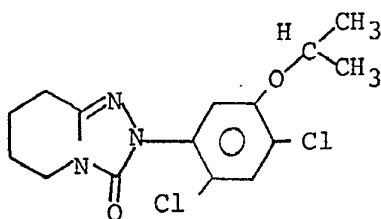
25

1

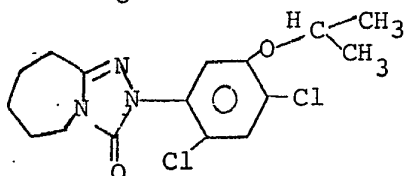
TABLA II (conti

Kg/Ha Maíz za llo Bled
Mosta Cadi

5

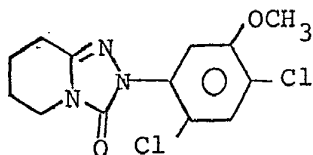


0,03	0	9H	0	10H
0,06	2C	10H	0	10H
0,12	2C	10H	0	10H



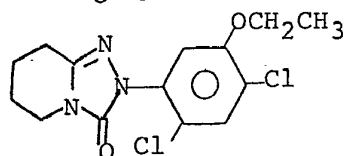
0,12	0	4G	0	10E
0,50	4H	10H	10H	10C

10



0,06	0	10E	0	10E
0,12	0	10E	7C	10E
0,50	5H	10E	6C	10E

15



0,06	0	10C	4C	10C
0,25	4H	10C	5C	10C

20

25

TABLA II (continuación)

<u>Kg/Ha</u>	<u>Maíz</u>	<u>Mosta</u>	<u>Cadi</u>	<u>Bledo</u>	<u>Juncia</u>	<u>Indi</u>	<u>Ipo</u>	<u>Casia</u>	<u>Sida</u>	<u>Gordo</u>	<u>Hierba</u>	<u>Soja</u>	<u>Arroz</u>	<u>Trigo</u>
		<u>za</u>	<u>llo</u>			<u>go</u>	<u>nea</u>			<u>lobo</u>	<u>talpera</u>			
0,03	0	9H	0	10H	0	-	0	0	0	9H	0	0	3H	2H
0,06	2C	10H	0	10H	2C	-	2H	0	5H	10H	10H	0	5H	3H
0,12	2C	10H	0	10H	2C	-	5H	2H	10H	10H	10H	0	8H	5H
0,12	0	4G	0	10E	0	-	5H	8H	9H	10H	10H	3H	4H	0
0,50	4H	10H	10H	10C	2H	-	4H	2H	10H	10H	10H	3G	7H	5H
0,06	0	10E	0	10E	3C	-	10C	0	10E	10E	10C	0	10H	5H
0,12	0	10E	7C	10E	2C	-	10C	0	10E	10E	10E	2C	10H	8H
0,50	5H	10E	6C	10E	10C	-	10C	10C	10E	10E	10E	5C	10H	10H
0,06	0	10C	4C	10C	0	10C	6C	0	10C	10C	8C	0	6H	5H
0,25	4H	10C	5C	10C	4C	10C	10C	7C	10C	10C	10C	8H	9H	7H

1

EJEMPLO 27

5

10

15

20

25

Se realizó de la siguiente forma un ensayo para poner de manifiesto la utilidad de los compuestos de esta invención en el control selectivo de pre-emergencia de las malas hierbas en el maíz: unas macetas de plástico de 25 cm de diámetro, llenas de marga de alubión Flanagan (tierra de praderas que contiene aproximadamente 5,5 % de materia orgánica) se siembran con semillas de maíz Funk G 4646, a una profundidad de 3,7 cm o con una variedad de semillas de malas hierbas que se mezclan uniformemente con una capa superior de tierra de 2,5 cm. Las especies de malas hierbas utilizadas son: mostaza, gordolobo, hierba talpera, garranchuelo, cereig y almorejo gigante. Inmediatamente después de la siembra, se aplica el producto químico a ensayar, disuelto en un disolvente no fitotóxico, a la superficie desnuda del terreno, realizando cada tratamiento por duplicado. Después las plantaciones tratadas se mantienen en un invernadero donde se riegan totalmente cuando es necesario. La clasificación de las respuestas de las malas hierbas y de los cultivos se realiza 28 días después del tratamiento y los resultados se encuentran en la Tabla III. El sistema de clasificación es el descrito anteriormente.

