

ES

(11) NUMERO
481.024
(22) FECHA DE PRESENTACION
29 de Mayo 1.979

AI

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

MNL



ESPAÑA

PATENTE DE INVENCION

(30) PRIORIDADES:	(32) FECHA	(33) PAIS
(31) NUMERO		
910.965	30-5-78	U.S.A.
965.070	30-11-78	"
015.341	1-3-79	"
029.281	13-4-78	"

(4) FECHA DE PUBLICIDAD	(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL E07C 143/60//A01N 9/16	(62) PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
-------------------------	--	--

(14) TITULO DE LA INVENCION
PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE ARILSULFONAMIDAS.

(71) SOLICITANTE (S)
E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
Wilmington, Delaware 19898 ESTADOS UNIDOS

(72) INVENTOR (ES)
George Levitt, de nacionalidad estadounidense.

(73) TITULAR (ES)

(74) REPRESENTANTE
D. BERNARDO UNGRIA GOIBURU

1

RESUMEN DE LA INVENCION

Las N-(heterociclo-aminocarbonil)arilsulfonamidas donde el radical arilo está sustituido en la posición 2 con un radical carboxi, o éster, tioéster o amida del mismo, v.g. N-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida o N-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida, son útiles para regular el crecimiento de las plantas y como herbicidas de pre-emergencia y post-emergencia.

5

10

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Esta invención se refiere a nuevas N-(heterocicliil-aminocarbonil)arilsulfonamidas donde el radical arilo está sustituido con un radical carboxilo o un éster, tioéster o amida del mismo. Los compuestos de esta invención y sus sales agrícolamente adecuadas son útiles como productos químicos agrícolas, v.g. como reguladores del crecimiento de las plantas y herbicidas.

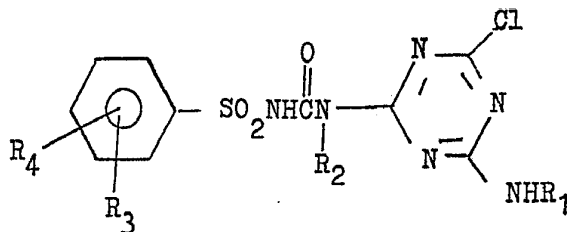
15

20

En la patente holandesa 121.788, publicada el 15 de Septiembre de 1966, se describe la preparación de compuestos de la siguiente fórmula y su empleo como herbicidas generales o selectivos:

25

1



5

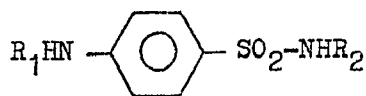
donde

R₁ y R₂ pueden ser independientemente alquilo de 1 a 4 átomos de carbono y

R₃ y R₄ pueden ser independientemente hidrógeno, cloro o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

10

En la patente estadounidense 3.637.366 se describen compuestos de fórmula:



15

donde

R₁ es hidrógeno o acilo alifático saturado inferior y R₂ es hidrógeno, 2-pirimidinilo, piridilo, amidino, acetilo o carbamóilo.

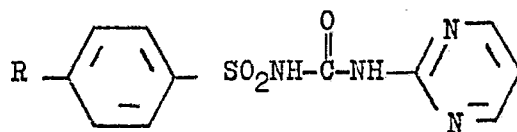
20

Se indica que los compuestos descritos controlan el garranchuelo, el berro, la endivia, el trébol y la Poa annua.

En la patente francesa n° 1.468.747 se describen las siguientes fenilsulfonamidas para-sustituídas como agentes antidiabéticos útiles:

25

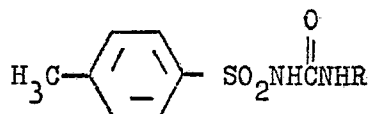
1



donde R es H, halógeno, CF_3 o alquilo.

5

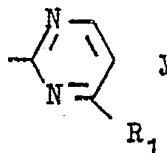
Logemann y colaboradores, *Chem. Abs.*, 53, 18052 g (1959) describen varias sulfonamidas, incluidos los derivados de uracilo y las de fórmula:



10

donde

R es butilo, fenilo o



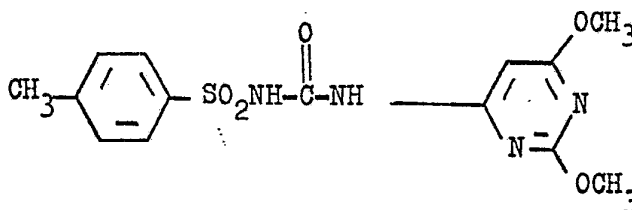
R_1 es hidrógeno o metilo.

