

MINISTERIO DE INDUSTRIA Y ENERGIA

Registro de la Propiedad Industrial



ESPAÑA

19	ES	11	NUMERO	10	AI
		21	476119		
		22	FECHA DE PRESENTACION		
			9. DIC. 1978		

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

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
53902/77 (provisional)	24-12-77	Gran Bretaña
31015/78 (provisional)	25-7-78	" "
48050/78 (completa)	12-12-78	" "

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	52 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07C; A01N	

54 TITULO DE LA INVENCION
"UN PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR UNA SULFONANILIDA"

71 SOLICITANTE (S)	(53902/77 LSB/EJL/LD)
FISONS LIMITED	

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
Fison House, 9 Grosvenor Street, Londres, Inglaterra

72 INVENTOR (ES)
Geoffrey Ross Cliff, Russell George Hunt y Albert Percival

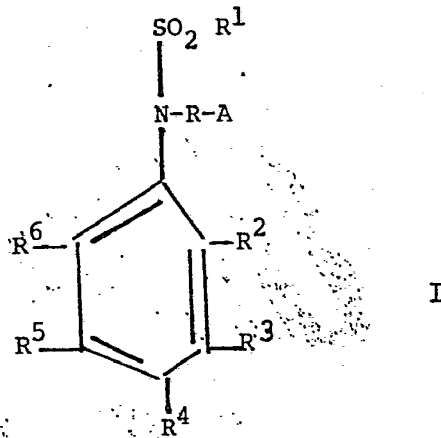
73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE
DON FERNANDO DE ELZABURU MARQUEZ (P.- 70.687)

70687

Esta invención se refiere a compuestos nuevos y a su producción, y a los métodos y composiciones para combatir plagas y para regular el crecimiento de una planta.

Por consiguiente, la invención provee un método para combatir las plagas en un lugar infestado o propenso a ser infestado por éstas o para regular el crecimiento de una planta en el lugar en el cual la planta está creciendo o ha de crecer; método que comprende la aplicación en el lugar, de una cantidad combatiente de plaga o reguladora del crecimiento de la planta, de un compuesto que es una sulfonanilida de fórmula:



o la sal de la misma, en donde

R¹ representa alquilo, alquilo sustituido, cicloalquilo, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, un grupo heterocíclico, un grupo heterocíclico sustituido, o un grupo de fórmula $-N \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^8 \end{matrix}$ en donde R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo o arilo sustituido;

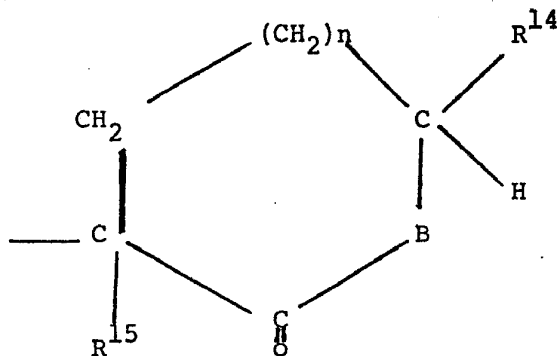
R representa alquilenilo o alquilenilo;

A representa $-COOH$; $-CSSH$; $-CEGR^9$; $-CENR^{10}R^{11}$; $-C(=O)-O-N=C \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^9 \end{matrix}$; $-CN$, o $-COR^{12}$ o un derivado carbonilo o compuesto de adición del mismo; en donde E y G son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de oxígeno o de azufre; R⁹ representa alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo o arilo sustituido; R¹⁰ y R¹¹ son iguales o diferentes y cada una representa un grupo según se ha definido para R⁷; o R¹⁰ y R¹¹.

POOR
QUALITY

-2-

conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están ligadas forman un grupo heterocíclico o un grupo heterocíclico sustituido; o R^{10} representa un átomo de hidrógeno mientras R^{11} representa un grupo de fórmula $-N=C\begin{matrix} R^7 \\ R^9 \end{matrix}$ o $-N\begin{matrix} H \\ R^{13} \end{matrix}$ en donde R^{13} representa un átomo de hidrógeno o $-COOR^9$; y R^{12} representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, cicloalquilo, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo arilo sustituido, un grupo heterocíclico ligado via un átomo de carbono en el grupo o tal grupo heterocíclico sustituido; o R-A representa un grupo de fórmula



en donde R^{14} representa un átomo de hidrógeno, alquilo o arilo; B representa un átomo de oxígeno o $-NR^{15}$, R^{15} representa un átomo de hidrógeno o alquilo, y n representa 0, 1 ó 2; y

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo, alquilo sustituido; hidroxilo; alcoxi; $-SCN$; nitro; halógeno; amino; amino sustituido; mercapto; un grupo de fórmula $-SR^{16}$, $-SOR^{16}$, SO_2R^{16} o $-OSO_2R^{16}$ en donde R^{16} representa alquilo, arilo o aralquilo; $-SO_2NR^7R^8$; o $COOR^{12}$;

con la condición de que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 no representa cada una un átomo de hidrógeno cuando R representa alquileno, R^1 representa fenilo o fenilo sustituido, y A representa $COOH$ o $COOR^9$ en donde R^9 representa alquilo.

-3-

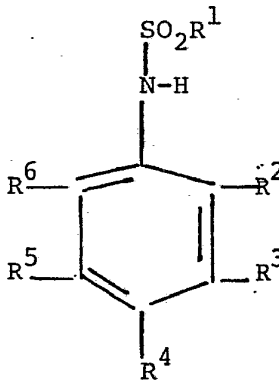
La invención provee también una composición pesticida o reguladora del crecimiento de la planta que incluye el compuesto, especialmente una composición tal, que comprende el compuesto conjuntamente con por lo menos un material seleccionado de portadores, agentes de superficie activos, otros pesticidas otros reguladores del crecimiento de la planta, antídotos y fertilizantes.

Casi todos los compuestos son nuevos, y la invención provee éstos per se.

La invención provee el compuesto según se ha definido antes, excepto que la condición es substituida por la condición de que R^2 , R^3 , R^4 y R^5 no representa cada una un átomo de hidrógeno, cuando R^6 representa un átomo de hidrógeno, metoxicarbonilo o etoxicarbonilometilo, R alquileo, R^1 representa fenilo o fenilo substituido, y A representa benzoilo, COOH o COCR⁹ en donde R^9 representa alquilo.

La invención también provee un proceso para la preparación de compuestos nuevos, proceso que comprende:

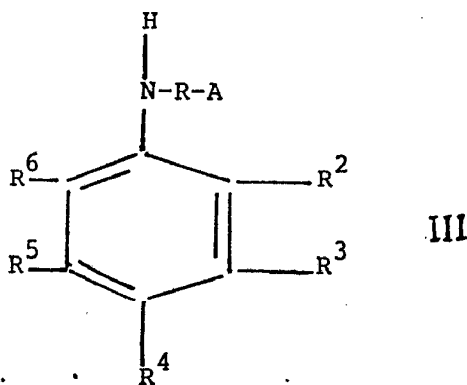
(a) reacción de una sulfonamida de fórmula:



II

o su sal, con un derivado halo de fórmula X-R-A, en donde X representa un átomo de halógeno y A, R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son según se han definido antes en este trabajo;

(b) acilación de un derivado arilamino de fórmula:

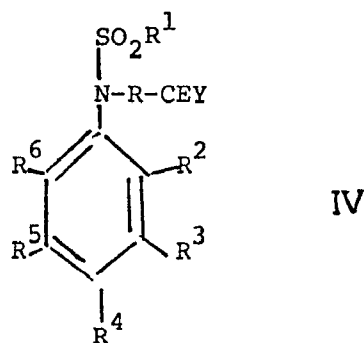


o su sal, con un agente acilante de fórmula R^1SO_2Z o $(R^1SO_2)_2O$, donde Z representa un átomo de halógeno y A , R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se han definido antes;

(c) en donde A representa $-COOH$, hidrolizando una sulfonamida de fórmula I o su sal en la cual A representa $-COOR^9$, $CONR^{10}R^{11}$, $-C(=O)-N=C(R^7)R^9$ o $-CN$ en donde R^7 , R^9 , R^{10} y R^{11} son según se han definido antes;

(d) en donde A representa $-COOR^9$, esterificando una sulfonamida de fórmula I o su sal en la cual A representa $-COOH$, con un alcohol de fórmula R^9OH ;

(e) en donde A representa $-CEGR^9$, reaccionando un acil haluro de fórmula

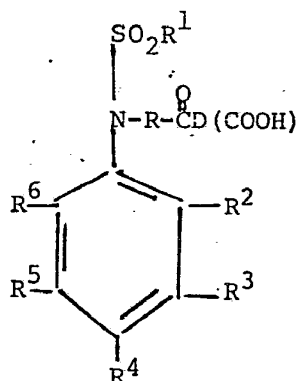


con un alcohol o mercaptano de fórmula R^9GH en donde Y representa un átomo de halógeno y E, G, R, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son según se han definido antes;

(f) en donde A representa $-CONR^{10}R^{11}$, reaccionando el acil haluro de fórmula IV en donde E representa un átomo de oxígeno, con un derivado amino de fórmula $HNR^{10}R^{11}$, en donde R^{10} y R^{11} son según se han definido antes;

(g) en donde A representa $\begin{matrix} O \\ \parallel \\ C-O-N=C \\ \quad \quad \quad \backslash \\ \quad \quad \quad R^7 \\ \quad \quad \quad R^9 \end{matrix}$, reaccionando el acil haluro de fórmula IV en donde E representa un átomo de oxígeno, con un derivado de hidroxilamina de fórmula $HON=C \begin{matrix} R^7 \\ R^9 \end{matrix}$ en donde R^7 y R^9 son según se han definido antes;

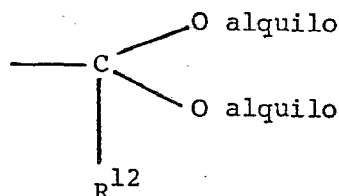
(h) en donde A representa $-COR^{12}$ o un derivado carbonilo o su compuesto de adición, descarboxilando un ácido carboxílico de fórmula



en donde DH_2 representa R^{12} ;

(i) en donde A representa un derivado carbonilo de $-COR^{12}$, reaccionando el compuesto correspondiente en el cual A representa $-COR^{12}$, con un material de fórmula HMH para eliminar una molécula de agua entre ellos;

(j) en donde A representa



reaccionando el compuesto correspondiente en el cual A representa $-\text{COR}^{12}$, con un ortoformato de fórmula $\text{CH}(\text{O alquilo})_3$;

(k) en donde A representa un oximo carbamato de $-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{R}^{12}$, reaccionando la oxima correspondiente con un isocianato, o un cloruro de carbamilo, o con fosgeno y luego una amina;

(l) en donde A representa un compuesto de adición de $-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{R}^{12}$, reaccionando el compuesto correspondiente en el cual A representa $-\text{COR}^{12}$, con el compuesto con el cual es necesario para lograr el compuesto de adición;

(m) producir una sal de la sulfonanilida, salificando la sulfonanilida; o

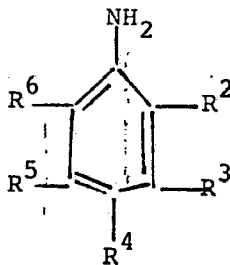
(n) producir la sulfonanilida, desalificando una sal de la sulfonanilida:

Algunos de los intermedios en la producción de los compuestos expuestos son nuevos, y la invención provee éstos per se:

La invención provee:

- 2',6' -dimetil-1-propanosulfonanilida
 - 2',6' -dicloro-metanosulfonanilida,
 - 2'-cloro-6'-metil-metanosulfonanilida,
 - 2',6' -dimetil-1-butanosulfonanilida
 - 2',6' -dimetil-etanosulfonanilida,
 - 2'-etil-metanosulfonanilida,
 - 3',4' -dicloro-2-tiofenosulfonanilida,
 - 3' -cloro-4'-fluoro-metanosulfonanilida,
 - 3' -cloro-4'- metil-metanosulfonanilida,
 - 2' -metanosulfoniloxi-metanosulfonanilida,
 - 2',6' -diisopropil-metanosulfonanilida,
 - 2' -metanosulfoniloxi-5'-nitro-metanosulfonanilida
 - 2',6' -dimetil-dimetilaminosulfonanilida
 - 2' -cloro-6'-metil-dimetilaminosulfonanilida,
 - 2',3'-dicloro-metanosulfonanilida,
 - 3',4'-dimetil-metanosulfonanilida,
 - 2',6'-dimetil-2-propanosulfonanilida,
 - 3',4'-dicloro-etoxicarbonilmetanosulfonanilida,
 - 3',5'-dicloro-metanosulfonanilida,
 - 2',6'-dimetil-4-morfolinosulfonanilida
 - 3',4'-dicloro-4-morfolinosulfonanilida
- o una sal de cualquiera de éstos.

La invención también provee un proceso para la preparación de intermedios nuevos que son sulfonamidas de fórmula II o sus sales, proceso que comprende la acilación de una anilina de fórmula



VI

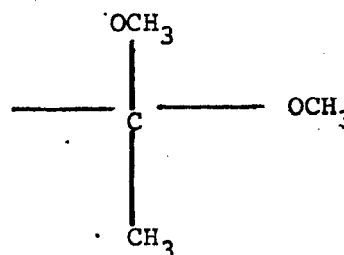
o su sal, con un agente acilante de fórmula R^1SO_2Z o $(R^1SO_2)_2O$.

La sulfonamida de fórmula I puede formar sales. Cuando R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , ó R^6 representan $-COOH$, o A representa $-COOH$ ó $-CSSH$, puede formarse una sal con una base, como hidróxido de sodio. Tales sales incluyen metal, especialmente metal álcali, principalmente sales de sodio o potasio y sales de aminas, éstos es, sales de metilamina o etanolamina. Estas sales pueden formarse partiendo de la forma no salificada (esto es, la forma no salificada puede ser salificada) de la manera convencional para otras sales, y pueden convertirse a la forma no salificada (esto es, desalificada) en la manera convencional para otras sales. Por tanto, puede formarse una sal mediante la reacción de la forma no salificada con una base, éste es, hidróxido de sodio, y una sal con una base puede convertirse a la forma no salificada mediante la reacción con un ácido, esto es, ácido clorhídrico.

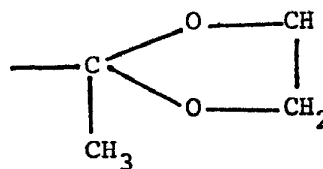
Las sulfonamidas de fórmula II pueden formar sales. Las sales pueden formarse partiendo de la forma no salificada en la manera convencional para otras sales, y pueden convertirse a la forma no salificada en la manera convencional para otras sales. Por tanto, las sales pueden formarse mediante reacción de la forma no salificada con una base fuerte, y pueden convertirse a la forma no salificada mediante la reacción con un ácido, esto es, ácido clorhídrico. Las sales incluyen, por ejemplo, sales de potasio.

Cuando R^{12} en $\overset{O}{\parallel}{C}-R^{12}$ representa un átomo de hidrógeno, las sulfonilidas actuales son aldehídos; cuando R^{12} en $\overset{O}{\parallel}{C}-R^{12}$ representa un átomo que no es hidrógeno, las sulfonilidas actuales son cetonas. En ambos casos, se forman derivados carbonilo. Puede considerarse que los derivados han sido derivados del grupo carbonilo de A mediante reacción con eliminación de una molécula de agua. Los derivados incluyen:

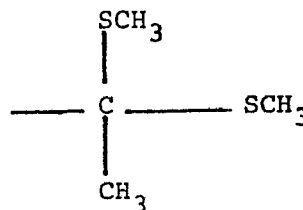
Cetales, en donde A representa por ejemplo



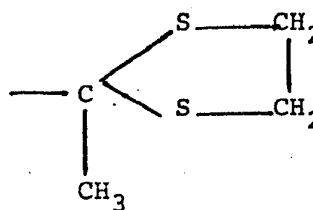
ó



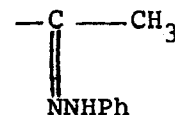
tiocetales, en donde A representa por ejemplo



ó

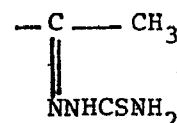


fenilhidrazonas, en donde A representa
por ejemplo



y

semicarbazonas, en donde A representa
por ejemplo,



Los derivados carbonilo son reconocidos por sí mismos.

Los compuestos de adición incluyen aquellos con ión cianuro, ión bisulfito o amonía. Los iones pueden ser, por ejemplo, iones de amonio, sodio o potasio. Los compuestos de adición de aldehídos y cetonas son reconocidos por sí mismos.

Estos compuestos mencionados son preparados preferentemente haciendo reaccionar la sulfonamida de fórmula II o su sal con los derivados halo de fórmula X-R-A. X representa un átomo de halógeno (esto es, flúor, cloro, bromo o yodo), preferiblemente un átomo de cloro o bromo. La reacción se conduce usualmente en presencia de un aceptador de ácido, por ejemplo, carbonato de potasio.

Los compuestos pueden ser preparados por acilación del derivado arilamino de fórmula III o su sal con un agente acilante de fórmula $(R^1SO_2)_2O$ ó preferentemente R^1SO_2Z . Z usualmente representa un átomo de cloro.

Los compuestos en los cuales A representa $-COOH$ pueden prepararse hidrolizando el compuesto en el cual A representa $-COOR^9$, $-CONR^{10}R^{11}$, $-\overset{8}{C}-O-N=C \begin{array}{l} R^7 \\ R^9 \end{array}$ ó $-CN$. La hidrólisis es usualmente conducida en presencia de ácido (por ejemplo, ácido sulfúrico) o base (por ejemplo, hidróxido de sodio).

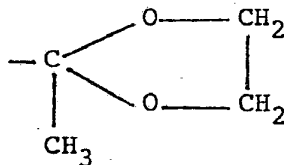
Los compuestos en los cuales A representa $-COOR^9$ pueden prepararse esterificando el compuesto en el cual A representa $-COOH$. La esterificación es usualmente conducida en presencia de ácido (por ejemplo, ácido sulfúrico).

Los compuestos en los cuales A representa $-CEGR^9$ pueden prepararse acilando el alcohol o mercaptano de fórmula R^9GH con el acil haluro de fórmula IV. Y en la fórmula IV representa un halógeno, usualmente un átomo de cloro.

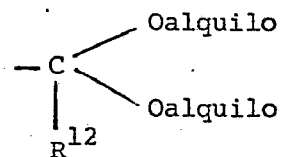
Los compuestos en los cuales A representa $-CONR^{10}R^{11}$ pueden prepararse acilando el derivado amino de fórmula $HNR^{10}R^{11}$ con el acil haluro de fórmula IV en donde E representa un átomo de oxígeno. Otra vez, Y representa usualmente un átomo de cloro.

Los compuestos en los cuales A representa $-COR^{12}$ pueden prepararse descarboxilando un ácido carboxílico de fórmula V. La descarboxilación puede obtenerse mediante calentamiento, por ejemplo. El ácido carboxílico se prepara preferentemente in situ por ejemplo mediante hidrólisis de su éster, su etil éster.

Los compuestos en los cuales A representa un derivado carbonilo de $-COR^{12}$ pueden prepararse haciendo reaccionar el compuesto correspondiente en el cual A representa $-COR^{12}$, con un material de fórmula HMH para eliminar una molécula de agua entre ellos. Por ejemplo, un compuesto en el cual A representa $-COCH_3$ puede hacerse reaccionar con etilena glicol en presencia de ácido para formar el compuesto correspondiente en el cual A representa



El compuesto en el cual A representa



puede prepararse haciendo reaccionar el compuesto correspondiente en el cual A representa $-COR^{12}$, con un ortoformato de fórmula

$\text{CH}(\text{Oalquilo})_3$ usualmente en presencia de, por ejemplo, un ácido tal como ácido 4-toluenosulfónico o ácido clorhídrico, o cloruro de amonio o cloruro férrico.