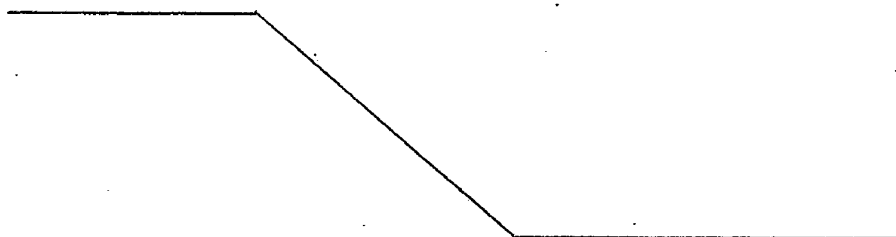


TABLA III

Eficacia de la 2-(2,4-dicloro-5-(1-(metilatoxi)fenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo(4,3-A)piridin-3(2H)-ona para el control selectivo de pre-emergencia de las malas hierbas en el maíz

Ensayo en invernadero

Proporción, Kg/Ha	Malas hierbas - Clasificación de los daños						Respuesta	
	Hoja ancha ¹		Herbácea ²		Maíz ³		Duplica do I	Duplica do II
	Duplica do I	Duplica do II	Duplica do I	Duplica do II	Duplica do I	Duplica do II		
0,06	6C	6C	7C	7C				
0,12	7C	8C	8C	7C	1C	1C		
0,25	9C	9C	9C	9C	4C	2C		
0,50					4C	3C		
0,75					6C	7C		
-	0	0	0	0	0	0		

¹ Mostaza, gordolobo, hierba talpera

² Carranchuelo, cerreiç, almorojo gigante

³ Funk G 4646.

20

25

TABLA III

Eficacia de la 2-(2,4-dicloro-5-(1-(metilatoxi)fer-
ridin-3(2H)-ona para el control selectivo de pre-e

Ensayo en inver

5

Proporción, Kg/Ha	Malas hierbas - Clasificación de los dañ			
	Hoja ancha ¹		Herbácea ²	
	Duplica- do I	Duplica do II	Duplica do I	Duplica do II
0,06	6C	6C	7C	7C
0,12	7C	8C	8C	7C
0,25	9C	9C	9C	9C
0,50				
0,75				
-	0	0	0	0

10

15

- 1 Mostaza, gordolobo, hierba talpera
- 2 Garranchuelo, cerreig, almorejo gigante
- 3 Funk G 4646.

20

25

TABLA III

cloro-5-(1-(metiletoksi)fenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo{4,3-A}pi-
control selectivo de pre-emergencia de las malas hierbas en el maíz

Ensayo en invernadero

<u>daños - Clasificación de los daños:</u>			<u>Respuesta</u>	
<u>1</u>	<u>Herbácea²</u>		<u>Maíz³</u>	
<u>Duplica</u> <u>do II</u>	<u>Duplica</u> <u>do I</u>	<u>Duplica</u> <u>do II</u>	<u>Duplica</u> <u>do I</u>	<u>Duplica</u> <u>do II</u>
6C	7C	7C		
8C	8C	7C	1C	1C
9C	9C	9C	4C	2C
			4C	3C
			6C	7C
0	0	0	0	0
talpera				
brejo gigante				

EJEMPLO 28

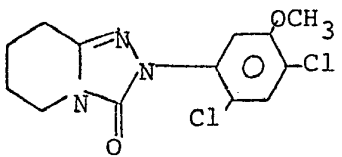
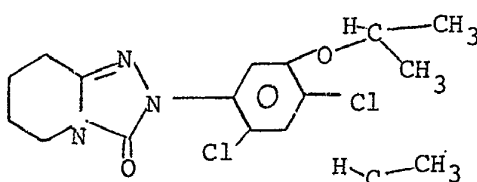
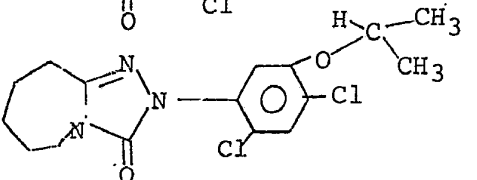
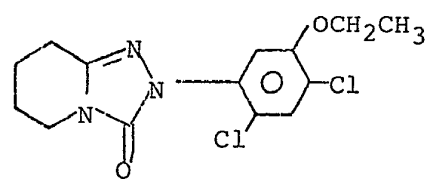
1 En otro ensayo, unas macetas de plástico llenas de marga
de alubión Fallsington se sembraron con soja, algodón, alfal-
fa, maíz, arroz, trigo, sorgo, gordolobo (Abutilon theophrasti),
5 sesbania (Sesbania exaltata), casia (Cassia tora), ipomea
(Ipomoea sp.), hierba talpera (Datura stramonium), cadillo
(Xanthium pennsylvanicum), garranchuelo (Digitaria, sp.), jun-
cia real (Cyperus rotundus), cereig (Echinochloa crusgalli),
almorejo gigante (Setaria faberi) y avena loca (Avena fatua).
10 Diez y ocho días después de la siembra, las plantas jóvenes
y la tierra que las rodea se riegan totalmente con los pro-
ductos químicos de ensayo disueltos en un disolvente no fito-
tóxico. Catorce días después del tratamiento, se comparan to-
das las especies con los controles no tratados y se clasifi-
15 ca visualmente la respuesta al tratamiento. Las clasificacio-
nes se basan de nuevo en una escala numérica que se extiende
desde 0 = ningún daño hasta 10 = destrucción completa. Los
símbolos descriptivos que acompañan a las cifras tienen los
siguientes significados: B = quemado; C = clorosis/necrosis y
20 H = efectos formativos. Las clasificaciones para el compuesto
ensayado por este procedimiento se encuentran en la Tabla IV.