15

Cuando se determinó el efecto hipoglucémico en ratas (dosis orales de 25 mg/100 g), los compuestos donde R es butilo y fenilo resultaron los más potentes. Los otros eran de poca potencia o inactivos.

20

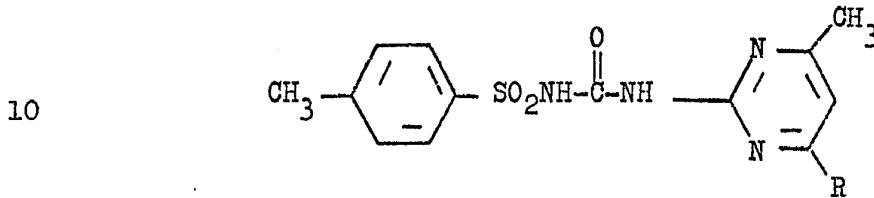
Wojciechowski, *J. Acta. Polon. Pharm.* 19, pág. 121-125 (1962) (*Chem. Ab.*, 59. 1633 e) describe la síntesis de N-[(2,6-dimetoxipirimidin-4-il)aminocarbonil]-4-metilbencenosulfonamida:



25

1 Basándose en la similitud con un compuesto conocido, el
autor suponía que el compuesto anterior podía presentar
actividad hipoglicémica.

5 Las pirimidinil(sustituído)sulfonilureas de la si-
guiente fórmula, que también están sustituidas en la posi-
ción para del anillo fenílico, están descritas en Farmco
Ed.Sci., 12, 586 (1957) [Chem.Ab., 53, 18052 g (1959)]:



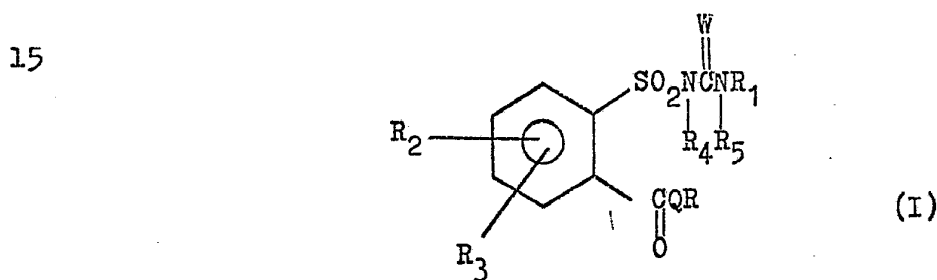
donde R es H o CH₃.

15 La presencia de vegetación indeseable produce impor-
tantes daños a los cultivos útiles, especialmente a los
productos agrícolas que satisfacen las necesidades básicas
del hombre de alimentos y fibras, como algodón, arroz,
maíz, trigo y similares. La explosión demográfica actual
y la consiguiente escasez mundial de alimentos y fibras
20 exige mejoras en la eficacia de producción de estos cul-
tivos. La prevención o reducción de las pérdidas de una
parte de estos valiosos cultivos por destrucción o inhibi-
ción del crecimiento de la vegetación indeseable es una
forma de aumentar esta eficacia. Existe una amplia varie-
25 dad de materiales útiles para destruir o inhibir (contro-

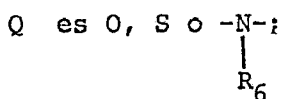
1 lar) el crecimiento de la vegetación indeseable; estos
materiales son normalmente denominados herbicidas. Sin
embargo, todavía existe la necesidad de herbicidas más
eficaces.

5 COMPENDIO DE LA INVENCION

De acuerdo con esta invención, se proporcionan nue-
vos compuestos de Fórmula I y sus sales agrícola-mente ade-
cuadas, v.g. sales de sodio, potasio, alquilamonio y áci-
do tricloroacético, composiciones agrícolas adecuadas que
10 contienen estos compuestos y métodos de utilización de los
mismos como herbicidas generales o selectivos de pre-emer-
gencia y post-emergencia y como reguladores del crecimen-
to de las plantas:



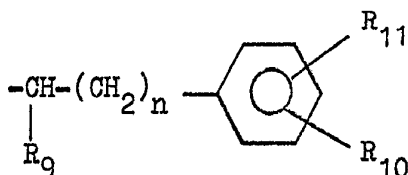
20 donde



cuando Q es O o S, entonces R es alquilo C₁-C₁₂;
alqueno C₃-C₁₀; alquilo C₂-C₆ sustituido con 1
25 a 4 sustituyentes seleccionados entre 0-3 átomos de