La sulfonamida de fórmula II o su sal puede prepararse acilando una anilina de fórmula VI o su sal con el agente acilante de fórmula $(\text{R}^1\text{SO}_2)_2\text{O}$ ó preferentemente $\text{R}^1\text{SO}_2\text{Z}$. Otra vez, Z representa usualmente un átomo de cloro.

El acil haluro de fórmula IV puede prepararse haciendo reaccionar una sulfonanilida de fórmula I en la cual A representa $-\text{COOH}$ o $-\text{CSSH}$ o su sal, con tionil haluro, fosforil haluro, pentahaluro de fósforo o oxalil haluro, especialmente los cloruros y principalmente tionil cloruro.

Estos procesos expuestos son conducidos usualmente en presencia de un disolvente y usualmente se llevan a efecto a $0 - 200$, esto es, $0 - 150^\circ\text{C}$. El disolvente puede ser por ejemplo agua o un éter, cetona, hidrocarburo, amida o alcohol. La presión debe de ser por ejemplo $0,5$ a 10 atmósferas, convenientemente presión ambiental.

Cualquier grupo alquilo substituido en los compuestos tratados tiene como substituyente (s) preferentemente uno o más de halógeno, alcoxi, furilo, phtalimido, $-\text{SCN}$, amino substituido (ésto es, amino mono- o di-substituido por alquilo o acilo), alcoxicarbonilo, Carboxi, $-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, benzoiloxi, alcanoiloxi, alquilsulfoniloxi, nitrilo e hidroxil. En el caso de R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , y R^6 , el tal grupo alquilo substituido por preferencia es $-\text{CF}_3$.

Cualquier grupo acilo es preferentemente alcanoil.

Cualquier grupo arilo substituido es preferentemente arilo substituido por uno o más de halógeno, alquilo alcoxi, alquilsulfoniloxi, nitro $-\text{SCN}$ y trifluorometilo.

Cualquier grupo aralquilo substituido es preferentemente substituido en el núcleo arilo. El substituyente (s) es preferentemente seleccionado de halógeno, alquilo, alcoxi, nitro, -SCN, alquilsulfoniloxi y trifluoremetilo.

Cuando cualquiera de los símbolos mencionados representa un grupo substituido o insubstituido, éste es preferentemente insubstituido. Cuando éste está substituido por más de un substituyente, los substituyentes son usualmente iguales, esto es, todos cloro o todos metilo.

Cualquier grupo alquilo involucrado en los símbolos mencionados es preferentemente de 1-15, esto es, 1-8, especialmente 1-6 átomos de carbono, por ejemplo metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo o hexilo. Cualquier grupo cicloalquilo es preferentemente de 3-7 átomos de carbono, especialmente ciclohexilo o ciclopentilo. Cualquier grupo arilo es preferentemente fenilo. Cualquier grupo aralquilo es preferentemente fenilalquilo, esto es, de 7-10 átomos de carbono, especialmente bencilo. Cualquier halógeno es preferentemente flúor, cloro o bromo, especialmente cloro. Cualquier alcoxi es preferentemente de 1-6 átomos de carbono, esto es, metoxi. Cualquier grupo alcanilo es preferentemente de 2-7 átomos de carbono. El grupo alquilenol o alquilenoleno que R representa puede ser de cadena recta o ramificada. Usualmente contiene 1-6, preferentemente 1-3, átomos de carbono. Especialmente de preferencia es R representando metileno cuando A representa $-\text{COR}^{12}$ o un derivado carbonilo o su compuesto de adición; cuando A representa otros valores, es especialmente de preferencia el que R represente $-\overset{\text{R}^{18}}{\text{C}}\text{H}$ donde R^{18} representa alquilo de 1-5, preferentemente 1-2 átomos de carbono.

El grupo heterocíclico o heterocíclico substituido que R^1 puede representar puede estar ligado vía un átomo de carbono o hetero en anillo. Cualquier grupo heterocíclico involucrado en los símbolos mencionados es usualmente un anillo hetero sencillo que contiene de 3 a 7 átomos en anillo de los cuales 1-3, esto es, 1 ó 2, son átomos hetero, siendo cada átomo

hetero, nitrógeno, azufre u oxígeno y al susodicho anillo hetero puede estar fundido opcionalmente un anillo de benceno. El grupo heterocíclico puede ser, por ejemplo, furilo, tienilo, piperidilo, pirrolilo, piperacinilo, morfolinilo o benzofuranilo. Cualquier substituyente en un grupo heterocíclico puede ser, por ejemplo, alquilo, esto es, metilo, oxo, nitro o halógeno, por ejemplo, cloro.

Preferentemente el grupo heterocíclico que $-NR^{10}R^{11}$ puede sentar es un anillo hetero sencillo que contiene 5-7, esto es, 5 ó 6 átomos en anillo de los cuales además del átomo de nitrógeno puede haber 1 ó 2 átomos hetero adicionales, siendo cada átomo hetero, oxígeno azufre o nitrógeno y al susodicho anillo hetero puede estar fundido opcionalmente un anillo de benceno. El grupo heterocíclico es preferentemente piperacino, pirrolidino, piperidino o morfolino. Cualquier substituyente puede ser, por ejemplo, alquilo, esto es, metilo, oxo, nitro o halógeno, por ejemplo, cloro.

Por consiguiente, en una formación de preferencia,

R^1 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos substituidos por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 2-7 átomos de carbono, carboxi, $-C(=O)NR^{10}R^{11}$, ftalimido, -SCN, benzoiloxi, alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, furilo, nitrilo, hidroxí, amino y amino mono o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanoil de 2-7 átomos de carbono; cicloalquilo de 3-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono substituido en el núcleo fenilo por uno más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, nitro - SCN, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono y trifluormetilo; fenilo; fenilo substituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro -SCN y trifluoremetilo; un grupo heterocíclico que es un anillo hetero sencillo que contiene de 3 a 7 átomos en anillo de los cuales 1-3 son átomos

hetero, siendo cada átomo hetero, nitrógeno, azufre u oxígeno y al susodicho anillo hetero puede estar fundido opcionalmente un anillo de benceno; un grupo heterocíclico substituido por uno más de alquilo de 1-6 átomos de carbono oxo, nitro y halógeno; o un grupo de fórmula $-N \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^8 \end{matrix}$ en donde R^7 y R^8 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo de 1-15 átomos de carbono substituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, carboxi, $\begin{matrix} O \\ \diagdown \\ CNR^{10}R^{11} \end{matrix}$, phtalimido, -SCN, berzoiloxi, alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, furilo, nitrilo, hidroxí, amino y amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanoil de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro -SCN, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono y trifluorometilo; fenilo; o fenilo substituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro, -SCN y trifluoremetilo;

R representa alquileno o alquenileno de 1-6 átomos de carbono;

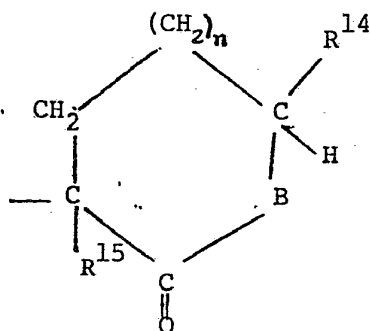
R representa $-COOH$; $-CSSH$; $-CEGR^9$; $CENR^{10}R^{11}$; $-CO-N=C \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^9 \end{matrix}$; $-CN$; o $-COR^{12}$ o un derivado carbonilo o su compuesto de adición; en donde E y G son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de oxígeno o azufre, R^9 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono substituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 2-7 átomos de carbono, carboxi $\begin{matrix} O \\ \diagdown \\ CNR^{10}R^{11} \end{matrix}$, phtalimido, -SCN, benzoiloxi, alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, furilo, nitrilo, hidroxí, amino y amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono substituido en el grupo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro, -SCN, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, y trifluorometilo; fenilo; o fenilo

substituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro, -SCN y trifluorometilo; R^{10} y R^{11} son iguales o diferentes y cada una representa un grupo según se ha definido hace un momento para R^7 ; o R^{10} y R^{11} conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están ligadas, forman un grupo heterocíclico que es un anillo hetero sencillo que contiene 5-7 átomos en anillo de los cuales además del átomo de nitrógeno puede haber 1-2 átomos hetero adicionales, siendo cada átomo hetero, oxígeno, azufre o nitrógeno y el susodicho anillo hetero puede estar fundido opcionalmente un anillo de benceno; o tal grupo heterocíclico substituido por uno o más de alquilo de 1-6 átomos de carbono, oxo, nitro halógeno; o R^{10} representa un átomo de hidrogeno mientras R^{11} representa un grupo de fórmula $-N=C \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^9 \end{matrix} \begin{matrix} R^8 \\ \diagup \\ R^{13} \end{matrix}$ en donde R^{13} representa un átomo de hidrógeno o $-COOR^9$, y R^{12} representa un átomo de hidrógeno, alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono substituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 2-7 átomos de carbono, carboxi, $CNR^{10}R^{11}$, ftalimido, SCN, benzoiloxi, alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, furilo, nitrilo, hidroxilo, amino y amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono; cicloalquilo de 3-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono substituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono- alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro, -SCN, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono y trifluorometilo; fenilo; fenilo substituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro, -SCN y trifluorometilo; un grupo heterocíclico ligado vía un átomo de carbono en el grupo, grupo que es un anillo hetero sencillo que contiene de 3 a 7 átomos en anillo de los cuales 1-3 son átomos hetero, siendo cada

**POOR
QUALITY**

átomo hetero, nitrógeno, azufre u oxígeno, y al susodicho anillo hetero puede estar fundido opcionalmente un anillo de benceno; o al grupo heterocíclico substituido por uno o más de alquilo de 1-6 átomos de carbono, oxo, nitro y halógeno; o

R-A representa un grupo de fórmula



en donde R^{14} representa un átomo de hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono o fenilo, B representa un átomo de oxígeno o $-NR^{15}$, R^{15} representa un átomo de hidrógeno o alquilo de 1-6 átomos de carbono, n representa 0, 1 ó 2;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , y R^6 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono substituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 2-7 átomos de carbono, carboxi, $-C(=O)NR^8R^{10}R^{11}$, phtalimido, $-SCN$, banzoiloxi, alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, furilo; nitrilo, hidroxilo, amino y amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono; hidroxilo; alcoxi de 1-6 átomos de carbono; $-SCN$; nitro; mercapto; un átomo de halógeno; amino, amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanoiloxi de 2-7 átomos de carbono, un grupo de fórmula $-SR^{16}$,

$-\text{SOR}^{16}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{16}$ ó $-\text{OSO}_2\text{R}^{16}$ en donde R^{16} representa alquilo de 1-6 átomos de carbono, fenilo o fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ en donde R^7 y R^8 son según se han definido antes; ó $-\text{COOR}^{12}$ en donde R^{12} es según se ha definido antes,

con la condición de que $\text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5$ y R^6 no representa cada una un átomo de hidrógeno cuando R representa alquilenó de 1-6 átomos de carbono, R^1 representa fenilo o fenilo sustituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro, $-\text{SCN}$ y trifluorometilo, y A representa COOH o COOR^9 en donde R^9 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono. En esta estructuración, hay dos situaciones de preferencia. En una situación, R^1 representa algo diferente de fenilo o de fenilo sustituido. En la otra situación, 3 ó 4 de $\text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5$ y R^6 cada una representa un átomo de hidrógeno.

En una estructuración especial de los compuestos en cuestión, R^1 representa alquilo, alquilo sustituido, cicloalquilo, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, o un grupo de fórmula $-\text{N} \begin{matrix} \text{R}^7 \\ \text{R}^8 \end{matrix}$ en donde R^7 y R^8 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo o arilo sustituido;

R representa alquilenó;

A representa $-\text{COOH}$, $-\text{CSSH}$, CEGR^9 , $-\text{CENR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{O}-\text{N}=\overset{\text{R}^7}{\text{C}} \overset{\text{R}^9}{\text{R}^9}$ ó $-\text{CN}$; en donde E y G son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de oxígeno o azufre; R^9 representa alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo o arilo sustituido; R^{10} y R^{11} son iguales o diferentes y cada una representa un grupo según se ha definido para R^7 ; o R^{10} y R^{11} conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están ligadas, forman un grupo heterocíclico; o R^{10} representa un átomo de hidrógeno mientras R^{11} representa un grupo de fórmula $-\text{N}=\overset{\text{R}^7}{\text{C}} \overset{\text{R}^9}{\text{R}^9}$ ó $-\text{N} \overset{\text{H}}{\text{R}^{13}}$ en donde R^{13} representa un átomo de hidrógeno ó $-\text{COOR}^9$ (en donde R^9 representa etilo especialmente); y

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, alcoxi, -SCN, nitro, mercapto, alquilmercapto, amino o un átomo de halógeno;

con la condición de que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , y R^6 no representa un átomo de hidrógeno, mientras ambas R^1 representan fenilo o fenilo sustituido y A represent $-\text{COOH}$ o COOR^9 en donde R^9 representa alquilo. Preferentemente, en esta estructuración,

R^1 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono, alquilo de 1-15 átomos de carbono sustituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono- o di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbon; cicloalquilo de 3-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono sustituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo; fenilo; o fenilo sustituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorimetilo; o un grupo de fórmula $-\text{N} \begin{matrix} \text{R}^7 \\ \text{R}^8 \end{matrix}$ en donde R^7 y R^8 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono sustituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono- o di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono sustituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo;

R representa alquileno de 1-6 átomos de carbono;

A representa $-\text{COOH}$, $-\text{CSSH}$, $-\text{CEGR}^9$, $\text{CENR}^{10,11}$, $-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{O}-\text{N}=\overset{\text{R}^7}{\text{C}} \begin{matrix} \text{R}^9 \\ \text{R}^9 \end{matrix}$ ó $-\text{CN}$; en donde E y G son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de oxígeno o azufre; R^9 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono

substituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono substituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo; fenilo; o fenilo substituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo; R^{10} y R^{11} son iguales o diferentes y cada una representa un grupo según se ha definido para R^7 hace un momento; o R^{10} y R^{11} conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están ligadas, forman un grupo monocíclico heterocíclico que contiene 5 ó 6 átomos en anillo de los cuales además del átomo hetero, oxígeno o nitrógeno; o R^{10} representa un átomo de hidrógeno mientras R^{11} representa un grupo de fórmula $-N=C \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^9 \end{matrix}$ ó $-N \begin{matrix} H \\ \diagdown \\ R^{13} \end{matrix}$ en donde R^{13} representa un átomo de hidrógeno o $-COOR^9$; y

R^2 , R^3 , R^5 y R^6 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono substituido por uno o más de halógeno alcoxi de 1-6 de carbono, amino y amino mono- o di-substituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; alcoxi de 1-6 átomos de carbono; $-SCN$; nitro; mercapto; alquilmercapto de 1-6 átomos de carbono; amino o un átomo de halógeno;

Con la condición de que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 no representa cada una un átomo de hidrógeno mientras ambas R^1 representan fenilo o fenilo substituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo, y A representa $-COOH$ o $COOR^9$ en donde R^9 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono.

En otra estructuración especial,

R^1 representa alquilo, alquilo substituido, cicloalquilo, aralquilo, aralquilo substituido, arilo, arilo substituido, un grupo heterocíclico, un grupo heterocíclico substituido, o un grupo de fórmula $-N \begin{matrix} R^7 \\ \diagdown \\ R^8 \end{matrix}$ en donde R^7 y R^8 son iguales o diferentes

y cada una representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo o arilo sustituido;

R representa alquilenilo o alquilenilo

A representa $-\text{COR}^{12}$ o un derivado carbonilo o su compuesto de adición, en donde R^{12} representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, cicloalquilo, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, un grupo heterocíclico ligado vía un átomo de carbono en el grupo o tal grupo heterocíclico sustituido; y

$\text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5$ y R^6 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo; alquilo sustituido; alcoxi; $-\text{SCN}$ nitro; halógeno; amino; amino sustituido; mercapto; un grupo de fórmula $-\text{SR}^{16}$ SOR^{16} o $-\text{SO}_2\text{R}^{16}$ en donde R^{16} representa alquilo, arilo o aralquilo; $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ en donde R^7 y R^8 son según se han definido hace un momento; ó $-\text{COOR}^{12}$ en donde R^{12} es según se ha definido hace un momento.

En esta estructuración, preferentemente,

R^1 representa alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono sustituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono- o di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; cicloalquilo de 3-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono sustituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluormetilo; fenilo; fenilo sustituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluormetilo; un grupo heterocíclico que es un anillo hetero sencillo que contiene de 3-7 átomos en anillo de los cuales 1 ó 2 son átomos hetero, siendo cada átomo hetero, nitrógeno, azufre u oxígeno y al susodicho anillo hetero puede estar opcionalmente fundido un anillo de benceno; tal grupo heterocíclico sustituido por uno o más de alquilo de 1-6 átomos de carbono, nitro y halógeno; o un grupo de fórmula $-\text{N} \begin{matrix} \text{R}^7 \\ \text{R}^8 \end{matrix}$ en donde R^7 y R^8 son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo de 1-15 átomos de

carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono sustituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono- di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono sustituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo; fenilo; o fenilo sustituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsufoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo;

R representa alquilenos o alquilenos de 1-6 átomos de carbono;

A representa $-COR^{12}$ o un derivado carbonilo o su compuesto de adición, en donde R^{12} representa un átomo de hidrógeno, alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono sustituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono-di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; cicloalquilo de 3-7 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono sustituido en el núcleo fenilo por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo; fenilo; fenilo sustituido por uno o más de halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquilsufoniloxi de 1-6 átomos de carbono, nitro y trifluorometilo; un grupo heterocíclico ligado vía un átomo de carbono en el grupo, grupo que es un anillo hetero sencillo que contiene de 3 a 7 átomos en anillo de los cuales 1 ó 2 son átomos hetero, siendo cada átomo hetero, nitrógeno, azufre u oxígeno, y al susodicho anillo hetero puede estar fundido opcionalmente un anillo de benceno; o tal grupo heterocíclico sustituido por uno o más de alquilo de 1-7 átomos de carbono, nitro y halógeno; y

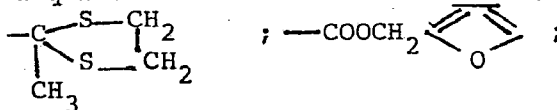
R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , y R^6 , son iguales o diferentes y cada una representa un átomo de hidrógeno; alquilo de 1-15 átomos de carbono; alquilo de 1-15 átomos de carbono sustituido por uno o más de halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, amino y amino mono- o di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; alcoxi de 1-6 átomos de carbono; -SCN; nitró; mercapto; un átomo de halógeno; amino; amino mono- o di-sustituido por grupos seleccionados de alquilo de 1-15 átomos de carbono y alcanilo de 2-7 átomos de carbono; un grupo de fórmula $-SR^{16}$, $-SOR^{16}$ ó $-SO_2R^{16}$ en donde R^{16} representa alquilo de 1-6 átomos de carbono, fenilo o fenilalquilo de 7-10 átomos de carbono; ó $-COOR^{12}$ en donde R^{12} es según se ha definido hace un momento.