25

TABLA IV

Tratamiento sobre la tie

1

	Compuesto	Kg/
5		0, 0,
		0, 0,
10		0, 0,
15		0, 0, 0,
20		

25

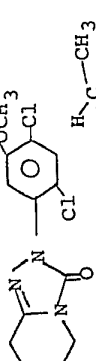
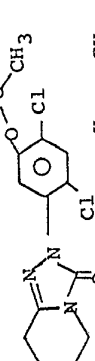
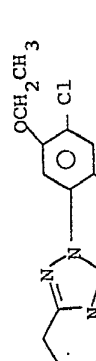
TABLA IV

Tratamiento sobre la tierra y el follaje

<u>Kg/Ha</u>	<u>Soja</u>	<u>Gordo lobo</u>	<u>Sesba nia</u>	<u>Casia</u>	<u>Algo dón</u>	<u>Ipo mea</u>	<u>Alfál fa</u>	<u>Hierba talpera</u>
0,12	8B	10B	10B	10B	10B	9B	9B	10B
0,50	9B	10B	10B	10B	10B	10B	10B	10B
3								
0,12	7B	10B	10B	9B	10B	8B	4B	10B
0,50	8B	10B	10B	10B	9B	10B	7B	10B
0,12	6B	8B	9B	8B	9B	8B	4B	8B
0,50	7B	-	10B	6B	10B	10B	6B	10B
0,06	8B	10B	8B	-	10B	9B	9B	10B
0,12	8B	10B	9B	5B	10B	7B	10B	10B
0,50	9B	10B	10B	10B	10B	10B	10B	10B

TABLA IV (continuación)

Tratamiento sobre la tierra y el follaje

Compuesto	Carran										Alno rejo gigante	Avena loca	Sorgo
	Kg/Ha	Cadillo	Miz	Arroz	Juncia	Carralg	Trigo	8B	10B	7B			
	0,12	7B	6B	10C	5C	2C	8B	4B	10C	6C	6B		
	0,50	10B	7B	10B	10B	10B	10B	8B	10B	9B	9B		
	0,12	-	5B	7B	6B	4B	8B	4B	7B	7B	10B		
	0,50	-	7B	8B	7B	6B	10B	6B	8B	10B	8B		
	0,12	-	3B	2B	0	0	4B	3B	3B	5B	4B		
	0,50	-	5B	5B	5B	3B	6B	5B	8B	6B	6B		
	0,06	3B	2B	7B	3B	2B	7B	4B	8B	3B	4B		
	0,12	3B	3B	9B	8B	3B	9B	5B	10B	5B	4B		
	0,50	4B	7B	1,0B	10B	7B	10B	5B	10B	5B	10B		

14

1

5

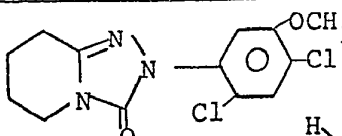
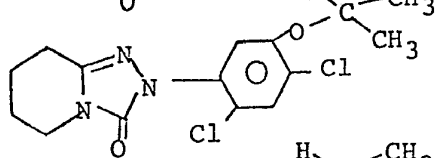
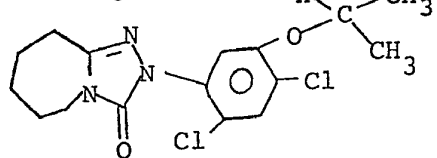
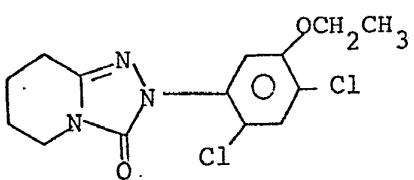
10