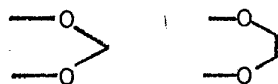
1 F, Cl, o Br, 0-2 grupos metoxi y 0-1 grupos ciano;
-CH₂CN; -CH₂CO₂CH₃; -CH₂CO₂C₂H₅; alqueno C₃-C₆
sustituído con 1-3 átomos de F, Cl o Br; cicloalqui-
lo C₅-C₈; cicloalqueno C₅-C₈; cicloalquilo C₅-C₆
5 sustituído con 1 a 4 de cualquiera de los grupos me-
tilo, OCH₃, alquilo C₂-C₄, F, Cl o Br; cicloalqui-
alquilo C₄-C₁₀; cicloalquilalquilo C₄-C₈ sustituído con
1-2 CH₃; bicicloalquilo C₇-C₁₀; bicicloalqueno
C₇-C₁₀; tricicloalquilo C₁₀; tricicloalqueno C₁₀;

10



15

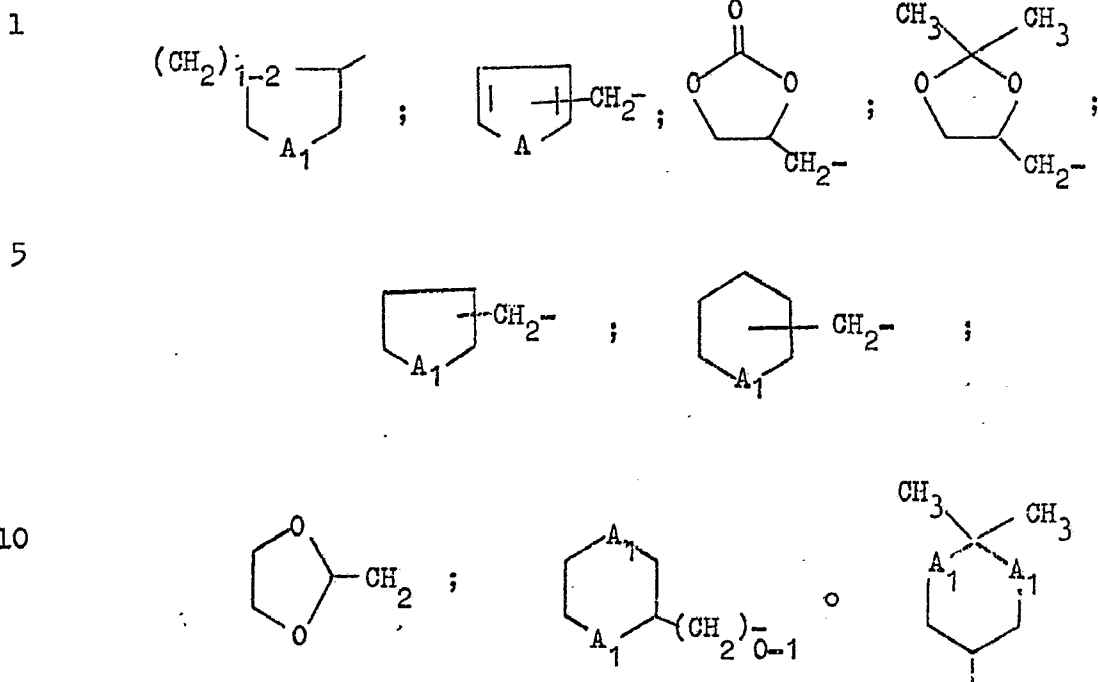
donde R₉ es alquilo C₁-C₃ o hidrógeno y R₁₀ y R₁₁
son independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃,
Cl, Br, -OCH₃ o -OC₂H₅ o bien R₁₀ y R₁₁ pueden estar
unidos para formar un anillo de 5 o 6 miembros:



20

y n es 0, 1, 2 o 3, con la condición de que el nú-
mero total de átomos de carbono sea igual o inferior
a 12;

25



donde

15

A es O o S;

A₁ es O, S o SO₂;

cuando Q es 0, entonces R es H, M, -CH₂CH₂OR₇,

-CH₂CH₂CH₂OR₇, -CH(CH₃)CH₂OR₇ donde R₇ es -CH₂CH₃,

20

-CH(CH₃)₂, fenilo, -CH₂CH₂Cl o -CH₂CCl₃;

-(CH₂CH₂O)_{n'}-R₈, -(CH(CH₃)CH₂O)_{n'}-R₈ donde R₈ es -CH₃,

-CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, fenilo, -CH₂CH₂Cl o -CH₂CCl₃

25

y n' es 2 o 3; con la condición de que el número total de átomos de carbono en R es igual o inferior

1

a 13; $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\underset{\text{(O)}_{0,2}}{\text{S}}-\text{R}_{12}$ y $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\underset{\text{(O)}_{0,2}}{\text{S}}-\text{R}_{12}$, donde