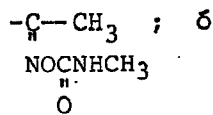
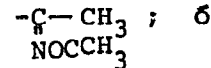
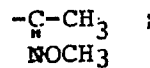
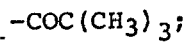
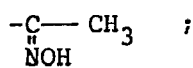
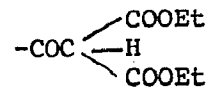
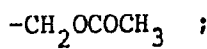
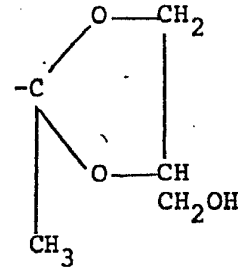
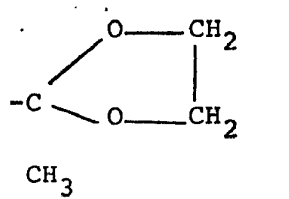
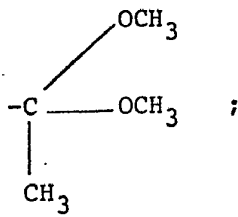
Los compuestos de preferencia en particular son aquellos en donde,

R^1 representa alquilo de 1-4 átomos de carbono, 2-phtalimidoetiló, etoxicarbonilmetilo, nitrofenilo, tienilo o dialquilamino de 2-8 átomos de carbono;

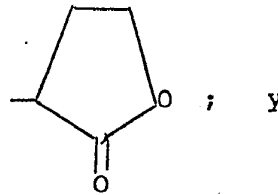
R representa alquilenó de 1-3 átomos de carbono o alquenileno de 3 átomos de carbono;

A representa $-COOH$; $-CENH_2$; $-CN$; $-CONHPh$; cicloalquil-oxicarbonilo de 4-8 átomos de carbono; morfolinocarbonilo; $-CONHNH_2$; $-CONHCH_2COO$ alquilo de 1-4 átomos de carbono; $-CONHNHCOO$ alquilo de 1-4 átomos de carbono; $-N(CH_3)_2$; $-COOR^{17}$ ó $-CON(R^{17})_2$ en donde R^{17} representa alquilo de 1-5 átomos de carbono; $-COCH_3$; $-COCH_2OH$;





R-A representa

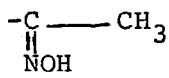
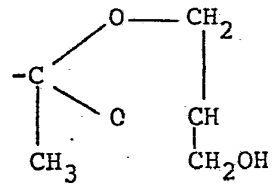
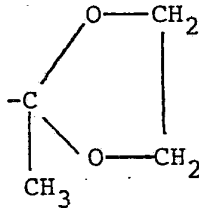
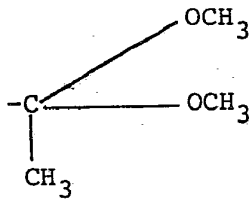
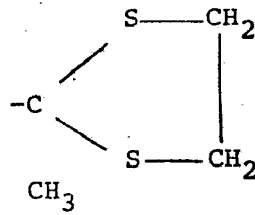


3 ó 4 de R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ cada una representa un átomo de hidrógeno y las restantes son iguales o diferentes y cada una representa alquilo de 1-3 átomos de carbono, halógeno, hidróxi, fenilmercapto, -SCN, nitro, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, trifluormetilo, fenilsulfonilo, o metilsufoniloxi.

En un grupo de preferencia en particular, 3 ó 4 de R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ cada una representa un átomo de hidrógeno. Cuando A representa -COR¹² o un derivado carbonilo o su compuesto de adición, es de preferencia en particular el que R³, R⁴, R⁵ ó R², R³, R⁵ y R⁶ cada una representa un átomo de hidrógeno.

En un grupo de preferencia en particular, R¹ representa alquilo de 1-4 átomos de carbono o tienilo, R representa metileno,

A representa $-\text{COCH}_3$



δ $-\text{COC}(\text{CH}_3)_3$, γ

3 ó 4 de R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ cada una representa un átomo

de hidrógeno y las restantes son iguales o diferentes y cada una representa alquilo de 1-3 átomos de carbono, halógeno o alcoxi de 1-6 átomos de carbono.

En otro grupo de preferencia en particular, R^1 representa alquilo de 1-4 átomos de carbono;

R representa $\overset{R^{18}}{\text{CH}}$ - en donde R^{18} representa metilo o etilo;

A representa $-\text{COOH}$, $-\text{COOR}^{17}$, $-\text{CENH}_2$, $-\text{CON}(\text{R}^{17})_2$, $-\text{CF}_3$ ó $-\text{CONHPh}$ en donde R^{17} representa alquilo de 1-8 átomos de carbono; y

3 ó 4 de R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 cada una representa un átomo de hidrógeno y las restantes son iguales o diferentes y cada una representa alquilo de 1-3 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono o trifluorometilo. Compuestos específicos están detallados en los Ejemplos. Compuestos específicos de preferencia, especialmente como herbicidas son.

N- cianometil- 3',4'- dicloro-metanosulfonanilida;

N-(1-(etoxicarbonil)etil)-2', 6'- dimetil-1-propanosulfonanilida; y

N-(1-(etoxicarbonil)etil)-2',6'- dimetil etanosulfonanilida.

Otro compuesto específico de preferencia, especialmente como fungicida, por ejemplo, para uso en parras o patatas, es

N-(1-(metoxicarbonil)etil)- 2', 6' -dimetil-metanosulfonilililida.

Otro compuesto específico de preferencia, especialmente como fungicida, es N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida.

Los compuestos en cuestión son pesticidas y reguladores del crecimiento de la planta. Los compuestos, especialmente aquéllos en donde A representa $-\text{COOH}$, $-\text{CSSH}$, CEGR^9 , $-\text{CENR}^{10}$, R^{11} , $-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{O}-\text{N}-\text{C} \begin{matrix} \swarrow \text{R}^7 \\ \searrow \text{R}^9 \end{matrix}$ ó $-\text{CN}$, son particularmente activos en la fisiología de la planta, afectando el crecimiento de las plantas de forma que los compuestos pueden ser utilizados como herbicidas o reguladores del crecimiento de la planta.

Estos compuestos en cuestión, especialmente aquéllos en donde A representa $-COR^{12}$ o un derivado carbonilo o su compuesto de adición, son particularmente útiles como fungicidas también. Estos compuestos, especialmente en donde A representa un oximo carbamato, son también particularmente útiles como insecticidas. Los compuestos en cuestión son agentes anti-bacterianos también. Estos compuestos son excepcionalmente útiles para combatir los hongos o hierbas nocivas en los cultivos

Los compuestos pueden ser utilizados para combatir por ejemplo pamplina (Stellaria media), quenopodio (Chenopodium album), (Avena fatua), (Alopecurus myosuroides), (Echinochloa crus-galli), o (Digitaria sanguinalis).

Los compuestos pueden ser utilizados para combatir hierbas bajas en, por ejemplo, cultivos, tales como patatas, parras, zanahorias; o cereales como arroz, trigo, cebada o maiz, cultivos de plantas ornamentales, o de plantaciones tales como el algodón.

Para su uso como fungicidas, los compuestos son preferentemente empleados para combatir enfermedades por hongos en las plantas, especialmente de alguna de las cosechas mencionadas.

Los compuestos pueden ser utilizados para combatir varios géneros de hongos, por ejemplo, Pythium, Phytophthora, Plasmopora, o Pyricularia.

Estos compuestos son empleados normalmente en forma de composiciones que pueden prepararse mezclando los ingredientes. Usualmente las composiciones son producidas en forma de concentrados que contienen, por ejemplo, 0,5-85% del compuesto actual, y éstas son diluídas con agua o hidrocarburo, usualmente agua, para su aplicación generalmente de forma tal que la concentración del compuesto es 0,05-5%, aunque en una aplicación de volumen ultra bajo la concentración puede ser más alta, por ejemplo, hasta 20%. Los porcentajes y partes en esta especificación son por peso, a menos que se indique de otra manera.

Las composiciones contienen normalmente un agente de superficie activo y/o un portador.

El portador puede ser un líquido, por ejemplo, agua (por ejemplo, agua utilizada para diluir un concentrado para aplicación). Si en un concentrado se emplea agua como portador, también un disolvente orgánico puede estar presente como portador, aunque éste usualmente no es utilizado. Puede ser ventajoso el que haya presente un agente de superficie activo.

El portador puede ser un líquido diferente de agua, por ejemplo, un disolvente orgánico tal como un disolvente inmisible con agua, por ejemplo un hidrocarburo que hierva en el margen de 130-270°C, en el cual el compuesto se disuelve o queda suspendido. Un concentrado que contiene un disolvente inmisible con agua convenientemente también debe contener un agente de superficie activo de forma que el concentrado actúe como un aceite auto emulsionable en mezcla con agua. El líquido puede ser un disolvente miscible con agua, por ejemplo, 2-metoxietanol, metanol, propileno glicol, dietileno glicol, dietileno glicol monoetil éter, formamida o metilformamida.

El portador puede ser un sólido que puede dispersarse finamente. Ejemplo de sólidos apropiados son caliza, arcilla, arena, mica, tiza, atapulgita, diatomita, perlita, sepiolita, sílice, silicatos, lignosulfonatos, turba y fertilizantes sólidos. El portador puede ser de origen natural o sintético o puede ser un material natural modificado.

Se pueden formar polvos humedecibles solubles o dispersables en agua mezclando el compuesto en forma pulverizada con un portador pulverizado o rociando el compuesto fundido sobre el portador pulverizado, mezclando un agente humectante y un agente dispersante y triturando finamente toda la mezcla de polvo.

Se puede formar una composición aerosol mezclando el compuesto con un propulsor, por ejemplo, alcano polihalógeno como diclorodifluorometano, y ventajosamente con un disolvente también.

Se puede formar una suspensión de concentrado fluente si el compuesto tiene una solubilidad en agua, baja, triturando el compuesto con agua, un agente humectante y un agente suspensor.

Se puede formar una suspensión de concentrado fluente en donde el portador es un hidrocarburo con punto de ebullición en el margen de 130-270°C en vez de agua.

Por consiguiente, la composición en cuestión puede ser, por ejemplo, sólida (por ejemplo, polvo o gránulos) y contener un portador sólido, o líquida (esto es, un concentrado emulsionable) y contener un portador líquido que es un hidrocarburo con punto de ebullición en el margen de 130-270°C.

El término "agente de superficie activo" se utiliza en un sentido amplio para incluir materiales llamados indistintamente agentes emulsificantes, agentes dispersantes y agentes humectantes. Tales agentes son bien conocidos en el oficio.

Los agentes de superficie activos utilizados pueden comprender agentes de superficie activos aniónicos, por ejemplo, jabones, mono- o di-ésteres de ácido fosfórico con etoxilatos de alcohol graso o las sales de dichos ésteres, sulfatos de alcohol graso tales como dodecil sulfato sódico, octadecil sulfato sódico o cetil sulfato sódico, sulfatos de alcohol graso etoxilado, sulfatos de alquilfenol etoxilado, sulfonatos de lignina, sulfonatos de petróleo, alquil-aril sulfonatos tales como alquilbenceno sulfonatos o sulfonatos de alquilnaftaleno menores, por ejemplo, butil-naftaleno sulfonato, sales de condensados naftalenoformaldehído sulfonatados, sales de condensados fenol-formaldehído sulfonatados, o sulfonatos más complejos tales como amido sulfonatos, por ejemplo, el producto de condensación sulfonatado de ácido oléico y N-metil taurino o los dialquil sulfosuccinatos, por ejemplo, el sulfonato sódico de dioctil succinato.

Los agentes de superficie activos también pueden comprender agentes no iónicos, por ejemplo, productos de condensación de

ésteres de ácidos grasos, alcoholes grasos, amidas de ácidos grasos o fenoles graso-, alquil-o alquenil- substituídos con óxido de etileno o, ésteres grasos de éteres de alcohol polihídrico, por ejemplo, ésteres de ácido graso de sorbitan, productos de condensación de tales ésteres con óxido de etileno por ejemplo, ésteres de ácidos grasos polioxiotilen sorbitan, copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de propileno, glicoles acetilénicos tales como 2,4,7,9,- tetrametil-5-decín-4,7,-diol, o glicoles acetilénicos etoxilatados.

Los agentes de superficie activos también pueden comprender agentes catiónicos, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario alquil- y/o aril-substituídos tales como cetil trimetilamónio bromuro o aminas grasas terciarias etoxilatadas,

Los agentes de superficie activos de preferencia incluyen sulfatos de alcohol graso etoxilatado, sulfonatos de lignina, alquil-aril sulfonatos, sales de condensados naftaleno-formaldehído sulfonatos, sales de condensados fenol-formaldehído sulfonatos, dialquil- sulfosuccinatos, aquil fenol etoxilatos, y alquil graso etoxilatos.

Los agentes de superficie no iónicos son de preferencia.

El compuesto activo actual puede ser mezclado con otro pesticida, esto es, herbicida, fungicida, isecticida o agente anti bacteriano, o con otro regulador del crecimiento de la planta. La invención prevé una presentación de un paquete en el cual el compuesto actual ya está mezclado con otro pesticida o regulador del crecimiento de la planta, y también un paquete sencillo diseñado para contener el compuesto actual y otro pesticida o regulador del crecimiento de la planta en envases separados para mezclarlos, por ejemplo, en un depósito de pulverización, para su aplicación. Se obtienen ventajas especiales con mezclas con otro herbicida o fungicida. El compuesto actual puede usarse sucesivamente con otro pesticida o regulador del crecimiento de la planta, especialmente con otro herbicida o fungicida, por ejemplo, se puede aplicar un herbicida antes de sembrar o antes de la salida de la cosecha

y otro herbicida después de la salida de la cosecha.

El otro herbicida puede ser, por ejemplo, uno o más de entre ácido fenoxialifático, urea substituída, triacina, fenol, nitrilo, compuesto de bupiridilio, ácido benzoico substituído, ácido alifático halogenado, carbamato, tiocarbamato, cloroacetamida, diacina o herbicida arsénico. Respecto a composiciones herbicidas selectivas para uso post-salida, el compuesto en cuestión puede ser utilizado en mezcla con, por ejemplo, ácido fenoxialifático substituído; respecto a composiciones herbicidas selectivas para uso presalida, el compuesto en cuestión puede ser utilizado en mezcla con, por ejemplo, una urea substituída o tiracina; respecto al uso herbicida selectivo en sucesión, se puede aplicar, por ejemplo, antes de la salida de la cosecha S-2,3-dicloroalil di-isopropiltiocarbamato o S-2,3,3-tricloroalil di-isopropiltiocarbamato y el compuesto actual después de la salida de la cosecha.

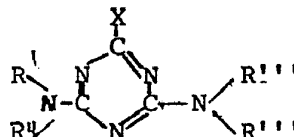
El ácido fenoxialifático comprende generalmente ácidos fenoxialifáticos alquil y/o halógeno substituídos, y sus sales por ejemplo, metal alcali, sales de aminas y alcanolaminas, y derivados funcionales, por ejemplo, ésteres y amidas. Estos compuestos pueden ser de tal actividad como para ser reconocidos como herbicidas comerciales, o pueden ser de actividad herbicida leve solamente.

Ejemplo de ácidos fenoxialifáticos substituídos que pueden mencionarse incluyen ácido 2,4- diclorofenoxiacético, ácido 2-(2,4- diclorofenoxi) propiónico, ácido 2-metil-4- clorofenoxiacético, ácido 2,4,5- triclorofenoxiacético, ácido gamma-2,4-diclorofenoxibutírico, ácido gamma-2-metil-4- fenoxibutírico, ácido alfa-2-metil-4-clorofenoxipropiónico, ácido 2-(4-(2,4-diclorofenoxi) fenoxi) propiónico y ácido 2-(4-(4-clorofenoxi) fenoxi) propiónico.

La urea substituída generalmente comprende una tri o tetra- substituída tal como N^o-(3-cloro-4-metoxifenil)-N,N-dimetilurea, N^o-(3-cloro.4.metilfenil)-N,N-dimetilurea, N^o-paraclorofenil-N,N-dimetilurea, N-butyl-N^o-(3.4-diclorofenil)-N-metilurea, N^o-

paraclorofenil-o,N,N-trimetilisourea, N'-p'-clorofenil-N-metoxi-N-metilurea, N,N-dimetil-N'-fenilurea, 3-(4-bromofenil)-1-metoxi-1-metilurea, 1-(2-benzotiazolil)-3-metilurea, N,N-dimetil-N'-(4-(1-metiletil)fenil) urea, N'-(3,4-diclorofenil)-N-metoxi-N-metilurea o N,N-dimetil-N'-(3-trifluorometil)fenil) urea.

El herbicida triacina generalmente comprende 2-cloro-4-(1-ciano-1-metilamino)-6-etilamino-1,3,5-triacina o 2-isopropil-amino-4-(3-metoxipropilamino)-6-metiltio-1,3,5-triacina o un compuesto de fórmula



en donde X es un átomo de halógeno, alcoxi o alquiltio, R' y R'' son iguales o diferentes grupos alquilo, tales como 2-cloro-4,6-bisetilamino-1,3,5-triacina, 2-cloro-4-etilamino-6-dietilamino-1,3,5-triacina, 2-cloro-6-etilamino-4-isopropilamino-1,3,5-triacina o 2,4-bis(isopropilamino)-6-metiltio-1,3,5-triacina.

El herbicida fenol generalmente comprende 4,6-dinitro-o-cresol, 4,6-dinitro-2-sec-butilfenol o penilfenol o pentaclorofenol. El herbicida nitrilo generalmente comprende 3,5-diode-4-hidroxibenzonitrilol, 3,5-dibromo-4-hidroxibenzonitrilo o 2,6-diclorobenzonitrilo. El herbicida bupiridilio generalmente comprende 1,1'-dimetil-4,4'-bupiridilio dicloruro o 1,1'-etilen-2,2'-bupiridilio dibromuro. El herbicida ácido benzoico substituído generalmente comprende ácido 2,3,6-triclorobenzoico, ácido 2-metoxi-3,6-diclorobenzoico, o N-(1,1-dimetilpropinil)-3,5-diclorobenzamida. El herbicida ácido alifático halogenado generalmente comprende ácido tricloroacético o ácido 2,2-dicloropropiónico. El herbicida carbamato generalmente comprende isopropil N-(3-clorofenil) carbamato, 4-cloro-2-butinil N-(3-clorofenil) carbamato, metil 3-(m-tolilcarbamoiloxi) fenilcarbamato o D-N-etil-2-(fenilcarbamoiloxi) propionamida. El herbicida tiocarbamato generalmente comprende S-etil N,N-

dipropiltiocarbamato, S-etil N,N-diisobutiltiocarbamato, S-(2,3 - dicloroalil) N,N-diisopropiltiocarbamato, S-etil N-etil-N-ciclohexiltiocarbamato, S-propilbutil etiltiocarbamato o S-(2,3,3-tricloroalil) N,N-diisopropiltiocarbamato. El herbicida cloroacetamida generalmente comprende N,N-dialil-2-cloroacetamida o N-isopropil-2-cloroacetanilida. El herbicida diacina generalmente comprende 5-bromo-6-metil-3-sec-butiluracilo, 3-ciclohexil-5,6-trimetilenuracilo, 5-amino-4-cloro-2-fenil-3-piridacinona o 1,2-dihidropiridacina-3,6-diono. El herbicida arsénico generalmente comprende una sal de ácido metano arsénico o ácido cacodílico. Otros herbicidas que pueden usarse como segundo herbicida incluyen el ión 1,2-dimetil-3,5-difenilpirazolio, etil N-benzoil-N(3,4-diclorofenil) alanina, N-isobutil-2-oxo-1-imidazolidina-carboxamida, aminotriazol, 2,3-dicloro-1,4-naftoquinona, ácido 4-amino-3,5,6-tricloropicolínico, N,N-dimetil-2,2-difenilacetamida, 2,6-dinitro-N,N-dipropil-4-trifluorometilanilina N-butil-N-etil-2,6-dinitro-4-trifluoro metil anilina S,S,S-tributil fosforotritioato, 2-etoxi-2,3-dihidro-3,3dimetil-5-benzofuranil metilsulfonato, ácido 4-cloro-2-oxobenzotiazolin-3-yl acético, 3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazinon-(4)-2,2-dióxido, 3,5-dibromo-4-hidroxibenzaldehído 2,4-dinitrofeniloxima, metil 2-cloro-3-(4-clorofenil)propionato, 2-cloroetiltrimetilamonio cloruro, isopropil 2-(N-benzoil-3-cloro-4-fluoroanilino) propionato, metil 2-(N-benzoil-3-cloro-4-fluoroanilino) propionato, 2-cloro-N-(1,3-dioxolan-2-ylmetil)-2',6'-dimetilacetanilida, 2-cloro-1-(3-etoxi-4-nitrofenoxi)-4-trifluorometilbenceno, metil 2-(4-(2',4'-diclorofenoxi) fenoxi) propionato o isobutil 2-(4-(4'-clorofenoxi)-fenoxi) propionato.