15

20

25

Tratamiento sobre la tie

	Compuesto	Kg/Ha	CaC
5		0,12	7
		0,50	10
		0,12	-
		0,50	-
10		0,12	-
		0,50	-
15		0,12	-
		0,50	-
20			
25			

1

EJEMPLO 29

Una remolacha azucarera cultivada en campo se sometió a tratamiento de pre-emergencia o de post-emergencia con 2-{2,4-dicloro-5-(1-metiletóxi)fenil}-2,5,6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo[4,3-a]azepin-3-ona. Los datos siguientes ilustran la utilidad del producto químico para el control de las malas hierbas en este cultivo.

5

10

Proporción, kg/Ha	Pre-emergencia		
	Herbáceas, % Control ¹	Hojas anchas, % Control ¹	Daños al cultivo de remolacha % ¹
0,125	20	20	0
0,25	35	30	0
0,5	80	50	0
1,0	95	90	10

15

1
Seis semanas después del tratamiento.

20

Proporción, kg/Ha	Post-emergencia		
	Herbáceas, % Control ²	Hojas anchas, % Control ²	Daños al cultivo de remolacha % ²
0,125	40	70	30
0,25	50	65	30
0,50	75	95	30
1,0	93	99	90

25

EJEMPLO 30

Un trigo temprano, sembrado en una manga de alubión,

1 se somete a tratamiento de pre-emergencia con 2-[2,4-dicloro-
5-(1-metiletoksi)fenil]-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo[4,3-
A]piridin-3(2H)-ona. Los datos sobre el control de las malas
5 hierbas dados a continuación, 10 semanas después del trata-
miento, indican que el material permite conseguir un control
eficaz.

Proporción, Kg/Ha	Control de las malas hierbas, %		Daños al trigo, %	Cosecha de trigo, % del Control
	Herbáceas	Hoja ancha		
10 0,06	57	80	0	120
0,125	92	93	0	131
0,25	98	96	10	128
0,50	98	99	57	88

15 En un segundo ensayo, el compuesto resultó algo más
perjudicial para el cultivo pero el control de las malas
hierbas fué bueno como demuestran los datos dados a conti-
nuación, tomados 6 semanas después del tratamiento.

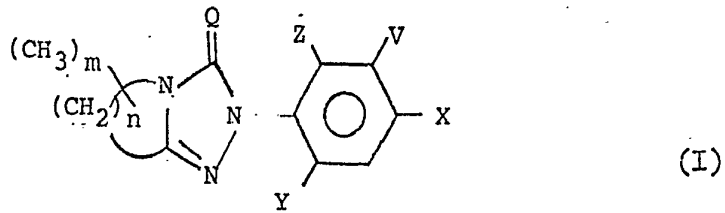
Proporción, Kg/Ha	Control de las malas hierbas, %		Daños al trigo, %
	Herbáceas	Hoja ancha	
20 0,06	20	73	0
0,125	50	90	20
0,25	80	94	50
0,50	92	99	80

25

1 En resumen, la Patente de Invención que se solicita
deberá recaer sobre las siguientes:

REIVINDICACIONES

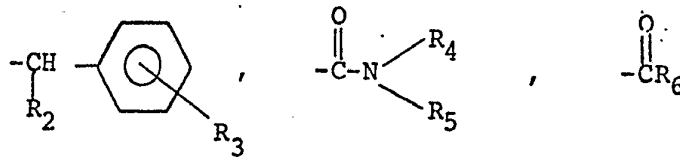
1.- Un procedimiento para la preparación de nuevos deri
5 vados bicíclicos de triazol:



10 donde

V es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, hidroxilo, alquilo
de 1 a 4 átomos de carbono u $-OR_1$, donde

15 R_1 es alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, opcionalmen
te sustituido con 1 a 3 átomos de flúor, cloro o bro
mo, cicloalquilo de 4 a 6 átomos de carbono, cicloal
quiloalquilo de 4 a 7 átomos de carbono, alqueno de
3 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido con 1
a 3 átomos de flúor, cloro o bromo, alquino de 3 a
20 6 átomos de carbono, CHR_7R_8 o



1

donde

R_2 es hidrógeno o metilo;

R_3 es hidrógeno, cloro, bromo, metilo o metoxi;