R_{12} es CH_3 , $-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ o fenilo; y cuando Q es $-\underset{\text{R}_6}{\text{N}}-$, entonces R es hidrógeno; alquilo

5

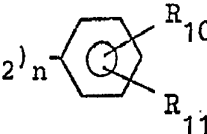
C_1-C_{12} ; $-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{n'''}-\text{R}_{12}$ y $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_{12}$, donde R_{12} es el definido anteriormente y n''' es 1-3; alqueno C_3-C_{10} ; cicloalquilo C_3-C_8 ; cicloalqueno C_5-C_6 ; cicloalquilo C_5-C_8 sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados entre 0-2 grupos

10

OCH_3 , 0-3 grupos $-\text{CH}_3$ o $-\text{C}_2\text{H}_5$; trifluormetilciclohexilo; cicloalquilalquilo C_4-C_{10} ; cicloalquilalquilo C_4-C_8 sustituido con 1-2 grupos $-\text{CH}_3$;

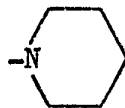
15

$-\text{CH}_2\text{CN}$; $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$; $-\underset{\text{CH}_3}{\overset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-\text{CN}$; $-\text{OCH}_3$; $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$;

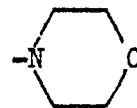
$-\underset{\text{R}_9}{\text{CH}}(\text{CH}_2)_n$  donde n, R_9 , R_{10} y R_{11} son

20

los definidos anteriormente;



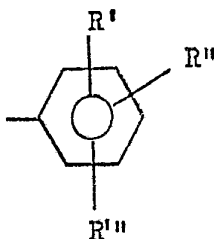
;



;

25

1



5

donde R' es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, -OCH₃, F, Br, Cl, -CF₃, CN, NO₂, -SO₂CH₃, -SCH₃ o -N(CH₃)₂; R'' es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, -OCH₃, F, Br o Cl; R''' es hidrógeno, -CH₃, Cl, F o Br;

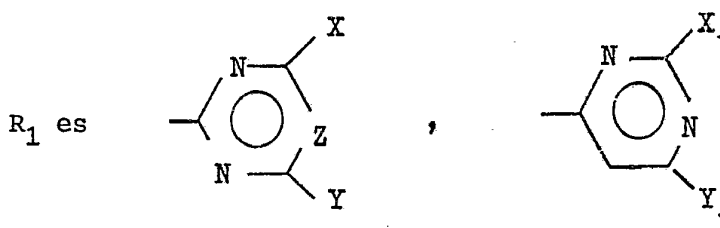
10

R₆ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alilo, -CH₂CN o -CH₂CH₂CN; o bien R₆ y R pueden estar unidos para formar un grupo -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH₂)₆-, -CH₂CH₂OCH₂CH₂- o -CH₂CH₂N(CH₃)CH₂CH₂-; con la condi-

15

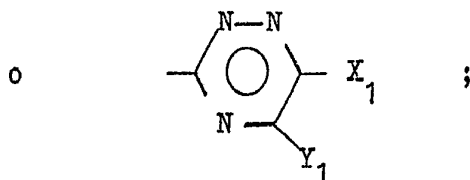
ción de que cuando R es -OCH₃, entonces R₆ es -CH₃; cuando R₆ es -CH₂CH₂CN o -CH₂CN, entonces R es -CH₂CH₂CN o CH₂CN; y R y R₆ tienen en total un número de átomos de carbono igual o inferior a 13;

20



25

1



5

R₂ es H, Cl, Br, F, alquilo C₁-C₃, -NO₂, -SO₂CH₃,
-OCH₃, -SCH₃, -CF₃, -N(CH₃)₂, -NH₂ o -CN;

R₃ es H, Cl, Br, F o CH₃;

R₄ es H o -CH₃;

R₅ es H, -CH₃ o -OCH₃;

10

M es un metal alcalino;

W es oxígeno o azufre;

X es H, Cl, -CH₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃ o -OCH₂CH₂OCH₃;

Y es H; Cl; alquilo C₁-C₄; alquilo C₁-C₄ sustituido
con -OCH₃, -OC₂H₅, -CN, -CO₂CH₃, -CO₂C₂H₅ o 1 a

15

3 átomos de F, Cl o Br; alqueno C₃-C₄; -CH₂C=CR₁₃,
donde R₁₃ es H, -CH₃ o -CH₂Cl; -A-(CH₂)_n-A₁-(al-
quilo C₁-C₃) y n', A y A₁ son los definidos ante-

20

riormente; -ACH₂ $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C-L; -ACH $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C-L; -ACH₂CH₂ $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C-L, donde
|
CH₃