El otro herbicida puede ser particularmente otro herbicida que combata avenas silvestres en cosechas de cereales.

Las configuraciones particulares, el compuesto en cuestión y en especial una detallada antes aquí como de preferencia para su uso como herbicida, ésto es, N-ciano-metil-3,4-dicloro-metanosulfonanilida, son usados (a) en mezcla con 4-cloro-2-butinil 3-clorofenil-carbamato, ión 1,2-dimetil-3,5-difenilpirazolio, ácido alfa-2-metil-4-clorofenoxipropiónico,

N^o-(3-cloro-4-metoxifenil)-N,N-dimetilurea,
 N^o-(3-cloro-4-metilfenil)-N,N-dimetilurea o etilo
 N-benzoil-N-(3,4-diclorofenil)alanina, o

(b) después de la salida de la cosecha que sigue al uso antes de la salida de la cosecha, S-2,3-dicloroalil di-isopropiltiocarbamato o S-2,3,3-tricloroalil di-isopropiltiocarbamato.

El compuesto en cuestión puede usarse en mezcla o secuencia con otro fungicida, particularmente otro fungicida de cereal. El otro fungicida puede ser, por ejemplo, uno o más de entre maneb (manganeso etilenbisditiocarbamato polimérico), zineb (zinc etilenbisditiocarbamato), mancozeb (que puede considerarse como una combinación de maneb y zineb), tiram (tetrametiltiuram disulfuro), ditalimfos (0,0-dietil phtalimido-fosfonotioato), tridemorf (2,6-dimetil-4-tridecilmorfolino), fluotrimazol (1-(difenil-(3-trifluorometilfenil) metil)-1,2,4-triazol), etirimol (5-butil-2-etilamino-4-hidroxi-6-metilpirimidino), triforino (1,4-di (2,2,2-tricloro-1-formamido-5-oxil) piperacina), piracarbolido (3,4-dihidro-6-metilpiran-2-carboxanilida), zineb-etilen tiuramdisulfuro aducto, carbendazim (metil bencimidazol-2-ylcarbamato), captafol (3a,4,7,7a-tetrahidro-N-(1,1,2,2-tetracloroetanosulfenil) phtalimido), tiofanato (1,2,-di (3-etoxi-carbonil-2-tioureido) benceno), propineb (zinc propilenbisditiocarbamato polimérico), oxicarboxin (2,3-dihidro-6-metil-5-fenilcarbamoil-1,4-oxatiin 4,4-dióxido), quintozen (pentacloronitrobenceno), benomil (metil 1-(butilcarbamoil) bencimi dazol-2-ylcarbamoil), bendanil (2-iodobenzanilida), diclofluanid (N-diclorofluoro-metanosulfenil-N^o,N^o-dimetil-N-fenilsulfamida), azufre, compuestos de cobre, iprodione (3-(3,5-diclorofenil)-1-(1-metiletil) aminocarbonil)-imidazolidina-2,4-diono, Ziram (zinc dimetilditiocarbamato), nabam (etilenbisditiocarbamato disódico), y triadimefon (1-(4-clorofenoxi)-3,3-dimetil-1-(1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanona).

En una estructuración en particular, el compuesto en cuestión, N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida, se usa en mezcla con tiram.

El compuesto en cuestión puede usarse en mezcla o en secuencia con insecticida, especialmente un insecticida de cereal. El insecticida puede ser, por ejemplo, uno o más de entre demeton-S-metil (S-2-etiltioetil O,O-dimetil fosforotioato), dimetoato (O,O-dimetil S-metilcarbamoilmetil fosforoditioato), formotion (S- (N-formil-N-metilcarbamoilmetil) O,O-dimetil fosforoditioato), oxidemeton-metil (S-2-etilsulfiniletil O,O-dimetil fosforotioato), pirimcarb (2-dimetilamino-5,6-dimetilpirimidin-4-yl dimetilcarbamato), tiometon (S-2-etiltioetil O,O-dimetilfosforoditioato), BHC (hexacloruro de benceno), aldrin (1,2,3,4,10,10-hexacloro-1,4a,5,8,8a-hexahidro-exo-1,4-endo-5,8-dimetanoaftaleno), fenitro-tion (O,O-dimetil O-4-nitro-m-tilil fosforotioato), ometoato (O,O-dimetil S-metilcarbamoilmetil fosforotioato), pirimifos-metil (O-2-dietilamino-6-metil-pirimidin-4-yl O,O-dimetil fosforotioato) y DDT (1,1,1-tricloro-2,2-di (clorofenil) etano).

La proporción entre el compuesto en cuestión y otro pesticida o regulador del crecimiento de la planta puede variar dentro de un margen amplio de acuerdo a los compuestos particulares involucrados y al uso que se propene. En general la razón del compuesto en cuestión a otro pesticida o regulador del crecimiento de la planta está en el margen de 1:0.1 a 1:15.

Los compuestos pueden estar en mezcla con un antídoto (substancia que tiene la propiedad de mejorar la selectividad de los herbicidas), por ejemplo, N,N-dialil-2,2-dicloroacetamida o anhídrido 1,8-naftálico.

Los compuestos pueden estar en mezcla con fertilizantes.

En la utilización de los compuestos en cuestión como herbicidas totales usualmente se requieren grandes proporciones de aplicación, por ejemplo, por 1 o menos 10 Kg por hectárea, algo así como 10-25 Kg de compuesto por hectárea,

a menos que se mezcle con otros herbicidas, en cuyo caso se puede reducir la razón.

En la utilización de los compuestos en cuestión como herbicidas selectivos, la razón de aplicación es usualmente mucho menor y puede ser, por ejemplo, 0,5-8 Kg por hectárea, algo así como 1-4 Kg por hectárea.

En la utilización de los compuestos como reguladores del crecimiento de la planta, usualmente se requieren razones bajas de aplicación, por ejemplo, 0,1-4, algo así como 0,5-1 Kg por hectárea.

Para la utilización como fungicidas, insecticidas o agentes anti bacterianos, los compuestos son aplicados generalmente en una razón de 0,3-10, por ejemplo, 1-6 Kg por hectárea. Para la utilización como fungicidas, los compuestos pueden ser incorporados, en un medio para crecimiento de plantas, especialmente un medio para crecimiento de planta con base de turba en el cual las plantas han de crecer, por ejemplo, en una razón de 10-1000, preferiblemente 50-500, g de compuesto por metro cúbico. Los compuestos pueden ser utilizados como abono de semillas, usando la palabra "semilla" en su sentido amplio para incluir tubérculos y bulbos: para esta utilización, los compuestos pueden emplearse en una razón de, por ejemplo, 0,1-1 g por Kg de semilla y se usan preferiblemente en mezcla con un portador para facilitar la mezcla con la semilla; el portador puede ser un líquido, por ejemplo, un hidrocarburo, o un sólido, por ejemplo, arcilla o tierra Fullers.

Los compuestos en cuestión pueden ser aplicados a plantas (incluyendo semillas), al terreno (incluyendo estéril) a áreas de tierra o acuáticas, o a materiales inanimados o almacenados, por ejemplo, textiles, papel, cuero o madera, que son susceptibles de ser atacados por hongos. Son usados preferentemente como herbicidas, particularmente herbicidas selectivos o fungicidas, especialmente para la aplicación en un lugar en el cual está creciendo, o: menos preferentemente,

ha de crecer una cosecha, por ejemplo, una cosecha de alimentos, especialmente cosecha de cereal como trigo, cebada o maíz. Por consiguiente, los compuestos pueden ser utilizados para proteger de hierbajos y hongos a las plantas.

La invención está ilustrada en los siguientes Ejemplos, en los cuales las temperaturas están en grados C.

Ejemplo 1

Se agregó una solución de cloruro de propanosulfonil (25 ml) en tolueno (50 ml) durante 15 minutos a una solución agitada de 2,6-dimetilanilina (55 ml) en tolueno (400 ml). Se agitó y se hirvió la mezcla en reflujo por 20 horas, luego se enfrió y se filtró. La solución de tolueno fue lavada con ácido clorhídrico diluido (tres veces) y agua, luego fue extraída (tres veces) con solución de hidróxido de sodio diluida. La solución alcalina acuosa fue acidificada con ácido clorhídrico diluido y se recogió el producto de filtración que fue lavado con agua y secado. La cristalización del tolueno/60-80° petrol dió 2,6-dimetil-1-propanosulfonanilida en forma de cristal colorante (28,0 g, 55%), punto de fusión 72°.

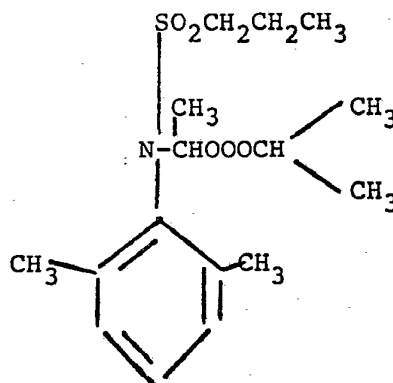
Ejemplo 2

Se agitó una mezcla de la sulfonanilida del Ejemplo 1 (28,0 g), carbonato de potasio anhidro (9,4 g), etil 2-bromopropionato (17,6 ml) y 1,2-dimetoxietano (200 ml) y se hirvió bajo reflujo por 20 horas, luego fue enfriada y filtrada y el filtrado evaporado. Se lavó una solución del aceite residual en éter, con una solución de hidróxido de sodio diluida. La solución alcalina fue acidificada con ácido clorhídrico diluido y el sólido precipitado fue recogido por filtración. Este material (13,3 g) fue identificado como sulfonanilida no reaccionada. La solución de éter fue evaporada y se calentó una solución del aceite residual en solución de hidróxido de sodio etanol/10% (100 ml, 1:1) a 50° por 2 horas. El etanol se evaporó, dejando una solución acuosa de la sal sódica de N-(2,6-dimetilfenil)-N-(1-propanosulfonil)-alanina. La solución fue acidificada con ácido clorhídrico diluido. El producto ácido fue extraído con cloroformo, la solución de cloroformo fue secada y evaporada y el residuo cristalizó del tolueno/60-80° petrol para dar cristal colorante de N-(2,6-dimetilfenil)-N-(1-propanosulfonil) alanina

(14,1g) (rendimiento de 73% basado en la sulfonanilida no recuperada).

Ejemplo 3

Se trató una solución del derivado de alanina del Ejemplo 2 (6,5g) en tolueno (100 ml), con tionil cloruro (10 ml), se hirvió bajo reflujo por una hora y luego se evaporó. El aceite residual fue re- evaporado con tolueno para remover trazas de tionil cloruro y luego el residuo fue hervido en 2-propanol por 1 hora y evaporado. Una solución de este residuo oleoso en éter fue lavada con solución de bicarbonato de sodio, secada y evaporada a un aceite marrón que fue filtrado a través de una columna de gel de silica con cloroformo. La evaporación del eluato dió el isopropil éster



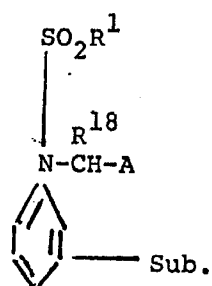
en forma de un aceite amarillo claro;

Análisis: Encontrado: 59,45%C, 7,91%H, 3,77%N

$C_{17}H_{27}NO_4S$ requiere: 59,79%C, 7,97H, 4,10%N

Ejemplos 4-33

Siguiendo un procedimiento análogo al de los ejemplos previos, los siguientes compuestos fueron preparados:

Acidos

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
4	Me	Me	COOH	3,4-di Cl	131°
5	Me	Me	COOH	2-Et	212°
6	Me	Me	COOH	2-Cl-6 Me	98°
7	Me	Me	COOH	2,6-di Me	118°
8	Me	Me	COOH	2-OCH ₃	131°
9	Et	Me	COOH	2,6-di Me	122°
10	Me	Me	COOH	2,6-di Et	118°
11	Me	Me	COOH	2,6-di Cl	128°

Esteres

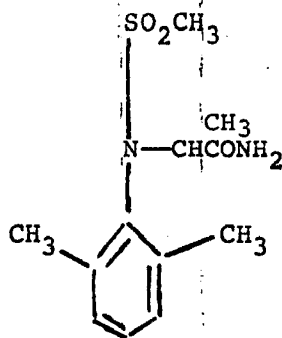
Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Análisis en donde el producto es un Aceite			
						Encontrado Requiere	ANÁLISIS		
							%C	%H	%N
12	Me	H	COOEt	4-CL	Aceite	C ₁₁ H ₁₄ CINO ₄ S	45.03	4.63	4.74
13	Me	Me	COOEt	4-CL	Aceite	C ₁₂ H ₁₆ CINO ₄ S	45.28	4.84	4.80
14	Me	H	COOEt	2,6-diMe	Aceite	C ₁₃ H ₁₉ NO ₄ S	46.82	5.45	4.78
15	Me	Me	COOEt	2,6-diMe	Aceite	C ₁₄ H ₂₁ NO ₄ S	47.13	5.27	4.58
16	Me	Me	COOEt	3-CF ₃	Aceite	C ₁₃ H ₁₆ F ₃ NO ₄ S	54.62	6.51	5.17
17	Me	H	COOEt	3-CF ₃	Aceite	C ₁₂ H ₁₄ F ₃ NO ₄ S	54.72	6.71	4.91
18	Me	H	COOEt	3,4-diCl	Aceite	C ₁₁ H ₁₃ Cl ₂ NO ₄ S	56.04	7.29	5.07
19	Me	H	COOEt	2-isoPr	Aceite	C ₁₄ H ₂₁ NO ₄ S	56.16	7.07	4.68
20	Me	Me	COOEt	3,4-diCl	Aceite	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ NO ₄ S	45.84	5.00	4.37
							46.01	4.75	4.13
							44.00	4.11	4.61
							44.30	4.34	4.31
							40.78	3.96	4.59
							40.50	4.02	4.29
							55.99	7.38	4.96
							56.16	7.07	4.68
							41.90	2.99	4.60
							42.36	4.44	4.12

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Análisis en donde el producto es un Aceite	ANÁLISIS		
							%C	%H	%N
21	Me	Me	COOEt	2-Et	Aceite	C ₁₄ H ₂₁ NO ₄ S	55.94	6.89	4.88
22	Me	Me	COOEt	2-Cl, 6Me	Aceite	C ₁₃ H ₁₈ ClNO ₄ S	56.16	7.07	4.68
23	Me	Me	COOEt	2-OCH ₃	Aceite	C ₁₃ H ₁₉ NO ₅ S	48.52	5.43	4.33
24	n-Pr	Me	COOEt	2, 6-diMe	44-46°	C ₁₆ H ₂₅ NO ₄ S	48.82	5.67	4.38
25	Me	Me	COOEt	2-Cl	Aceite	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₄ S	52.19	6.36	4.84
26	Et	Me	COOEt	2, 6-diMe	70°	C ₁₅ H ₂₃ NO ₄ S	51.81	6.36	4.65
27	n-Bu	Me	COOEt	2, 6-diMe	Aceite	C ₁₇ H ₂₇ NO ₄ S	58.28	7.77	4.11
28	Me	Me	COOEt	2, 6-diCl	108°	C ₁₇ H ₂₇ NO ₄ S	58.69	7.70	4.28
29	Me	Me	COOMe	2, 6-diMe	Aceite	C ₁₃ H ₁₉ NO ₄ S	47.05	5.60	4.80
30	Me	Me	COOEt	2, 6-diEt	Aceite	C ₁₆ H ₂₅ NO ₄ S	47.14	5.27	4.58

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Análisis en donde el producto es un Aceite			
						Encontrado requiere	%C	%H	%N
31	Me	Me	COOn-Pr	2,6-diMe	Aceite	C ₁₃ H ₂₃ NO ₄ S	57.57 57.48	7.49 7.40	4.41 4.47
32	Me	Me	COO(CH ₂) ₄ CH ₃	2,6-diMe	Aceite	C ₁₇ H ₂₇ NO ₄ S	59.66 59.79	8.10 7.97	3.98 4.10
33	Me	Me	COOCH ₂ CH ₂ CH ₃ (CH ₂) ₅ CH ₃	2,6-diMe	Aceite	C ₂₀ H ₃₃ NO ₄ S	63.01 62.63	8.51 8.67	3.70 3.65

Ejemplo 34

Se trató una solución de N-(2,6-dimetilfenil)-N-metano-sulfonil alanina (5g) en cloroformo (50 ml), con tionil cloruro (5 ml) y se hirvió la solución bajo reflujo por 1 hora y después se evaporó. El residuo fue re-evaporado con tolueno para remover trazas de tionil cloruro. Se trató una solución de cloroformo del residuo, con una solución saturada de amonía en cloroformo, se dejó reposar la mezcla a temperatura de salón por 4 horas, y después se añadió agua y el disolvente orgánico fue evaporado. El sólido suspendido fue remojado por filtración, lavado con agua y secado. La recristalización con el etanol dió la amida



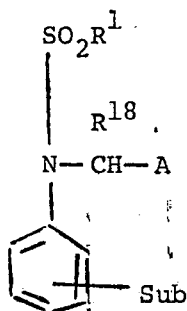
en forma de cristales incoloros, punto de fusión 158°C.