R_4 es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

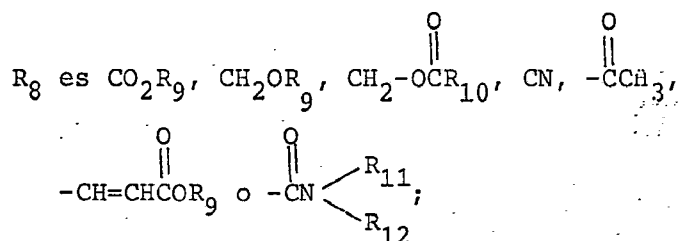
5

R_5 es hidrógeno, metilo o metoxi;

R_6 es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

R_7 es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

10



15

R_9 es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R_{10} es alquilo de 1 a 3 átomos de carbono;

R_{11} es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alqueno de 3 o 4 átomos de carbono o alcoxi de 1 o 2 átomos de carbono y

20

R_{12} es hidrógeno o alquilo de 1 o 2 átomos de carbono;

X es flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, metoxi o nitro;

Y es hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo;

25

Z es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

n es 3, 4 o 5;

1

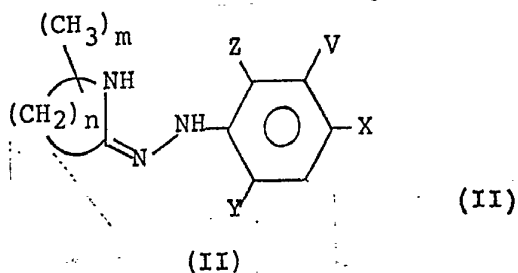
m es 0, 1 o 2 y

Q es oxígeno o azufre;

cuyo procedimiento comprende:

5

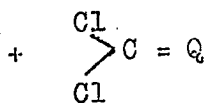
(a) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)



10

donde los diferentes símbolos tienen el significado dado anteriormente, con un compuesto de fórmula (III):

15



(III)

donde Q es el definido anteriormente, en un disolvente orgánico apropiado y en presencia de una base, para obtener un compuesto de fórmula (I):

20

(b) opcionalmente, transformar uno o varios de los radicales Z, V, X e Y antes definidos en otros radicales Z, V, X e Y comprendidos dentro de las definiciones dadas anteriormente.

25

2.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde V es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, hidroxilo, metilo u -OR₁.

3.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde X

1 es flúor, cloro, bromo, metilo o nitro.

4.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde Y es flúor, cloro, bromo o metilo.

5 5.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde Z es hidrógeno, flúor o cloro.

6.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde n es 4 o 5.

7.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde m es 0.

10 8.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde V es hidrógeno, cloro, bromo u $-OR_1$ y R_1 es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; X es flúor, cloro o bromo; Y es flúor, cloro, bromo o metilo; Z es hidrógeno y n es 4 o 5.

15 9.- Un procedimiento según la Reivindicación 8, donde n es 4.

10.- Un procedimiento según la Reivindicación 8, donde V es hidrógeno, cloro u $-OR_1$; X es cloro o bromo e Y es flúor, cloro o bromo.

20 11.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde el nombre del producto obtenido es 2- $\{2,4$ -dicloro-5-(1-metiletoxi)fenil $\}$ -5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo $\{4,3-A\}$ piridin-3(2H)-ona.

25 12.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde el nombre del producto obtenido es 2-(2,4-dicloro-5-metoxifenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo $\{4,3-A\}$ piridin-3(2H)-ona.

1 13.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde
el nombre del producto obtenido es 2-(2,4-dicloro-5-etoxife
nil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo {4,3-A} piridin-3(2H)
-ona.

5 14.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde
el nombre del producto obtenido es 2- { 2,4-dicloro-5-(1-meti
letoxi)fenil } -2,5,6,7,8,9-hexahidro-3H-1,2,4-triazolo {4,3-A}
azepin-3-ona.

10 15.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde
el nombre del producto obtenido es 2-(2,4-dicloro-5-hidroxi-
fenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo {4,3-A} piridin-3
(2H)-ona.

15 16.- Un procedimiento según la Reivindicación 1, donde
el nombre del producto obtenido es 2-(2,4-dicloro-5-propar-
gilocefenil)-5,6,7,8-tetrahidro-1,2,4-triazolo {4,3-A}piridin-
3(2H)-ona.

20 17.- Se reivindica por último como objeto sobre el que
ha de recaer la Patente de Invención que se solicita por:
UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVOS DERIVADOS BICI
CLICOS DE TRIAZOL.

25 Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presen
te memoria descriptiva, que consta de ciento cinco páginas me
canografiadas.

Madrid, 12 Enero de 1.978

BERNARDO UNGRIA

D.P.