L es -NH₂, -NCH₃, -NH(alquilo C₁-C₄), -N(alquilo
|
OCH₃

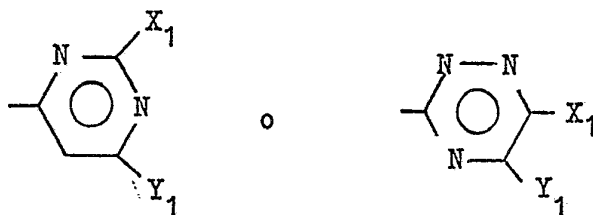
25

C₁-C₄)₂ o alcoxi C₁-C₆; SCN; -N₃; NR₁₆R₁₇, donde
R₁₆ es H o CH₃ y R₁₇ es H, -OCH₃, alquilo C₁-C₄,
alquilo C₁-C₄ sustituido con -CN, -CO₂CH₃ o

1 CO₂C₂H₅, alquenilo C₃-C₄ o alquilo C₂-C₃ susti-
tuído con -OCH₃ o -OC₂H₅; o bien R₁₆ y R₁₇ pue-
den estar unidos para formar un grupo -CH₂CH₂CH₂CH₂-
o -CH₂CH₂OCH₂CH₂-; -O-R₁₄, donde R₁₄ es alquilo
5 C₁-C₄, alquilo C₂-C₄ sustituido con 1-3 átomos de
F, Cl o Br, alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano o
alquenilo C₃-C₄; -CH₂C≡CR₁₃, donde R₁₃ es el defi-
nido anteriormente; -CH₂◻ ; o -SR₁₅ donde R₁₅
es alquilo C₁-C₄ o alquilo C₁-C₂ sustituido con
10 CN, alilo o propargilo; con la condición de que
cuando Y contiene un número de átomos de carbono
igual o superior a 4, R contiene un número de áto-
mos de carbono igual o inferior a 4; cuando X es
Cl, entonces Y es Cl y cuando X e Y son ambos H,
15 entonces R contiene un número de átomos de carbono
igual o inferior a 4; y Z es CH ó N.

Y₁ es H, -OCH₃ o -CH₃;

X₁ es H, Cl, -OCH₃, -OCH₂CH₃ o -CH₃; con la condi-
ción de que X₁ e Y₁ no son ambos simultáneamente
20 hidrógeno y cuando R₁ es



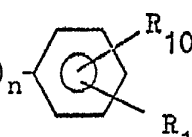
entonces R₄ y R₅ son ambos H y R contiene un número

1 de átomos de carbono igual o inferior a 5.

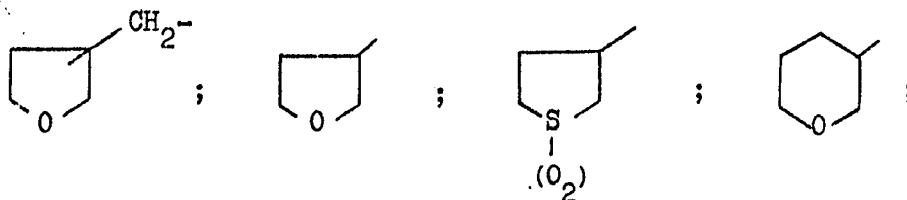
Son compuestos más preferidos los siguientes:

2. Un compuesto de la fórmula genérica donde R_4 y R_5 son H, W es O y el átomo de carbono de R enlazado a Q también está enlazado por lo menos a un átomo de hidrógeno.

3. Un compuesto del grupo preferido 2. donde R_2 es H, Cl, Br, F, alquilo C_1-C_3 , $-NO_2$, $-OCH_3$, $-SCH_3$, $-SO_2CH_3$, $-CF_3$, $-N(CH_3)_2$, $-NH_2$ o $-CN$ y R es H y se encuentra en posición para con respecto al grupo sulfonilo.

4. Un compuesto del grupo 3. preferido donde Q es O o S y R es alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_3-C_6 , alquilo C_2-C_4 sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados entre 0-3 átomos de F o Cl, 0-2 grupos $-OCH_3$ o 0-1 grupos CN; CH_2CN ; alquenilo C_3-C_4 sustituido con 1-3 átomos de Cl; cicloalquilo C_5-C_6 ; cicloalquenilo C_5-C_6 ; cicloalquilo C_5-C_6 sustituido con uno cualquiera de hasta cuatro grupos metilo, metoxi, C_2H_5 o cloro; cicloalquilalquilo C_4-C_7 ; $-CH(R_9)(CH_2)_n$  R_{10} R_{11} donde R_9 es H o $-CH_3$; n es 0 o 1; R_{10} y R_{11} son independientemente H, $-CH_3$, Cl, $-OCH_3$,