Ejemplos 35-43

Siguiendo un procedimiento análogo al del ejemplo 34, los siguientes compuestos fueron preparados:

8/A/74

-45-



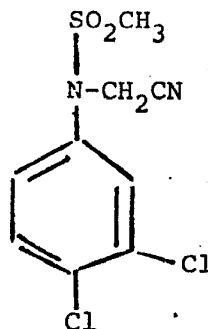
Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
35	Me	H	CONEt ₂	4-Cl	76°
36	Me	H	CONEt ₂	2,6-diMe	76°
37	Me	H	CONEt ₂	2-isoPr	108°
38	Me	H	CONEt ₂	3-CF ₃	54°
39	Me	H	CONEt ₂	3,4-diCl	90°
40	Me	Me	CONHPh	2-Et	156°
41	Me	Me	CON 	2-Et	120°
42	Me	Me	CONH ₂	2-Cl, 6-Me	134°
43	Me	Me	CONH ₂	2-Cl, 6-Me	158°

Ejemplo 44

Se agitó y se hirvió bajo reflujo por 6 horas una mezcla de 3,4-dicloro-metanosulfonanilida (7,0g), carbonato de potasio anhidro (2,4g), cloroacetnitrilo (2,2 ml) y 1,2-dimetoxietano (100 ml). La mezcla de reacción de color obscuro fue enfriada, filtrada y evaporada. Una solución del aceite residual en cloroformo fue lavada bien con agua, secada y evaporada para dar un aceite negro que fue filtrado a través de una

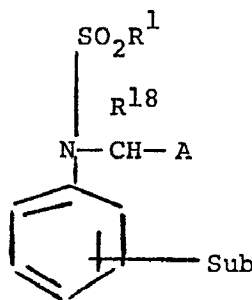
POOR
QUALITY

columna de gel de sílica con cloroformo. La evaporación del eluato dió un aceite, solución que en etanol depositó un sólido color crema identificado como N-cianometil-3,4-dicloro-metanosulfonanilida (3.8 g), punto de fusión 83° ,



Ejemplos 45-48

Siguiendo un procedimiento análogo al del ejemplo 44, los siguientes compuestos fueron preparados:

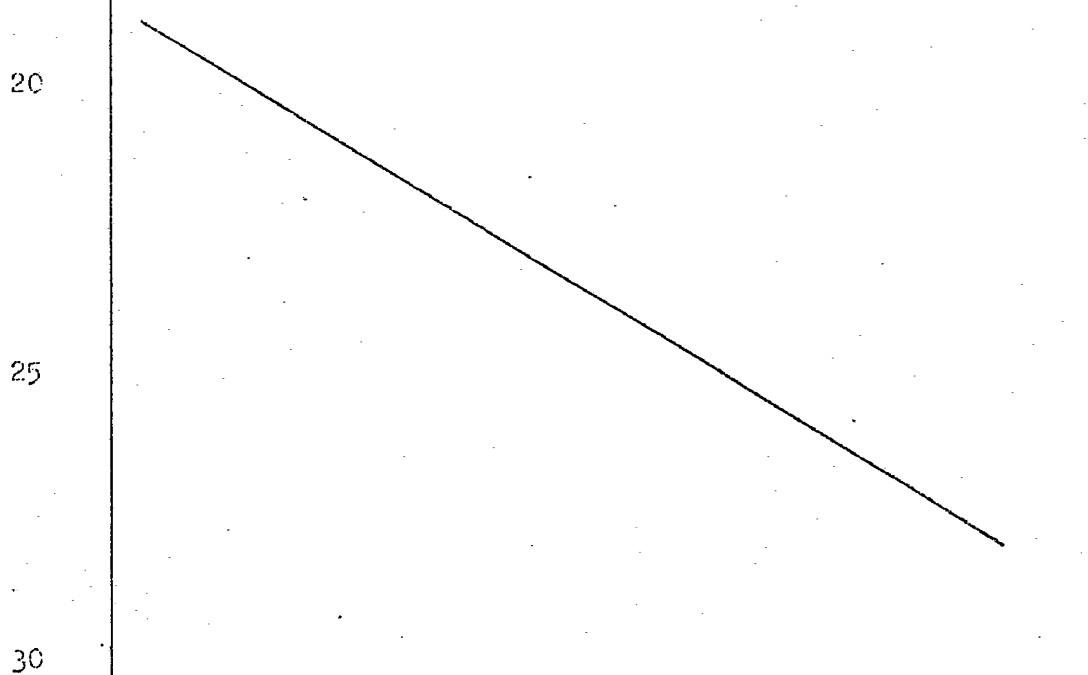


Ejemplos	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
45	Me	H	CN	4-Cl	102°
46	Me	H	CN	2,6-diMe	84°
47	Me	H	CN	2-isoPr	99°
48	Me	H	CN	3-CF ₃	61°

Ejemplos 49-55

Se sembraron semillas de las especies de plantas enumeradas

a continuación en poroles de aluminio anodizado, de 19 cm de largo x 9,5 cm de ancho x 5 cm de profundidad, que contenían abono de sembrado John Innes I. Estas fueron regadas después y colocadas en una habitación de ambiente controlado (22°C; 5 65-85% humedad relativa; 14 horas por día artificial a 13.000 lux). Catorce días después de la siembra, los brozos de las semillas recibieron un pulverizador foliar de un compuesto enumerado a continuación, formulado como una solución en 1:1 por volumen acetona acuosa. La concentración del ingredien- 10 te activo y el volumen de aplicación fueron ajustados de forma que fueran equivalentes a una razón de 11,2 Kg/ha en 450 litros por hectárea. Después de siete días de crecimiento en la habitación de ambiente controlado, las plantas fueron evaluadas visualmente para respuesta herbicida o reguladora del crecimiento. Todas las diferencias con los contro- 15 les no tratados fueron apuntadas de acuerdo a un índice en donde 0 = ningún efecto y 100 = destrucción completa. Los resultados están demostrados en la siguiente tabla:



30109

**POOR
QUALITY**

Ejemplo		49	50	51	52	53	54	55
Compuesto del ejemplo		15	22	3	24	25	26	27
Especies	Razón de dosis Kg/ha	11.2	11.2	11.2	11.2	11.2	11.2	11.2
Guisantes - (<i>Pisium sativum</i>)		5	5	5	20	5	5	5
Mostaza - (<i>Sinapis alba</i>)		90	80	90	100	80	100	100
Linaza - (<i>Linum usitatissimum</i>)		90	30	30	90	20	100	70
Centenaza - (<i>Lolium perenne</i>)		10	5	15	75	0	40	20
Remolacha - (<i>Beta vulgaris</i>)		90	80	90	90	30	90	90
Avena - (<i>Avena sativa</i>)		5	5	5	30	20	40	30
Judías verdes - (<i>Phaseolus vulgaris</i>)		70	80	80	100	-	-	-

Ejemplos 56-60

Cada uno de los compuestos enumerados a continuación fue formulado como polvo atarcilla/arena e incorporado al abono de sembrado John Innes I a una razón equivalente a 26 partes por millón peso/volumen de ingrediente activo a terreno, y fue colocado en peroles de aluminio anodizado de 19 cm de largo x 9,5 cm de ancho x 5,0 cm de profundidad. Esta razón es equivalente aproximadamente a una aplicación de superficie de terreno de 11,2 Kg ingrediente activo/hectárea cultivada a una profundidad de 5 cm. Las semillas de las especies enumeradas a continuación fueron sembradas en la tierra tratada y fueron regadas y colocadas en una habitación de ambiente controlado (22°C; 65-85% humedad relativa; 14 horas por día iluminación artificial a 13.000 lux) por 21 días. Las plantas fueron entonces evaluadas visualmente para efectos herbicidas o reguladores del crecimiento. Todas las diferencias con los controles no tratados fueron apuntadas en una escala de 0-100, en donde 0 significa ningún efecto y 100 significa destrucción completa. Los resultados están demostrados en la siguiente tabla:

Ejemplo	56	57	58	59	60
Compuesto del ejemplo	15	44	22	3	24
Especies razón de dosis (ppm)	26	26	26	26	26
Guisantes - (<i>Pisium sativum</i>)	0	0	0	0	0
Mostaza - (<i>Sinapis alba</i>)	100	40	100	90	100
Linaza - (<i>Linum usitatissimum</i>)	70	20	100	20	100
Maíz - (<i>Zea mays</i>)	50	5	50	20	60
Avena - (<i>Avena sativa</i>)	20	60	50	20	60
Centenaza - (<i>Lolium perenne</i>)	100	5	90	90	100

30

30109

**POOR
QUALITY**

Ejemplos 61-65

5

10

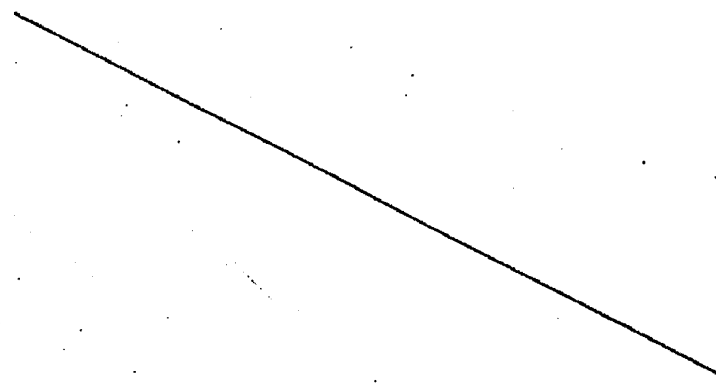
15

20

25

30

Se sembraron semillas de las especies de plantas enumeradas a continuación, en un abono de sembrado John Innes I en peroles de aluminio de 19 cm de largo x 9,5 de ancho x 5,0 de altura, una especie por perol. Entonces la superficie de tierra fue pulverizada con un compuesto enumerado a continuación, formulado como una solución en 1:1 por volumen acetona acuosa excepto por el compuesto del Ejemplo 44 que fue formulado como una solución acuosa con 1000 partes por millón del agente humectante Lissapol NX (condensado nonilfenol/etilen óxido). Cada compuesto fue aplicado a una razón de 2,8 Kg de ingrediente activo por hectárea en 450 litros de líquido pulverizador por hectárea. Los peroles fueron entonces regados y colocados en una habitación de ambiente controlado (22°C, humedad relativa 65-85%, 14 horas por día iluminación artificial a 17.000 lux) por 21 días. Las plantas fueron entonces evaluadas visualmente para efectos herbicidas o reguladores de crecimiento. Todas las diferencias con los controles no tratados fueron apuntadas en una escala de 0-100 en donde 0 significa ningún efecto y 100 significa destrucción completa. Los resultados están demostrados en la siguiente tabla:



30109

**POOR
QUALITY**

Ejemplo	61	62	63	64	65
Compuesto del Ejemplo	15	44	22	3	24
Especies Razón de dosis Kg/ha	2,8	2,8	2,8	2,8	2,8
5 peplomina - (<u>Stellaria media</u>)	30	-	50	-	-
Mostaza - (<u>Sinapis alba</u>)	10	-	90	-	-
Algodón - (<u>Gossypium sp.</u>)	0	-	0	-	-
Tomate - (<u>Lycopersicon esculentum</u>)	20	-	40	-	-
10 Quenopodio - (<u>Chenopodium album</u>)	100	-	100	-	-
Zanahoria - (<u>Daucus carota</u>)	0	-	0	-	-
Trigo - (<u>Triticum aestivum</u>)	0	0	0	0	10
Cebada - (<u>Hordeum vulgare</u>)	0	0	0	0	30
Avena salvaje - (<u>Avena fatua</u>)	5	0	0	80	100
15 - (<u>Alopecurus myosuroides</u>)	20	0	40	90	100
- (<u>Echinochloa crus-galli</u>)	40	80	0	60	80
- (<u>Digitaria sanguinalis</u>)	100	0	90	90	100
20 Arroz - (<u>Oryza sativa</u>)	-	0	-	-	-

Ejemplo 66

25 Se sembraron semillas de las especies monocotiledoneas enumeradas a continuación, en peroles de aluminio anodizado de 19 cm de largo X 9,5 cm de ancho x 5,0 cm de profundidad que contenían abono de sembrado John Innes I. Después fueron regadas y colocadas en una habitación de ambiente controlado (22°C, 65-85% humedad relativa; 14 horas por día iluminación artificial a 17.000 lux).

14 días después de la siembra, los brezos de las semillas recibieron un pulverizador foliar del compuesto del Ejemplo 44, formulado como una solución acuosa conjuntamente con 2000 ppm del agente humectante Lissapol NX. La razón de dosis fue ajustada a 2,8 Kg de ingrediente activo en 450 litros por hectárea. Después de unos 14 días adicionales en la habitación de ambiente controlado, las plantas fueron evaluadas visualmente para efectos herbicidas o reguladores del crecimiento. Todas las diferencias con los controles no tratados fueron apuntadas en una escala de 0-100 en donde 0 significa ningún efecto y 100 significa destrucción completa. Los resultados están demostrados en la siguiente tabla:

Especies	razón de dosis Kg/ha	2,8
Trigo	- (<u>Triticum aestivum</u>)	0
Cebada	- (<u>Hordeum vulgare</u>)	0
	- (<u>Echinochloa crus-galli</u>)	100

Ejemplos 67-83

Los compuestos enumerados a continuación fueron investigados siguiendo el procedimiento de los Ejemplos 56-60 pero a 130 partes por millón peso/volumen ingrediente activo a tierra. Esta razón es equivalente aproximadamente a una aplicación en superficie de terreno de 56 Kg de ingrediente activo por hectárea cultivada a una profundidad de 5 cm.

Los resultados se demuestran a continuación:

Ejemplo		67	68	69	70	71	72	73	74	75	76	77	78	79	80	81	82	83
Compuesto del ejemplo		4	5	7	9	12	14	17	18	25	26	27	35	36	45	46	47	48
Especies																		
Guisantes	- (<u>Pisum sativum</u>)	70	30	20	50	40	30	40	40	5	100	20	20	20	20	20	10	50
Mostaza	- (<u>Sinapis alba</u>)	70	50	70	70	70	100	40	40	100	100	100	100	100	100	100	80	100
Linaza	- (<u>Linum usitatissimum</u>)	90	70	50	80	80	90	90	80	50	100	100	40	40	90	90	100	100
Centenaza	- (<u>Lolium perenne</u>)	0	20	0	20	5	30	0	30	0	100	100	20	20	80	80	50	90
Avena	- (<u>Avena sativa</u>)	40	30	30	20	5	20	0	0	20	100	100	20	20	70	70	30	80
Maiz	- (<u>Zea mays</u>)	70	30	30	30	0	40	0	30	40	100	100	20	20	30	30	10	40

Ejemplo 84

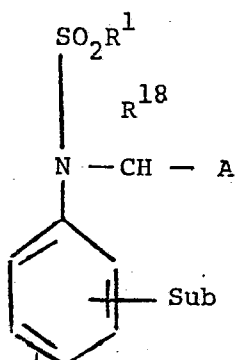
Se aplicaron suspensiones acuosas de acetona que contenían 2000 mg del compuesto del Ejemplo 15 por litro y 125 mg del agente humectante Lissapos NX (condensado nonilfenol/etilen óxido) por litro, a la tierra alrededor de las raíces y hojas de plantas tratadas, conjuntamente con los controles tratados con agente humectante solamente, fueron inoculadas con esporas del organismo de enfermedad conocido como moho polvoriento del pepino Erysiphe cichloracearum, 24 horas después de la aplicación química. Las plantas fueron entonces colocadas en una habitación de ambiente controlado (18°C y 80-90% humedad relativa) hasta el momento de medir la incidencia de enfermedad después de catorce días, cuando se encontró que el tratamiento con el compuesto activo resultó en un control del hongo, de 82%, en comparación con menos del 5% en los controles.

Ejemplo 85

Se pasó un flujo lento de gas sulfuro de hidrógeno a través de una solución agitada de N-cianometil-3,4-diclorometanosulfonánilida (6.0 g) en piridina (75 ml) que contenía trietilamina (11.0 ml). La reacción se llevó a efecto a temperatura de salón por 4 horas y después la mezcla fue puesta en hielo/agua (1500 ml). El sólido precipitado colorante fue recogido por filtración, lavado con agua y secado. El producto fue identificado como N-(tiocarbamoil metil)-3,4-diclorometanosulfonánilida (6.0 g, 89% rendimiento), punto de fusión 178°.

Ejemplos 86-89

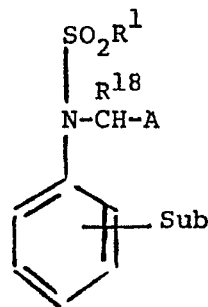
Siguiendo procedimientos análogos a los del Ejemplo 85, los siguientes compuestos fueron preparados:



Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
86	Me	H	$\begin{matrix} \text{S} \\ \parallel \\ -\text{CNH}_2 \end{matrix}$	2-isopropil	136°
87	Me	H	$\begin{matrix} \text{S} \\ \parallel \\ -\text{CNH}_2 \end{matrix}$	4-cloro	186°
88	Me	H	$\begin{matrix} \text{S} \\ \parallel \\ -\text{CNH}_2 \end{matrix}$	3-CF ₃	136°
89	Me	H	$\begin{matrix} \text{S} \\ \parallel \\ -\text{CNH}_2 \end{matrix}$	2,6-dimetil	160°

Ejemplos 90-92

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 2, los siguientes compuestos fueron preparados:



Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
90	Me	Et	COOH	2,6-diMe	164°
91	n-Bu	Me	COOH	2,6-diMe	112°
92	n-Pr	Me	COOH	2,6-diMe	143°

Ejemplos 93-122

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 3, los siguientes compuestos de la fórmula dada en los Ejemplos 90-92 fueron preparados:

Análisis en donde el producto es un aceite

ANÁLISIS

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Encontrado Requiere	%C	%H	%N
93	Et	Me	COOC ₄ H ₉	2,6-diMe	Aceite	C ₁₇ H ₂₇ NO ₄ S	60.02 59.79	7.61 7.97	3.80 4.10
94	Me	H	COOEt	2-Cl,6Me	Aceite	C ₁₂ H ₁₆ ClNO ₄ S	46.79 47.13	4.90 5.27	4.37 4.58
95	Me	Et	COOEt	2,6-diMe	Aceite	C ₁₅ H ₂₃ NO ₄ S	57.56 57.48	7.26 7.40	4.66 4.47
96	NMe ₂	Me	COOEt	3,4-diCl	Aceite	C ₁₃ H ₁₈ Cl ₂ N ₂ O ₄ S	42.70 42.28	4.60 4.91	7.16 7.59
97	Me	Me	COOEt	4-OSO ₂ Me	101°				
98	NO ₂	Me	COOEt	2,6-diMe	164°				
99		Me	COOEt	3,4-diCl	80-82°				
100	S	Me	COOEt	2,6-diMe	Aceite	C ₁₇ H ₂₁ NO ₄ S ₂	56.01 55.56	5.92 5.76	3.58 3.81
101	NMe ₂	Me	COOEt	w,6-diMe	Aceite	C ₁₅ H ₂₄ N ₂ O ₄ S	55.04 54.85	7.00 7.37	8.36 8.53

Análisis en donde el producto es un aceite

ANÁLISIS

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Encontrado Requiere	%C	%H	%N
102	NMe ₂	Me	COOEt	2-Cl, 6-Me	Aceite	C ₁₄ H ₂₁ ClN ₂ O ₄ S	48.05 48.20	5.68 6.07	7.94 8.03
103	NMe ₂	Me	COOMe	2-Cl, 6-Me	Aceite	C ₁₃ H ₁₉ ClN ₂ O ₄ S	46.95 46.63	5.39 5.72	7.91 8.37
104	Me	Me	COOEt	2-OSO ₂ Me	Aceite	C ₁₃ H ₁₉ NO ₇ S ₂	42.76 42.73	5.34 5.24	3.60 3.83
105	NMe ₂	Me	COOMe	2,6-dime	71°				
106	Me	Me	COOEt	4-CH	108°				
107	Me	Me	COIsoPr	2,6-dime	64°				
108	Me	Me	COO	2-Cl, 6Me	76°				
109	Me	Me	COIsoPr	2-Cl, 6Me	78°				
110	NMe ₂	H	COOEt	3,4-dicl	Aceite	C ₁₃ H ₁₆ Cl ₂ N ₂ O ₄ S	42.88 42.51	4.54 4.39	7.85 7.63

Análisis en donde el producto es un aceite

ANÁLISIS

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Encontrado Requiere	%C	%H	%N
111	Me	Me	COO	2,6-diMe	108°				
112	NMe ₂	H	COOMe	3,4-diCl	Aceite	C ₁₁ H ₁₄ Cl ₂ N ₂ O ₄ S	39.01 38.72	4.00 4.14	8.61 8.21
113	NMe ₂	H	COOEt	4-Cl	Aceite	C ₁₂ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S	45.22 44.93	5.16 5.34	8.57 8.73
114	Et	Me	COOisopr	2,6-diMe	Aceite	C ₁₆ H ₂₅ NO ₄ S	59.02 58.69	7.95 7.70	4.61 4.28
115	NO ₂	Me	COOEt	2-Cl,6Me	142°				
116	Et	Me	COO	2,6-diMe	92°				
117	Me	H	-(CH ₂) ₂ COOEt	2,6-diMe	Aceite	C ₁₅ H ₂₃ NO ₄ S	57.14 57.48	7.16 7.40	4.33 4.47
118	Me	H	-(CH ₂) ₂ COOMe	2,6-diMe	Aceite	C ₁₄ H ₂₁ NO ₄ S	55.81 56.16	6.94 7.07	4.50 4.68

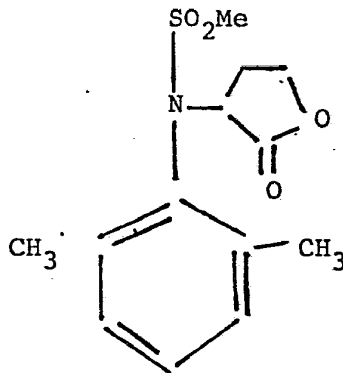
Análisis en donde el producto es un aceite

ANÁLISIS

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	de fusión	Encontrado Requiere	%C	%H	%N
119	Me	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{COOCH} \\ \\ \text{C}_6\text{H}_{13} \end{array}$	2,6-diMe	Aceite	C ₂₁ H ₃₅ NO ₄ S	63.80 63.44	8.44 8.87	3.82 3.52
120	Me	Me	COOMe	2,CF ₃ ,4-SPh	Aceite	C ₁₈ H ₁₈ F ₃ NO ₄ S ₂	49.72 49.87	4.53 4.19	3.71 3.23
121	Et	Et	COOEt	2,6-diMe	Aceite	C ₁₆ H ₂₅ NO ₄ S	58.29 58.69	7.40 7.70	3.94 4.28
122	nPr	Et	COOEt	2,6-diMe	51°				

Ejemplo 123

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 2 pero empleando material de comienzo bromolactona, la lactona



punto de fusión 127^o, fue preparada.

Ejemplos 124-127

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 34, los siguientes compuestos de fórmula dada en los ejemplos 90-92 fueron preparados:

Análisis en donde el producto es un aceite

ANÁLISIS

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión	Encontrado Requiere	%C	%H	%N
124	Me	H	CONEt ₂	2-Cl,6-Me	70°				
125	Me	Me	CONHCH ₂ COOEt	2,6-diMe	99°				
126	Me	Me	CONHNHCOOEt	2,6-diMe	178°				
127	Me	H	CH ₂ CH ₂ CONEt ₂	2,6-diMe	Aceite	C ₁₇ H ₂₈ N ₂ O ₃ S	59.86 59.97	8.64 8.29	8.40 8.23

Ejemplos 128-148

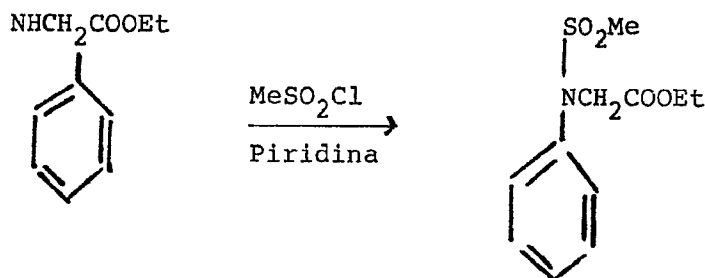
Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 44, los siguientes compuestos de fórmula dada en los Ejemplos 90-92 fueron preparados:

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
128	Me	H	CN	2-Cl,6Me	68°
129	Me	Me	CN	2,6-diMe	80-82°
130	Me	H	CN	2-Cl	65°
131	Me	H	CN	3-Cl,4Me	88°
132	nPr	H	CN	3,4-diCl	80°
133	Me	H	CN	2,5-diCl	112°
134	Me	H	CN	3-Cl,4-F	110°
135	Me	H	CN	2,6-diCl	82°
136	Me	H	CN	2-OSO ₂ Me	98-99°
137	Et	H	CN	3,4-diCl	79-81°
138	NMe ₂	H	CN	3,4-diCl	85°
139	Me	H	CN	2,3-diCl	86°
140	Me	H	CN	3-Cl	64°
141	Me	H	CN	4-SCN	118°
142	Me	H	CN	3-NO ₂ ,4-Cl	114-116°
143	Me	H	CN	2,4-diCl	88°
144	NMe ₂	H	CN	4-Cl	52°
145	Me	H	CN	3,4-diMe	102°
146	Me	H	-(CH ₂) ₂ CN	2,6-diMe	51°
147	Me	H	-(CH ₂) ₂ CN	3,4-diCl	78°
148	Me	H	-(CH ₂) ₂ CN	3,4-diMe	88°

Ejemplos 149-160

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 85, los siguientes compuestos de fórmula dada en los Ejemplos 90-92 fueron preparados:

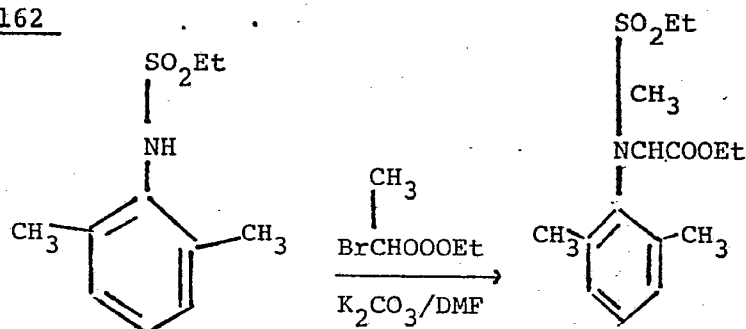
Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
149	Me	H	CSNH ₂	2-Cl,6Me	152°
150	Me	H	CSNH ₂	3-Cl,4Me	202°
151	Me	H	CSNH ₂	2-Cl	172°
152	Me	H	CSNH ₂	2,6-diCl	180°
153	Me	H	CSNH ₂	2,5-diCl	196°
154	Me	H	CSNH ₂	3-Cl	184°
155	nPr	H	CSNH ₂	3,4-diCl	168-170°
156	Et	H	CSNH ₂	3,4-diCl	162-164°
157	Me	H	CSNH ₂	2,3-diCl	178°
158	Me	H	CSNH ₂	3-Cl,4-F	182°
159	Me	H	CSNH ₂	2,4-diCl	160°
160	Me	H	CSNH ₂	2-OSO ₂ Me	180°

Ejemplo 161

Se trató una solución de N-fenilglicina etil éster (10,0 g) en piridina (50 ml), con metano sulfonil cloruro (4,3 ml).

-64-

Se dejó que la reacción exotérmica procediera libremente, hirviendo después la mezcla bajo reflujo durante 2 1/2 horas, enfriando y vertiéndola en una mezcla fuertemente agitada de hielo/agua/ácido clorhídrico. El precipitado sólido, de color castaño claro, fue recogido por filtración, lavado con agua y secado. Rendimiento 7,0g (49%). La recrystalización de acetato de etilo/petróleo 60-80° dió cristales descoloridos de punto de fusión igual a 66°.

Ejemplo 162

Se agitó y calentó a 90° durante 7 1/2 horas una mezcla de 2',6'-dimetiletanosulfonanilida (6,0g), carbonato potásico anhidro (2,1g), etil 2-bromopropionato (3,65ml) y dimetilformamida (DMF) (90ml). Se enfrió y filtró la mezcla, lavándose el residuo en el filtro con DMF caliente, y evaporándose el filtrado. El aceite amarillo resultante fue disuelto en éter lavándose la disolución sucesivamente con una disolución de hidróxido sódico al 10% y con agua, secándose después (MgSO4) y evaporándose. El residuo sólido fue apartado con un poco de etanol, y los cristales se recogieron por filtración. El rendimiento de N-1-carboetoxietil-2',6'-dimetiletanosulfonanilida fue 5,7g (65%). Punto de fusión 70°.

Ejemplo 163

Se hirvió y agitó bajo reflujo durante 66 horas, una mezcla

de 2',6'-dimetiletanosulfonanilida (68,5g), carbonato potásico anhidro (24,5g), etil 2-bromopropionato (58,0g) y 1,2-di-metoxietano (400ml), enfriando después filtrando, y evaporando el filtrado.

Una disolución en éter del residuo aceitoso fue lavada tres veces con disolución de hidróxido sódico al 10% (100ml), lavando con agua, secando (MgSO₄) y evaporando para obtener N-(1-carboetoxietil)-2',6'-dimetiletanosulfonanilida como aceite amarillo pálido con una pureza superior al 99% (por cromatografía gas-líquido).

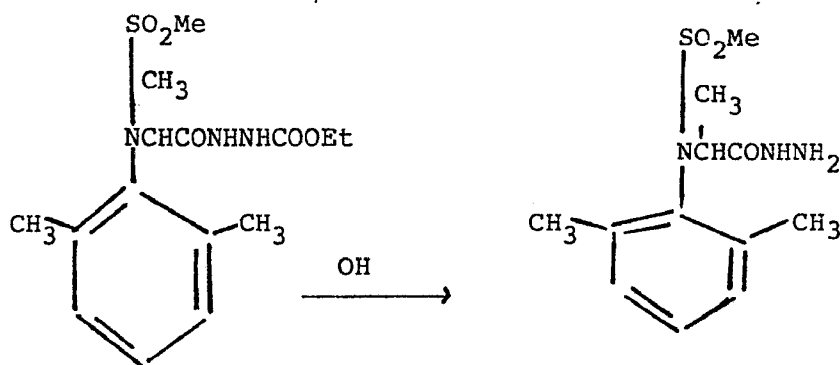
Análisis

Fórmula empírica	C ₁₅	H	N	O ₄	S
Teoría, %	57.48	7.40	4.47	20.42	10.23
Encontrado, %	57.19	7.71	4.21		

Los lavados alcalinos acuosos fueron combinados y acidificados con HCl diluido. El precipitado sólido (9,9g) fue filtrado, lavado con agua, secado e identificado como sulfonanilida recuperada sin reaccionar.

El rendimiento total del éster fue 84,5g (98% basándose en la sulfonanilida.)

Ejemplo 164



Una disolución de N-(1-(2-etoxicarbonil) hidrazinocarbonil) etil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida (5,6g) en etanol (75ml) más una disolución de NaOH al 10% (75ml) fue calentada en un baño de vapor durante 2 1/2 horas y enfriada después. El filtrado fue neutralizado justamente con NaOH diluido, saturado con cloruro sódico, y extraído con cloroformo. La disolución de cloroformo fue secada y evaporada. El residuo dió cristales casi descoloridos de N-(1-(hidrazinocarbonil)etil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida de una disolución en tolueno/petróleo 60-80°. Rendimiento 2,6g (58%). Punto de fusión 115-118°.

Ejemplo 165.

En una prueba standard indicadora de actividad insecticida, se observó 30% de inhibición de acetilcolinesterasa por el compuesto N-(2-(metilcarbamiloximin)propil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida a una concentración micromolar del compuesto igual a 100.

Ejemplo 166

Se añadió una suspensión/disolución al 1% del producto del ejemplo 157 en glicol polietileno (Carbowax 400) a un caldo nutriente de dextrosa para dar una concentración peso/volumen del medio de 1000 partes por millón (ppm). Se diluyó después en tubos de ensayo para obtener una concentración peso/volumen del medio de 200 ppm. A cantidades de 8 ml de caldo se añadieron 0,2ml de un cultivo de caldo denso de la bacteria que causa "brazo negro de algodón", Xantomonas malvacearum.

Al cabo de ocho días de incubación a 25°C, se examinaron todas las muestras de caldo para ver si mostraban señales de desarrollo de bacterias. No se produjo desarrollo alguno, indicando que el compuesto es bacterioestático a este organismo.

Ejemplos 167-169

Un cultivo de una semana de harina de maíz/arena del organismo Pitium ultimum de la enfermedad de putrefacción de humedad, fue mezclado completamente a mano con abono limpio esterilizado John Innes No.1 a razón de 3kg de cultivo por 12 litros de tierra. La tierra infectada fue dejada reposar una 18 horas antes de usarla. Cada uno de los compuestos relacionados abajo fue molido con un agente mojadador, Tween 20 (1% del volumen final), hasta producir una disolución o suspensión fina que fue después diluida con agua destilada para obtener 160 ml de disolución conteniendo 1500, 500, 150 ó 50ppm de ingrediente activo. Se añadieron 15ml alícuotas de esta disolución a porciones de tierra de 75g infectadas con Pitium ultimum contenidas en cajas pequeñas de cartón plástico, de 60mm diámetro x 55mm de altura. Quince semillas de col, de la variedad "flor de primavera", fueron colocadas en una depresión circular en la tierra infectada tratada, recuperadas, y sellado el conjunto con una cubierta de plástico. Las cajas de cartón se colocaron después en una cámara de temperatura constante a 25°C - 1°C. Se hicieron cuatro preparados iguales por cada tratamiento con un tratamiento adicional cuando las semillas estaban sembradas en terreno que estaba tratado sólo químicamente, o sea, que no había infección. Este último tratamiento fue incluido para medir el efecto directo de la sustancia química en la germinación de la semilla. Al cabo de seis días, las cajas de cartón

fueron retiradas de la cámara de temperatura controlada y valoradas para ver el grado de desarrollo fungoso en la superficie del suelo y el porcentaje de germinaciones aparecido. Los resultados de ambas valoraciones se expresan en una escala de 0 a 8, según se indica a continuación:

- 0 = 20% de inhibición
- 1 = 20-34% inhibición
- 2 = 35-44% inhibición
- 3 = 45-54% inhibición
- 4 = 55-64% inhibición
- 5 = 65-74% inhibición
- 6 = 75-84% inhibición
- 7 = 85-94% inhibición
- 8 = 94% inhibición

y vienen dados en el cuadro siguiente:

Ejemplo	producto Compuesto de Ejemplo No.	Dosis pmm	Puntuación Control Micelial	Puntuación Germinación
167	9	300	0	5
		100	0	5
		30	0	1
168	24	100	0	5
		30	0	1
169	26	300	0	4
		100	0	4
		30	0	3
Sin tratar	-	-	0	0

Ejemplos 170-178

Disoluciones o suspensiones de acetona en agua conteniendo 2000 ó 500 mg por litro del compuesto indicado abajo, junto con 125 mg. por litro de un agente mojadador, fueron aplicadas a:

- (A) la tierra que rodea las raíces y las hojas de plantas de arroz que tenían dos hojas completamente extendidas;
- (B) las hojas de plantas de vid con cinco hojas completamente extendidas;
- (C) la tierra que rodea las raíces de las plantas de patatas con siete hojas completamente extendidas;
- (D) Las hojas de plantas de patatas con siete hojas completamente extendidas;
- (E) la tierra que rodea las raíces y las hojas de plantas de cebada con una hoja completamente extendida;
- (F) la tierra que rodea las raíces y hojas de plantas de pepino con dos hojas completamente extendidas.

Las plantas tratadas, junto con testigos tratados con agente mojadador solamente, fueron inoculadas 24 horas después de la aplicación química:

en el caso de (A), con una suspensión acuosa de esporas del organismo de la enfermedad del arroz Piricularia orizae;

en el caso de (B), con una suspensión acuosa de esporangios del organismo de la enfermedad del moho de la vid Plasmopara viticola;

en el caso de (C) y (D), rociando con una suspensión acuosa de esporangios del organismo de la enfermedad de la roya de la patata Fitoftora infestans;

-70-

en el caso de (E), sacudiendo con esporas de la enfermedad del moho de la cebada Erisife graminis; o

en el caso de (F), sacudiendo con esporas del organismo de la enfermedad del moho del pepino Erisife cicoracearum.

Entonces las plantas:

en el caso de (A), fueron colocadas en una atmósfera de 80-100% de humedad a 28°C hasta medir la incidencia de enfermedad siete días después;

en el caso de (B), fueron colocadas en una atmósfera de 80-100% de humedad a 14-18°C hasta medir la incidencia de enfermedad doce días después;

en el caso de (C) y (D), fueron colocadas en una atmósfera de 100% de humedad durante 24 horas, trasladándolas después a una cámara de medio ambiente controlado (18°C y 80-90% de humedad relativa) hasta medir la incidencia de enfermedad 5 días después;

en el caso de (E), fueron transferidas a una cámara de ambiente controlado (18°C y 80-90% de humedad relativa) hasta medir la incidencia de enfermedad 10 días después; o

en el caso de (F), fueron transferidas a una cámara de ambiente controlado (18°C y 80-90% de humedad relativa) hasta medir la incidencia de enfermedad catorce días más tarde.

Se encontró que, en comparación con menos del 5% en los testigos, los tratamientos químicos daban el porcentaje de control indicado en el cuadro siguiente:

Ejemplo	Producto Compuesto del Ejemplo No.	Dosis ppm	Enfermedad	%Control
170	141	2000	arroz	84
171	29	2000	moho vellosa de la vid	98
	"	500	" " " " "	90
172	41	2000	roya de la patata	93
173	132	2000	" " " "	76
	"	500	" " " "	59
174	148	2000	moho polvor de la cebada	89
175	147	2000	" " " " "	96
176	146	2000	" " " " "	92
177	123	2000	" " " " "	95
178	123	2000	moho polvoriento del pepino	92

Ejemplo 179

El producto del ejemplo 95 fue ensayado de acuerdo con el procedimiento de los ejemplos 49-55. Se obtuvieron los resultados siguientes:

Especie	Efecto
Guisantes	15
Mostaza	100
Linaza	25
Centenazo	15
Remolacha	100
Avena	20
Judías	100

-72-

Ejemplos 180-184

Los compuestos relacionados abajo fueron comprobados según el procedimiento del ejemplo 66, pero empleando arroz (Oriza sativa) como especie de ensayo adicional. Los resultados fueron los siguientes;

Ejemplo	Producto compuesto del ejemplo	Trigo	Cebada	Hierba	Arroz
180	85	0	0	90	0
181	131	5	10	90	0
182	137	0	0	80	0
183	150	0	0	80	0
184	156	0	0	90	0

Ejemplo 185

El producto del ejemplo 95 fue ensayado según el procedimiento de los ejemplos 56-60 pero a 130 7 26 prtes por millón de peso/volumen. Los resultados fueron los siguientes:

Especie	Dosis , ppm	
	130	26
Guisantes	30	20
Mostaza	100	90
Linaza	80	0
Maíz	100	50
Avena	100	0
Centanazo	100	90

Ejemplos 186-191

Cada uno de los compuestos relacionados abajo fue formulado como:

5 (I) un polvo de arcilla/arena incorporado al abono John Innes I en una proporción equivalente a 6,5 y 3,25 partes por millón de peso/volumen del ingrediente activo de la tierra y colocado en bandejas de aluminio anodizado de 19 cm x 9,5c, x 5,0 cm de altura. Esto es equivalente aproximadamente a una aplicación superficial de 2,8 y 1,4 kg de 10 ingrediente activo por hectárea cultivada a una profundidad de 5 cm. Las semillas de las especies enumeradas abajo fueron sembradas en la tierra tratada. una especie por bandeja, regadas y colocadas en una cámara de ambiente controlado (22°C; 65-85% de humedad relativa y 14 horas de iluminación 15 artificial a 17.000 lux) durante 21 días.