25



1



5

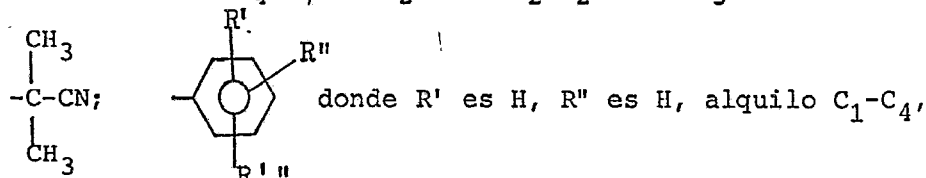
5. Compuestos del grupo 3. preferido donde Q es O y R es H, M, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_7$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OR}_7$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_7$ donde

R_7 es el definido anteriormente, $-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2-\text{R}_8$ o $-(\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O})_2\text{R}_8$ donde R_8 es alquilo C_1-C_3 o $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$.

10

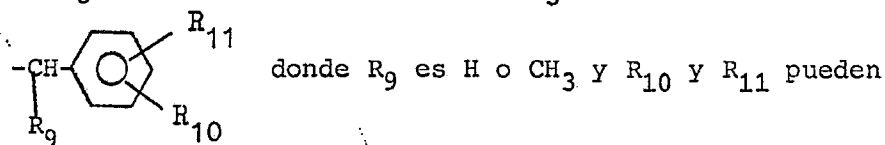
6. Compuestos del grupo 3. preferido, donde Q es $-\text{NR}_6-$ y R es H, alquilo C_1-C_6 , $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_{12}$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_{12}$ donde R_{12} es el definido anteriormente, alqueno C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalqueno C_5-C_6 , cicloalquilo C_6 sustituido con uno cualquiera de 1-2 grupos $-\text{OCH}_3$ o 1-3 grupos $-\text{CH}_3$ o $-\text{C}_2\text{H}_5$; trifluorometilciclohexilo; cicloalquilalquilo C_4-C_7 ; $-\text{CH}_2\text{CN}$; $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$; $-\text{OCH}_3$;

15



20

$-\text{OCH}_3$, F, Br o Cl y R''' es H, $-\text{CH}_3$, Cl, F o Br;



25

ser independientemente H, CH_3 , Cl, u OCH_3 ; R_6 es H, alqui-

1 lo C₁-C₃, -CH₂CN, -CH₂CH₂CN o -CH₂CH=CH₂ y R₆ y R pueden estar unidos para formar un grupo -CH₂CH₂CH₂CH₂-,
-CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂- o -CH₂CH₂OCH₂CH₂-.

5 7. Compuestos del grupo 3. preferido donde X es CH₃, OCH₃ u OC₂H₅ e Y es H, alquilo C₁-C₄; alquilo C₁-C₂ sustituido con -OCH₃, -OC₂H₅, -CN, -CO₂CH₃, -CO₂C₂H₅ o 1 a 3 átomos de F o Cl; alqueno C₃-C₄; -OCH₂CO₂(alquilo C₁-C₄); -OCHCO₂(alquilo C₁-C₄); -OCH₂CH₂CO₂(alquilo C₁-C₄);
|
CH₃

10 -OCH₂CH₂O(alquilo C₁-C₃); -OCH₂CH₂CH₂O(alquilo C₁-C₃);
OR₁₄ donde R₁₄ es alquilo C₁-C₄, alquilo C₂-C₃ sustituido con 1-3 átomos de F o Cl, alquilo C₁-C₃ sustituido con CN,
o alqueno C₃-C₄; -SCH₃; -SC₂H₅; -NR₁₆R₁₇ donde R₁₆ es H o CH₃ y R₁₇ es alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ sustituido con
15 -CN, alquilo C₂-C₃ sustituido con -OCH₃ o -OC₂H₅ o alqueno C₃-C₄ y X₁ e Y₁ son los definidos anteriormente.

8. Compuestos del grupo 7. preferido donde -QR es el definido en el grupo 4. preferido.

20 9. Compuestos del grupo 7. preferido donde Q-R es el definido en el grupo 5. preferido.

10. Compuestos del grupo 7. preferido donde -QR es el definido en el grupo 6. preferido.

25 11. Compuestos de los grupos 8., 9. o 10. preferidos, donde R₂ es H. Cl o -CH₃.