(II) Una suspensión acuosa junto con 1000 ppm del agente mojadador Lissapol NX. Las superficies de un conjunto 20 adicional de bandejas con semillas ya sembradas fueron entonces rociadas con 2,8 ó 1,4 kg/ha en 450 litros/hectárea, manteniéndose las bandejas en la cámara de ambiente controlado durante 21 días.

Las plantas fueron examinadas entonces visualmente para ver si presentaban algún crecimiento regulador o efectos herbicidas. Todas las diferencias relativas a un testigo 25 sin tratamiento, fueron clasificadas en una escala de 0 a 100, en que 0 significa un efecto nulo, y 100 indica supresión completa.

Los resultados se muestran en la tabla siguiente, donde I representa el caso de incorporación del suelo y II el rociado superficial.

Ejemplo 1922,6-dimetil-etanosulfonamida

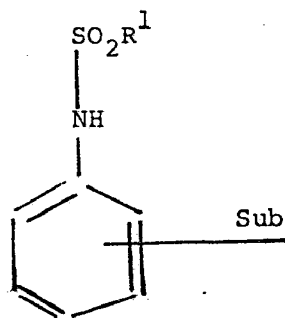
Se añadió cloruro de etanosulfonil (114,4g) lentamente (durante 15 minutos) a una solución agitada de 2,6-dimetil-anilina (110ml) en piridina (500ml). Se dejó que la reacción exotérmica procediera libremente (la temperatura subió a 60°), después la mezcla de la reacción fue hervida bajo reflujo durante tres horas, enfriada y vertida dentro de una mezcla fuertemente agitada (5 litros) de agua, hielo y ácido clorhídrico. El precipitado, marrón, granular, sólido fue recogido por filtración, bien lavado con agua y secado en vacío a 50°. El rendimiento de 2,6-dimetil-etanosulfonamida cruda fue de 152,0g (80%). Su punto de fusión fue 90°.

El producto crudo total fue disuelto en una disolución de hidróxido sódico al 40% (100 ml), diluyendo hasta 2 litros aproximadamente, calentado con carbón vegetal durante 30 minutos y filtrado después. El filtrado claro, amarillo pálido, fue enfriado, añadiéndolo entonces lentamente a una mezcla agitada fuertemente de hielo, agua y ácido clorhídrico. El precipitado, blanco, sólido, fue recogido por filtración, limpiado con agua y secado en vacío a 50°. El rendimiento de material purificado de 92° de punto de fusión 114,7g (60%).

Ejemplos 193-208

Siguiendo procedimientos análogos a los del ejemplo 192, fueron preparadas las siguientes sulfonamidas:

-76-



Ejemplo	R ¹	Sub	Punto de fusión, °
193	metil	2,3-dicloro	102
194	metil	3,4-dimetil	92
195	isopropil	2,6-dimetil	102
196	-CH ₂ COOEt	3,4-dicloro	104
197	metil	2,6-dicloro	-
198	metil	2-cloro-6-metil	94
199	n-butil	2,6-dimetil	-
200	metil	2-etil	40
201	2-tienil	3,4-dicloro	
202	metil	3-cloro-4-fluor	116
203	metil	3-cloro-4-metil	83
204	metil	2-metanosulfoniloxi	121-123
205	metil	2,6-diisopropil	93
206	metil	2-metanosulfoniloxi- 5-nitro	178
207	dimetilamino	2,6-dimetil	-
208	demetilamimo	2-cloro-6-metil	-

Los espectros de Resonancia Magnética Nuclear (RMN) de los compuestos para los que no se da el punto de fusión en la tabla anterior tienen los siguientes valores de tau:

Compuesto del ejemplo	Tau (CDCl ₃)
197	2.5-3.0, 3H, multiplete, (aromático); 3.5, 1H, singlete ancho, (N-H); 6.7, 3H, singlete, (CH ₃)
199	2.95, 3H, singlete, (aromático); 4.2, 1H, singlete ancho, (N-H); 6.8-7.0, 2H, multiplete, (S-CH ₂) 7.65, 6H, singlete, (2,6-diCH ₃) 7.9-8.7, 4H, multiplete, (CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃) 9.1, 3H, triplete, (CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃).
207	2.95, 3H, singlete, (aromático); 3.95, 1H, singlete ancho, (N-H); 7.15, 6H, singlete, (N/H CH ₃ / ₂); 7.6, 6H, singlete, (2,6-diCH ₃).
208.	2.75-3.0, 3H, multiplete, (aromático); 3.8, 1H singlete ancho, (N-H); 7.2, 6H, singlete, (N/CH ₃ / ₂); 7.55, 3H, singlete, (CH ₃).

Ejemplo 209

N-2-oxopropil-4'-cloro-metanosulfonanilida

Una mezcla de 4'-cloro-metanosulfonanilida (10,0g), carbonato potásico anhidro (4.0g), cloroacetona (4,8ml) y 1,2-dimetoxietano

fue agitada y hervida bajo reflujo durante 24 horas, y filtrada después, evaporándose el filtrado. El residuo dió cristales casi descoloridos de acetona/petróleo 40-60°. Punto de fusión 108°. Rendimiento 4,1g.

Ejemplos 210-221

De un modo análogo al ejemplo 209, se prepararon los siguientes:

N-2-oxopropil-2',6'-cloro-6'-metil-metanosulfonanilida,
punto de fusión 96°;

N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida,
punto de fusión 56°;

N-2-oxo-3,3-dimetilbutil-2',6'-dimetil-etanosulfonanilida,
análisis:

Encontrado: C 61.75, H 8.26, N 4.62

$C_{16}H_{25}NO_3S$ requiere: C 61.70, H 8.09, N 4.50;

N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-etanosulfonanilida,
punto de fusión 68°;

N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-1-propanosulfonanilida,
punto de fusión 104°;

N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-2-tiofenosulfonanilida,
punto de fusión 127-128°;

N-2-oxopropil-2',6'-dietil-metanosulfonanilida,
punto de fusión 46°;

N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-1-butanosulfonanilida,
punto de fusión 69°.

N-2-oxopropil-3',4'-dicloro-metanosulfonilida,
punto de fusión 92°;

N-2-oxopropil-3',4'-diisopropil-metanosulfonilida,
punto de fusión 134°;

N-2-oxopropil-2'-metoxi-metanosulfonilida,
punto de fusión 126° y

N-2-oxopropil-2',5'-dicloro-metanosulfonilida,
punto de fusión 134°.

Ejemplo 222

N-(2,2-dimetoxipropil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonilida

A una solución de N-(2-oxopropil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonilida (5,7g) en metanol (80ml) fue añadido ácido 4-toluenosulfónico (0,2g), seguido por ortoformato de trimetilo (6,65ml). La mezcla fue agitada a la temperatura ambiente durante 24 horas, dejándola reposar durante 6 días. La solución fue vertida en una disolución de bicarbonato sódico diluido, y el precipitado sólido fue recogido por filtración, lavado con agua, y secado para obtener un sólido de color blanquecino de punto de fusión igual a 84°. Rendimiento 6,0g.

Ejemplos 223 y 224

De un modo análogo al ejemplo 222, se prepararon los siguientes:

N-(2,2-dimetoxipropil)-4'-cloro-metanosulfonilida,
de punto de fusión 85°; y

N-(2,2-dimetoxipropil)-2',6'-dimetil-metanosulfonilida,
de punto de fusión 82°.

Ejemplo 2254'-cloro-N-((2-metil-1,3-ditiolan-2-il)metil)-metanosulfonanilida

Una solución de 4'-cloro-N-(2,2-dimetoxipropil)-metanosulfonanilida (3,2g) en ácido acético (50ml), fue tratada con etanodiol (0,96ml) y la mezcla fue destilada lentamente, utilizando una columna Vigreux corta, durante 30 minutos, descartando el destilado.. La solución de ácido acético restante fue evaporada, y el residuo fue evaporado de nuevo con tolueno para eliminar las trazas de ácido acético. Una disolución del residuo en éter, depositó al reposar cristales de color rosado. La recristalización del acetato de etilo/éter dio el producto en forma de cristales casi blancos de punto de fusión 114-117°.

Ejemplos 226 y 227

De un modo análogo al ejemplo 225, se prepararon los siguientes:

N-((2-metil-1,3-ditiolan-2-il)metil)-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida, con punto de fusión 108°; y

N-((2-metil-1,3-ditiolan-2-il)metil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonanilida, con punto de fusión 140°.

Ejemplo 228N-((2-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-4'-cloro-metanosulfonanilida

Una mezcla de N-(2-oxopropil)-4'-clorometanosulfonanilida (6,0g), etanol,2-diol (10ml), ácido 4-toluenosulfónico (0,1g) y tolueno (75ml) fue agitada y hervida bajo reflujo con separación de agua por medio de un receptor Dean and Stark. Al cabo de 3 horas la mezcla de reacción fue enfriada y vertida

en agua (unos 200ml) conteniendo unas pocas gotas de disolución de hidróxido sódico. La capa orgánica fue separada, lavada con agua, secada ($MgSO_4$) y evaporada hasta obtener un aceite pardo, que dió cristales color cervato de una solución en tolueno/petróleo $80-100^\circ$. Rendimiento 6,0g (86%). Punto de fusión $84-85^\circ$.

Ejemplos 229-231

De un modo análogo al ejemplo 228, fueron preparados los siguientes:

N-((2-metil-4-hidroximetil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-4'-cloro-metanosulfonanilida, con punto de fusión 118° ;

N-((2-metil-1,3-dioxilan-2-il)metil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonanilida, punto de fusión 84° ; y

N-((2-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida, punto de fusión 58° .

Ejemplo 232

N-2-hidroxiiminopropil-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida

Una disolución de N-(2-oxopropil)-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida (3,0g) en etanol (50ml) fue añadida a una solución de hidrocloreuro de hidroxilamina (0,9g) y acetato sódico (1,1g) disuelta en un volumen de agua mínimo. La disolución fue hervida bajo reflujo durante 3 horas, y después enfriada y evaporada. Una solución del residuo en éter fue lavada con agua, decada ($MgSO_4$) y evaporada. Se volvió a evaporar el residuo con tolueno para eliminar el ácido acético, y después se cristalizó el producto de una disolución de etilo. Punto de fusión $122-124^\circ$.

Ejemplos 233 y 234

Un cultivo de harina de maíz/arena de una semana, del organismo de la enfermedad de putrefacción por humedad Pitium ultimum fue mezclado completamente a mano con abono esterilizado John Innes No. 1 a razón de 3 kg de cultivo por 12 litros de tierra. Esta tierra infectada se dejó reposar durante unas 18 horas antes de su uso. Los compuestos relacionados en la tabla inferior fueron molidos con el agente mojadador Tween 20 (1% del volumen final), hasta producirse una solución o suspensión fina, que fue entonces diluida con agua destilada para dar 160ml de disolución conteniendo 1500 ó 500 partes por millón (ppm) de ingrediente activo. 15ml alícuotas de esta disolución fueron añadidas a porciones de 75 g de la tierra infectada con Pitium ultimum contenidas en pequeñas cajas de cartón plástico, de 60mm de diámetro y 55mm de altura.

Quince semillas de col, de la variedad "flor de primavera", fueron colocadas en una depresión circular en el suelo infectado tratado, recuperadas, y sellado el conjunto con una cubierta plástica. Las cajas de cartón fueron colocadas entonces en una cámara de temperatura constante a 25^o-1^oC. Se hicieron cuatro preparados iguales por tratamiento, con un tratamiento, adicional donde las semillas fueron sembradas en suelo que sólo estaba tratado químicamente, o sea, que no había infección. Este último tratamiento fue incluido para medir el efecto directo de la sustancia química en la germinación de la semilla.

Al cabo de seis días, las cajas de cartón fueron retiradas de la cámara de temperatura controlada y examinadas para ver el grado de crecimiento fungoso en la superficie del suelo y el porcentaje de la germinación.

Los resultados de ambas evaluaciones se expresan en una escala de 0 a 8, como se indica a continuación:

0 = 20% de inhibición	5 = 65 - 74% de inhibición
1 = 20 -34% de inhibición	6 = 75 - 84% de inhibición
2 = 35-44% de inhibición	7 = 85 - 94% de inhibición
3 = 45-54% de inhibición	8 = 94% de inhibición
4 = 55-64% de inhibición	

y se presentan en la tabla que sigue. Cualquier fitotoxicidad inducida por la sustancia química solamente se deduce del tratamiento del suelo por la sustancia química únicamente.

Compuesto	Dosis ppm	Puntuación de control micelial	Puntuación de germinación	Puntuación de fitotoxicidad
N-((2-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-4'-cloro-metano-sulfonanilida	300	8	0	-
N-(2,2-dimetoxi-propil)-2'-cloro-6'-metil-metano-sulfonanilida	300	4	1	0
	100	3	1	0
Sin tratar	0	0	0	

Ejemplo 235 y 236

Soluciones acuosas de acetona de cada uno de los compuestos relacionados en la tabla inferior, conteniendo 2000 partes por

millón (ppm), junto con 125 ppm de un agente mojadador adecuado, fueron aplicados a la tierra que rodea las raíces y hojas de las plantas de vid con conco hojas completamente extendidas.

Las plantas tratadas, junto con testigos tratados con agente mojadador sólo, fueron inoculadas después de 24 horas de la aplicación química con una suspensión acuosa de esporangios del organismo de la enfermedad del moho de la vid, Plasmopara viticola.

Las plantas fueron colocadas después en una atmósfera de 100% de humedad, a 14-18°C hasta medir la incidencia de enfermedad doce días después, encontrándose que los tratamientos habían dado el control fungoso siguiente en comparación con menos del 5% en los testigos.

Compuesto	% Control del moho vellosa de la vid
N-(2,2-dimetoxipropil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonilida	94
N-((2-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonilida	80

Ejemplos 237-239

Soluciones acuosas de acetona de cada uno de los compuestos relacionados abajo, conteniendo 2000, 500 ó partes por millón (ppm) peso/volumen junto con 125 ppm de un agente mojadador adecuado, fueron aplicadas a la tierra que rodea las raíces y hojas de plantas de patata con siete hojas completamente extendidas.

Las plantas tratadas, junto con los testigos tratados con agente mojadador solamente, fueron inoculadas 24 horas después de la aplicación química con una suspensión acuosa de esporangios del organismo de la enfermedad conocida como roya de la patata, Fitofthora infestans.

Las plantas fueron colocadas después en una atmósfera de 100% de humedad / 80% humedad por 24 horas, y después fueron transferidas a una habitación de ambiente controlado (18°C y 80-90 % humedad relativa) hasta que la incidencia de enfermedad fue medida a los cinco días.

Se encontró que los tratamientos habían dado el grado de control de hongo que se demuestra en la tabla siguiente, comparado con menos del 5% en los controles.

Compuesto	Dosis ppm	% control Añublo de patata
N-2-oxopropil-2',6'-dimetil-metano-sulfonanilida	2,000	99
	500	94
	125	90
N-(2,2-dimetoxipropil)-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida	2,000	98
	500	55
N-((2-metil-1,3-dioxolan-2-yl) metil)-2,6'-dimetil-metanosulfon-anilida	2,000	98

Ejemplo 240

Se aplicaron soluciones acuosas de acetona de N-2-oxo-3,3-simetilbutil-2',6'-dimetil-etanosulfonanilida, que contenían

**POOR
QUALITY**

2,000 partes por millón (ppm) peso/volumen conjuntamente con 125 ppm de un agente humectante apropiado, a la tierra alrededor de las raíces y hojas de plantas de arroz que tenían dos hojas totalmente expandidas.

Las plantas tratadas, conjuntamente con los controles tratados con agente humectante solamente, fueron inoculadas con esporas del organismo de enfermedad conocido como añublo de arroz Pyricularia oryzae, 24 horas después de la aplicación química.

Las plantas fueron entonces colocadas en una atmósfera de 100% humedad / 80% humedad, a 28°C, hasta que la incidencia de enfermedad fue medida siete días más tarde, momento en que se encontró que el tratamiento había dado un control de hongo de 80% en comparación con menos de 5% en los controles.

Ejemplo 240

Se aplicaron soluciones acuosas de acetona de N-2-oxo-3,3-dimetilbutil-2',6'-dimetil-etanosulfonanilida, que contenían 2,000 partes por millón (ppm) peso/volumen conjuntamente con 125 ppm de un agente humectante apropiado, a la tierra alrededor de las raíces y hojas de plantas de arroz que tenían dos hojas totalmente expandidas.

Las plantas tratadas, conjuntamente con los controles tratados con agente humectante solamente, fueron inoculadas con esporas del organismo de enfermedad conocido como añublo de arroz Pyricularia oryzae, 24 horas después de la aplicación química.

Las plantas fueron entonces colocadas en una atmósfera de 100% humedad/ 80% humedad, a 28°C, hasta que la incidencia de enfermedad fue medida siete días más tarde, momento en que se encontró que el tratamiento había dado un control de hongo de 80% en comparación con menos de 5% en los controles.

POOR
QUALITY

Ejemplo 241

Se incorporó N-(2-oxopropil)-2'-cloro-6'-metil-metanosulfonilida, formulada como polvo atarcilla/arena, en abono de sembrado John Innes I en una razón equivalente a 130 partes por millón peso/volumen de ingrediente activo a tierra y se colocó en peroles de aluminio anodizado de 19 cm de largo x 9.5 cm de ancho x 5.0 cm de profundidad. Estas razones son equivalentes aproximadamente a una aplicación en superficie de terreno de 56 Kg de ingrediente activo por hectárea cultivada a una profundidad de 5 cm. Las semillas de guisantes, mostaza, linaza, maíz, avena y centenaza fueron sembradas en la tierra tratada y regadas y colocadas en una habitación de ambiente controlado (22°C; 65-85% humedad relativa; 14 horas iluminación artificial a 1300 lux) por 21 días.

Las plantas fueron entonces evaluadas visualmente para efectos herbicidas o reguladores del crecimiento. Todas las diferencias con un control no tratado fueron apuntadas en una escala de 0-100, en donde 0 significa ningún efecto y 100 significa destrucción completa.

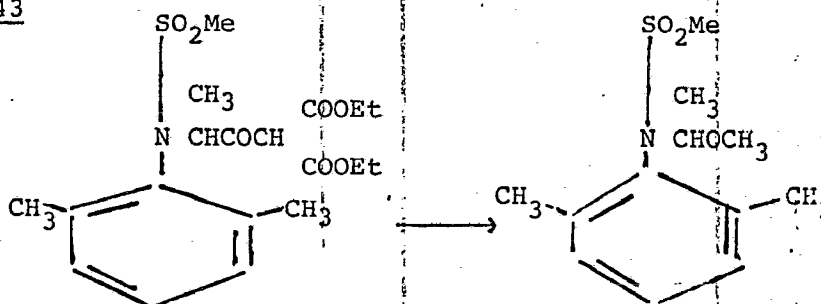
Los resultados se demuestran en la siguiente tabla:

Especies	razón de dosis (ppm)	130
Guisantes	-- (<u>Pisum sativum</u>)	30
Mostaza	-- (<u>Sinapis alba</u>)	100
Linaza	- (<u>Linum usitatissimum</u>)	80
Maíz	- (<u>Zea mays</u>)	5
Avena	- (<u>Avena sativa</u>)	60
Centenaza	- (<u>Lolium perenne</u>)	70

**POOR
QUALITY**

Ejemplo 242

Se añade gota a gota una solución 30% ácido sulfúrico (27.5 ml) a una mezcla agitada de N-(2-oxopropil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida (0.1 mol), cianuro de potasio (6.2 g) y agua (20 ml). Se mantiene la temperatura a 15°. Se agita la mezcla de reacción por 15 minutos y la cianohidrina de la sulfonanilida es aislada.

Ejemplo 243

Se calienta por 2 1/2 horas una mezcla de N-(3,3-di(etoxicarbonil(-2-oxo-1-metilpropil)-2',6'-dimetil-metano sulfon-anilida (0.5 mol), hidróxido de sodio (1.5 mol), etanol (500 ml) y agua (500 ml) y después es enfriada y el etanol evaporado. La solución acuosa resultante es acidificada con ácido clorhídrico y calentada por 1 hora, entonces el producto es aislado.

Ejemplo 244

Se agitó y calentó a 70-80° por 3 horas, una mezcla de 2,6-dimetilmetanosulfonanilida (12.5g), 2'-cloro-4-tiocianoacetanilida (14.2 g), carbonato de potasio (4.3 g) y dimetilformamida (75 ml), y después fue puesta en hielo/agua. El material semi-sólido, viscoso precipitado fue extraído en cloroformo. La solución de cloroformo fue lavada con una solución 5% hidróxido de sodio, lavada con agua y después secada (MgSO4) y evaporada a un aceite marrón. Se filtró una solución de este aceite en cloroformo a través de una columna corta de gel de sílica. La evaporación del eluato dio un aceite marrón que depositó de una solución en etilacetato, cristales casi incoloros de N-((4-tiocianofenil)carbamoil)metil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida. Punto de fusión 152°.

Ejemplo 245

Se dejó estar por 20 horas a temperatura de salón, una solución de N-(3-hidroxi-2-oxopropil)-2',6'-dimetil-metano-sulfonanilida (2.8 g) en piridina (5 ml) y anhídrido acético (5 ml). Se añadió agua para descomponer el exceso de anhídrido, y el producto aceitoso fue extraído en éter. La solución de éter fue lavada sucesivamente con ácido clorhídrico diluido y solución de bicarbonato de sodio, secada (MgSO₄), y evaporada para dar un aceite amarillo. Se filtró una solución de este aceite en cloroformo a través de una columna corta de gel de sílica. La evaporación del eluato dió el producto, N-(3-acetoxi-2-oxopropil)-2',6'-dimetilmtilanosulfonanilida como un aceite amirillo pálido.

Rendimiento 2.5 g (77%)

Análisis: C, 53.20 H, 6.57; N, 4.30%

C₁₄H₁₉NO₅S requiere C, 53.66; H, 6.11; N, 4.47%

Ejemplo 246

Se calentó en un baño de vapor por 2 1/2 horas una solución de N-(-(2-(etoxicarbonil)hidracinocarbonil)etil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida (5.6 g) en etanol (75 ml) y solución hidróxido de sodio 10% (75 ml), y después el etanol fue evaporado de la misma. La solución acuosa restante fue acidificada con ácido clorhídrico diluido, calentada en un baño de vapor por 1 hora, y después filtrada. El filtrado fue entonces neutralizado con solución de hidróxido de sodio diluida, saturado con cloruro de sodio y extraído con cloroformo. La solución de de cloroformo fue secada y evaporada, y el residuo dió cristales incoloros de N-(1- (hidracinocarbonil)etil)-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida, de una solución de tolueno/60-80° petrol. Rendimiento 2.6 g (58%). Punto de fusión 115-118°.

Ejemplo 247

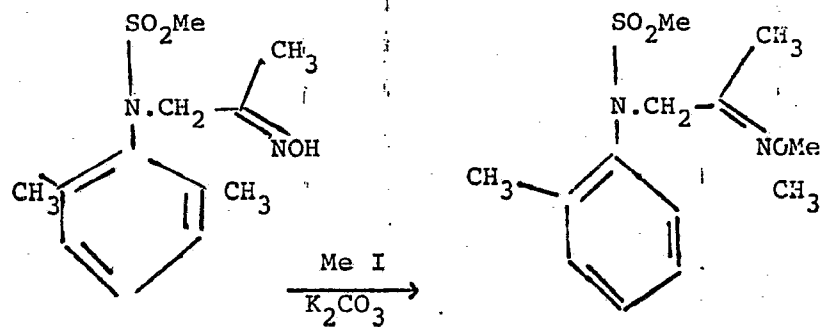
Se calentó hasta hervir, y después se dejó enfriar a temperatura de salón por 2 horas, una solución de la sal de

hidrocloruro de N-(1-(hidracinocarbonil)-etil)-2',6'-dimetilmetanosulfonanilida (3,2g) y acetilacetona (1,0 ml) en etanol (25 ml). El precipitado sólido fue recogido por filtración y recristalizado del etanol para dar N-(3-3,5-dimetil-1-pirazólil)-1-metil-2-oso-etil)-2',6'-dimetilmétanosulfonanilida. Rendimiento 1,5g (43%). Punto de fusión 168°.

Ejemplo 248

Se añadió isocianato de metilo (1,2 ml) a una solución de acetona de N-(2-hidroximinopropil)-2',6'-dimetilmétanosulfonanilida (2,7g) que contenía trietilamina (0.05ml). Se dejó permanecer la mezcla a temperatura de salón durante la noche, y después fue evaporada a un aceite viscoso que solidificó lentamente al dejarse estar. La recristalización con etilacetato/60-80° petrol dió cristales de N-(2-(metilcarbamoiloximino)propil)-2',6'-dimetilmétanosulfonanilida. Rendimiento 3.0g (91%). Punto de fusión 130-134°.

Ejemplo 249



Se agitó e hirvió lentamente bajo reflujo por 3 horas una mezcla de N-(2-hidroximinopropil)-2',6'-dimetilmétanosulfonanilida (2,7g), carbonato de potasio (0,75g), yodometano (1,3 ml) y acetona (50 ml). La mezcla de reacción fue filtrada y el filtrado fue evaporado a un aceite que, con una solución éter/40-60° petrol, depositó cristales. Rendimiento 0,6g (21%). Punto de fusión 126°.

Ejemplo 250

Se añadió acetyl cloruro (0.9 ml) a una solución diclorometano (20 ml) de N-(2-hidroximinopropil)-2',6'-dimetilmetanosulfonnilida (2,6g) y trietilamina (1.6ml). Se agitó e hirvió la mezcla bajo reflujo por 3 horas y después fue filtrada y el filtrado evaporado a un aceite amarillo claro. Se filtró una solución de este aceite en cloroformo a través de una columna corta de gel de sílica y el eluato fue evaporado para dar N-(2-(acetyl-oximino)propil)-2',6'-dimetilmetanosulfonnilida análiticamente pura. Rendimiento 1,9g (63%).

Análisis

Encontrado:	C, 53.74;	H, 6.80;	N, 8.49%
$C_{14}H_{20}N_2O_4S$ requiere:	C, 53.83;	H, 6.45;	N, 8.97%

Ejemplo 251

Se preparó una solución de dietil etoximagnesio malonato mediante reflujo de una mezcla de magnesio (0,9g), dietil malonato (5,6 ml), etanol (4,3 ml) y éter (20 ml) por 3 horas, evaporando después con tolueno y renovando el disolvente con éter seco. A esta solución se añadió gota a gota y agitando, una solución de éter de N-(1-clorocarboniletal)-2',6'-dimetilmetano sulfonnilida (preparada del ácido (10g) y tionil cloruro). Tras permanecer durante la noche a temperatura de salón, el complejo resultante fue descompuesto calentando con ácido sulfúrico diluido. Los productos orgánicos fueron extraídos en éter y la solución fue lavada con agua, secada ($MgSO_4$), y evaporada para dar un residuo sólido. La recristalización en etil acetato dió cristales incoloros de N-(3,3-di(etoxicarbonil)-2-oxo-1-metilpropil)-2',6'-dimetilmetanosulfonnilida. Punto de fusión 125° .

Ejemplo 252

Se calentó hasta hervir y agitando una solución de N-(1-etoxicarboniletíl)-2'-trifluorometil-4'-feniltio-metano-sulfonamida (7,5 g) en ácido acético (50 ml) y se añadió peróxido de hidrógeno (6 ml de 100 vols). Se continuó agitando e hirviendo bajo reflujo por 3 horas, entonces la mezcla de reacción fue puesta en hielo/agua y extraída con cloroformo. La solución de cloroformo fue secada y evaporada a un aceite amarillo que en solución de etanol dió cristales incoloros de N-(1-etoxicarboniletíl)-2'-trifluorometil-4'-fenilsulfonil-metanosulfonamida. Rendimiento 6,6 g (83%). Punto de fusión 121°.

Ejemplo 253

Se trató con tionil cloruro (5 ml) una solución de N-carboximetil-2',6'-dimetil-metano-sulfonamida (7,2 g) en cloroformo (50 ml) y la mezcla fue hervida bajo reflujo por 1 1/2 horas y evaporada después. El residuo fue re-evaporado con tolueno (para remover trazas del tionil cloruro), y entonces fue disuelto en tetrahidrofuran seco (10 ml). Se añadió el tris-trimetilsililoxietileno (19,6 g) y a continuación cloruro estánico (3 gotas). Se dejó permanecer la mezcla de reacción a temperatura de salón por 70 horas, y entonces fue calentada en un baño de vapor por 2 horas y puesta después en una mezcla de volúmenes iguales de ácido clorhídrico diluido y tetrahidrofuran. Esta solución fue calentada en un baño de vapor por 1/2 hora, saturada con sal, y extraída con éter. La solución combinada de éter fue lavada con solución de bicarbonato de sodio, secada (H_2SO_4) y evaporada para dar el producto, N-(3-hidroxi-2-oxopropil)-2',6'-dimetil-metano-sulfonamida, en forma de un aceite amarillo claro. Rendimiento 5,0 g (66%).

30
30109

POOR
QUALITY

Análisis:

C, 57,72; H, 6,40; N, 4,91%

$C_{12}H_{17}NO_4S$ requiere: C, 53,12; H, 6,32; N, 5,16%

Ejemplo 254

Siguiendo un procedimiento análogo al del Ejemplo 253, se preparó N- (3-hidroxi-2-oxo-1-metilpropil)-2',6'-dimetil-metanosulfonanilida. Punto de fusión 125-126°.

Ejemplos 255 y 256

En forma similar a los Ejemplos 193-208, se preparó 2',6'-dimetil-4-morfolinosulfonanilida, punto de fusión 124°, y 3',4'-dicloro-4-morfolinosulfonanilida, punto de fusión 122°.

Ejemplos 257-259

En forma similar al Ejemplo 3, se prepararon los siguientes ésteres de fórmula dada en los Ejemplos 4-33:

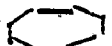

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
257	n-Pr	Me	COOCH ₂ -	2,6-diMe	Aceite
257a	Me	H	CH=CHCOOEt	2-Cl,6-Me	70°
258	Me	Me	COOEt	3,5-diCl	92°
259	Me	Me	COOMe	3,5-diCl	110°

El análisis para el compuesto del Ejemplo 257 es como sigue:

Encontrado: 60,63% C, 7,00% H, 3,69% N;
 $C_{19}H_{25}NO_5S$ requiere: 60,14% C, 6,64% H, 3,69% N.

Ejemplos 260 y 261

En forma similar al Ejemplo 34, se prepararon los siguientes compuestos de fórmula dada en los Ejemplos 35-43.

Ejemplo	R ¹	R ¹⁸	A	Sub	Punto de fusión
260	Me	H	CON  O	2,6-diMe	109°
261	Me	Me	CON  O	3,5-diCl	210°

Ejemplo 262

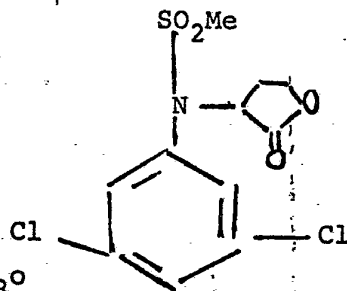
En forma similar al Ejemplo 209, se preparó N-(2-oxopropil)-3',5'-dicloro-metanosulfonanilida, punto de fusión 106°.

Ejemplo 263

En forma similar al Ejemplo 44, se preparó N-(3-cianopropil)-3',5'-dicloro-metanosulfonanilida, punto de fusión 82°.

Ejemplo 264

En forma similar al ejemplo 123, se preparó la lactona



punto de fusión 128°.

POOR
QUALITY

Ejemplo 265

En forma similar al Ejemplo 85, se preparó N-(tiocarbam-
oilmetil)-3',5'-dicloro-metanosulfonanilida, punto de fusión
188°.

Ejemplo 266

Se preparó un concentrado emulsionable 40% peso/volumen,
haciendo una solución de xileno de lo siguiente:

N-(1-(etoxicarbonil)etil)-2',6'-dimetil-1-propano- sulfonanilida	400g
Arilan CA (dodecibencenosulfonato de calcio 70% en butanol)	25g
Etilan C4OAH (aceite de castor/condensado de óxido de etileno)	25g
Xileno (a un litro)	aprox 600 ml

Ejemplo 267

Se preparó un concentrado emulsionable 25% peso/volumen,
haciendo una solución de xileno de lo siguiente:

N-(1-(etoxicarbonil)etil)-2',6'-dimetil- etanosulfonanilida	250g
Arilan CA	25g
Etilan C4OAH	25g
Xileno (a un litro)	aprox 740 ml

Ejemplo 268

Se ensayó N-(2-oxopropil(-3',4'-dimetil-metanosulfonanilida
a una razón de dosis de 300 ppm en el ensayo descrito en los
Ejemplos 233 y 234. Esta dió un índice de control micelial de 0

**POOR
QUALITY**

y un índice de germinación de 3, mientras que las muestras no tratadas dieron un índice de 0 para ambos.

Ejemplos 269-271

Los compuestos enumerados a continuación fueron ensayados en el ensayo descrito en los Ejemplos 170-178, con los siguientes resultados:

Ejemplo	Compuesto	Razón pm	Enfermedad	% Control
269	Producto del Ejemplo 46	2000	añublo de patata	56
270	N-(2-oxopropil)-3', 4'-dimetil-metano- sulfonanilida	2000	añublo de arroz	67
	"	2000	moho polvoriento de cebada	99
	"	2000	añublo de patata	62
271	Producto del Ejemplo 249	500	añublo de patata	74
	"	500	añublo de arroz	65

Ejemplo 272

En forma similar al Ejemplo 209, se preparó N-(2-oxopropil)-3',4'-dimetil-metanosulfonanilida, punto de fusión 78°.

1

REIVINDICACIONES

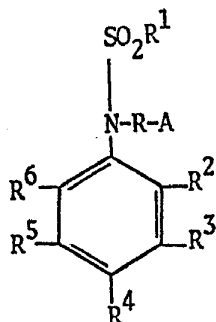
5

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

10

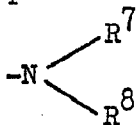
1ª.- Un procedimiento para preparar una sulfonamida de la fórmula

15



20

o una de sus sales, en donde R^1 representa alquilo, alquilo sustituido, cicloalquilo, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, un grupo heterocíclico, un grupo heterocíclico sustituido, o un grupo de la fórmula



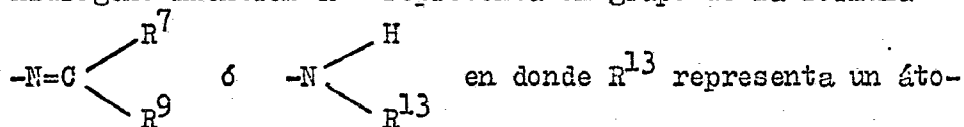
25

cada uno representa un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralquilo sustituido, arilo o arilo sustituido; R representa alquilenos o alquilenos; A representa

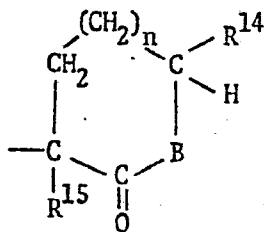
30

-COOH; -CSSH; -GECR⁹; -CEVR^{10,11}; $-\overset{O}{\parallel}C-O-N=C \begin{array}{l} \diagup R^7 \\ \diagdown R^9 \end{array}$;

1 -CN; ó -COR¹² o un derivado carbonílico o un compuesto de
 adición del mismo; en donde E y G son iguales o diferentes
 y cada uno representa un átomo de oxígeno o de azufre; R⁹
 5 representa alquilo, alquilo sustituido, aralquilo, aralqui-
 lo sustituido, arilo o arilo sustituido; R¹⁰ y R¹¹ son igua-
 les o diferentes y cada uno representa un grupo como se ha
 definido para R⁷; o R¹⁰ y R¹¹ junto con el átomo de nitró-
 geno al que están unidos forman un grupo heterocíclico o un
 grupo heterocíclico sustituido; o R¹⁰ representa un átomo de
 10 hidrógeno mientras R¹¹ representa un grupo de la fórmula

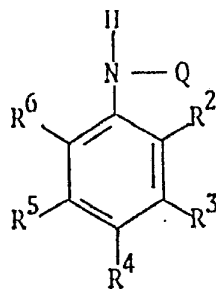


mo de hidrógeno o -COOR⁹; y R¹² representa un átomo de hi-
 15 drógeno, alquilo, alquilo sustituido, cicloalquilo, aral-
 quilo, aralquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, un
 grupo heterocíclico unido por un átomo de carbono en el gru-
 po o tal grupo heterocíclico que está sustituido; o R-A re-
 presenta un grupo de la fórmula



20 en donde R¹⁴ representa un átomo de hidrógeno, alquilo o
 arilo, B representa un átomo de oxígeno o -NR¹⁵, en donde
 25 R¹⁵ representa un átomo de hidrógeno o alquilo, y n repre-
 senta 0, 1 ó 2; y R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son iguales o diferen-
 tes y cada uno representa un átomo de hidrógeno; alquilo;
 30 alquilo sustituido; hidroxí; alcoxi; -SCN; nitro; halógeno;

1 amino; amino sustituido; mercapto; un grupo de la fórmula
 2 -SR¹⁶, -SOR¹⁶, -SO₂R¹⁶ o -OSO₂R¹⁶ en donde R¹⁶ representa
 3 alquilo, arilo o aralquilo; -SO₂NR⁷R⁸; ó -COOR¹²; con la
 4 condición de que R², R³, R⁴ y R⁵ no representan cada uno
 5 un átomo de hidrógeno cuando R⁶ representa un átomo de hi-
 6 drógeno, metoxicarbonilo o etoxicarbonilmetilo, R represen-
 7 ta alquileo, R¹ representa fenilo o fenilo sustituido, y A
 8 representa benzoilo, COOH ó COOR⁹ en donde R⁹ representa
 9 alquilo, procedimiento que está caracterizado por hacer
 10 reaccionar un derivado de arilamino de la fórmula:



15 o una sal del mismo, en donde Q representa -SO₂R¹ o -R-A,
 con un agente que es de la fórmula X-R-A cuando Q represen-
 20 ta -SO₂R¹, y que es de la fórmula R¹SO₂X o R¹(SO₂)₂O cuando
 Q representa -R-A, en donde X representa un átomo de haló-
 geno y A, R, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se han defi-
 nido anteriormente.

25 2a.- Un procedimiento para preparar una sulfonani-
 lida.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que ante-
 cede y con los fines que se han especificado.

1

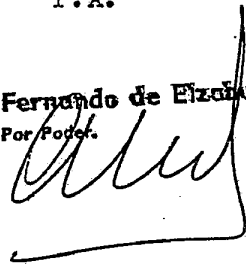
Esta Memoria consta de CIENTO hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 01 JUN 1979

P.A.

5

Fernando de Elizaburu
Por Poder.



10

15

20

25

30
30059
VAL