12. Compuestos del grupo 11. preferido, donde Q es O


1 o S y R es alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquilo C₂-C₃ sustituido con -OCH₃, Cl o CN; CH₂CN; alqueno C₃ sustituido con 1-3 átomos de Cl; cicloalquilo C₅-C₆; ciclohexeno, ciclohexilo sustituido con 1-3 grupos -CH₃, o

5
$$-\text{CH}(\text{CH}_2)_n \begin{array}{c} \text{R}_{11} \\ \diagup \\ \text{C}_6\text{H}_4 \\ \diagdown \\ \text{R}_{10} \end{array} \quad \text{donde } \text{R}_9 \text{ es H o CH}_3, n \text{ es 0 o 1 y}$$

$$\text{R}_{10} \text{ y } \text{R}_{11} \text{ son independientemente } -\text{CH}_3, -\text{OCH}_3 \text{ o Cl.}$$

10 13. Compuestos del grupo 11. preferido, donde Q es O y R es H, M, -CH₂CH₂OR₇ donde R₇ es -C₂H₅, -CH(CH₃)₂, fenilo o -CH₂CH₂Cl, y
$$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5.$$

15 14. Compuestos del grupo 11. preferido, donde Q es -NR₆-, R₆ es H, -CH₃ o -C₂H₅ y R es alquilo C₁-C₄, -CH₂CH₂OCH₃, -CH₂CH₂OC₂H₅, alqueno C₃-C₄, cicloalquilo C₅-C₆, ciclohexeno sustituido con 1-3 grupos -CH₃,
$$\begin{array}{c} \text{R}' \\ | \\ \text{C}_6\text{H}_4 \\ | \\ \text{R}'' \\ | \\ \text{R}''' \end{array} \quad \text{donde } \text{R}'$$

 es H, R'' es H, -CH₃ o Cl y R''' es H, -CH₃ o Cl, o -CH₂-

20 y R y R₆ pueden estar unidos para formar un grupo -CH₂CH₂CH₂CH₂- o -CH₂CH₂OCH₂CH₂-.

25 15. Compuestos del grupo 11. preferido, donde R₁ es
$$\begin{array}{c} \text{X} \\ | \\ \text{N} \\ | \quad \diagdown \\ \text{C} \quad \text{C} \\ | \quad \diagup \\ \text{N} \quad \text{Z} \\ | \\ \text{Y} \end{array}, \text{ X es } -\text{CH}_3, -\text{OCH}_3 \text{ o } -\text{OC}_2\text{H}_5 \text{ e Y es H, alquilo}$$

 C₁-C₃, -CH₂OCH₃, -CH₂OC₂H₅, -OCH₂CO₂(alquilo C₁-C₂),

- 1 $-\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CO}_2$ (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$), $-\text{O}$ (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$), $-\text{O}$ (alqueni-
- lo $\text{C}_3\text{-C}_4$) y $\text{NR}_{16}\text{R}_{17}$, donde R_{16} es H o $-\text{CH}_3$ y R_{17} es alqui-
- lo $\text{C}_1\text{-C}_3$ y Z es CH o N.
- 5 16. Compuestos del grupo 15. preferido donde -QR es el definido en el grupo 12. preferido.
17. Compuestos del grupo 15. preferido, donde -QR es el definido en el grupo 13. preferido.
18. Compuestos del grupo 15. preferido, donde -QR es el definido en el grupo 14. preferido.
- 10 19. Compuestos de los grupos 16., 17. o 18. preferidos, donde R_2 y R_3 son ambos hidrógeno.
20. Compuestos del grupo 19. preferido, donde Q es O y R es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alqueniilo $\text{C}_3\text{-C}_4$, alquilo $\text{C}_2\text{-C}_3$
- 15 sustituido con Cl, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-(\text{CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5)$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5)$.
- o $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5)$.
21. Compuestos del grupo 19. preferido, donde Q es S y R es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o alqueniilo $\text{C}_3\text{-C}_4$.
- 20 22. Compuestos del grupo 19. preferido, donde Q es $-\text{NR}_6-$ y R es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alqueniilo $\text{C}_3\text{-C}_4$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-(\text{CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5)$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-(\text{CH}_3, \text{C}_2\text{H}_5)$ y R_6 es H o CH_3 o bien R y R_6 pueden estar unidos y formar un grupo $-(\text{CH}_2)_4-$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.
- 25 23. Compuestos del grupo 19. preferido, donde X es

1 -CH₃, -OCH₃ o -OC₂H₅ e Y es alquilo C₁-C₃, -OCH₃, -OC₂H₅,
-OCH₂CO₂-(CH₃, C₂H₅), -OCH(CH₃)CH₂CO₂-(CH₃, C₂H₅) o -CH₂OCH₃.

5 24. Compuestos del grupo 23. preferido, donde -QR
es el definido en el grupo 20. preferido.

25. Compuestos del grupo 23. preferido, donde -QR
es el definido en el grupo 21. preferido.

26. Compuestos del grupo 23. preferido, donde -QR es
el definido en el grupo 22. preferido.

10 Son específicamente preferidos los siguientes com-
puestos:

N-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbo-
nilbencenosulfonamida

15 N-[(4,6-dimetil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxi-
carbonilbencenosulfonamida

N-[(4-metoxi-6-metilpirimidn-2-il)aminocarbonil]-2-metoxi-
carbonilbencenosulfonamida

20 N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-
metoxicarbonilbencenosulfonamida

N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicar-
bonilbencenosulfonamida

N-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-meto-
xicarbonilbencenosulfonamida

25 N-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(iso-
propoxicarbonil)bencenosulfonamida

- 1 N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
(isopropoxicarbonil) bencenosulfonamida
N-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-(2-
cloroetoxicarbonil) bencenosulfonamida.
- 5 N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
(2-cloroetoxicarbonil) bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
propoxicarbonil bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-(2-
10 cloroetoxicarbonil) bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
(2-fenil-1-metiletoxicarbonil) bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
[2-(2-cloroetoxi) etoxicarbonil] bencenosulfonamida
- 15 N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
(2-etoxietoxicarbonil) bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
aliloxicarbonil bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-dime-
20 tilcarbamoil bencenosulfonamida
N-[[4-metil-6-(1-metoxicarboniletoksi) pirimidin-2-il] ami-
nocarbonil]-2-metoxicarbonil bencenosulfonamida
N-[[4-metil-6-(1-metoxicarboniletoksi)-1,3,5-triazin-2-il]
aminocarbonil]-2-metoxicarbonil bencenosulfonamida
- 25 N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-

- 1 metiltiocarbonilbencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
isopropiltiocarbonilbencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-isopro-
5 piltiocarbonilbencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbonil]-2-
(2-metilpropoxycarbonil)bencenosulfonamida
N-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-(4-
morfolinilaminocarbonil)bencenosulfonamida
10 N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-(1-pirro-
lidinilcarbonil)bencenosulfonamida
N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-(aliloxi-
carbonil)bencenosulfonamida

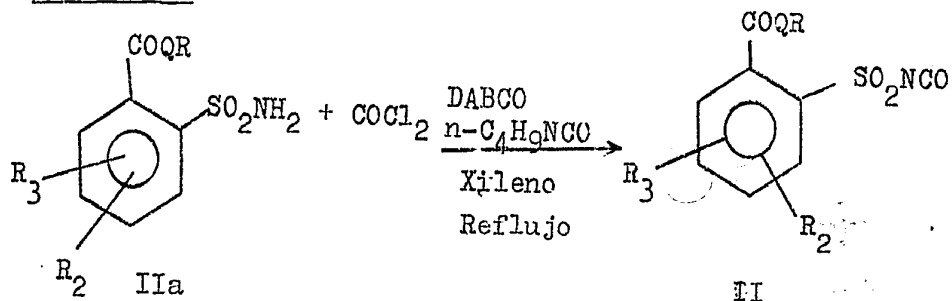
Síntesis

- 15 Muchos de los compuestos de Fórmula I se preparan
en la forma descrita en la Ecuación 3 por reacción de un
o-carbonilbencenosulfonilisocianato o isotiocianato adecua-
damente sustituidos con una aminopiridina o aminotriazina
apropiadas. Estos compuestos de Fórmula I pueden convertirse
20 en otros compuestos de Fórmula I como se indica en las
ecuaciones subsiguientes. Así, los o-carbonilbencenosulfonil-
isocianatos y sulfonilisotiocianatos son importantes inter-
mediarios para la preparación de los compuestos de esta in-
vención. Por lo tanto, la síntesis de los mismos está des-
25 crita en las Ecuaciones 1 y 2.

1

Ecuación 1

5



10

15

20

Se calienta a 135° aproximadamente una mezcla de la sulfonamida apropiada, v.g. una o-alcoxicarbonil-benceno-sulfonamida IIa tal como el éster metílico, que es conocido, un alquilisocianato como butilisocianato y una cantidad catalítica de 1,4-diaza[2,2,2]bicyclooctano (DABCO) en xileno u otro disolvente inerte de punto de ebullición suficientemente elevado (v.g. superior a 135°). Se agrega fosgeno a la mezcla hasta que hay presente un exceso de fosgeno, lo que viene indicado por un descenso del punto de ebullición. (La mezcla se continúa calentando para expulsar el exceso de fosgeno). Después la mezcla se enfría y se filtra para separar una pequeña cantidad de subproductos insolubles, y el disolvente y el alquilisocianato se separan por destilación a vacío, quedando un residuo que es el sulfonil-isocianato II crudo.

25

En la Ecuación 1:

Q es O,

R es alquilo C₁-C₁₂; alqueno C₃-C₁₀; alquilo C₂-C₆ sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados entre 0-3

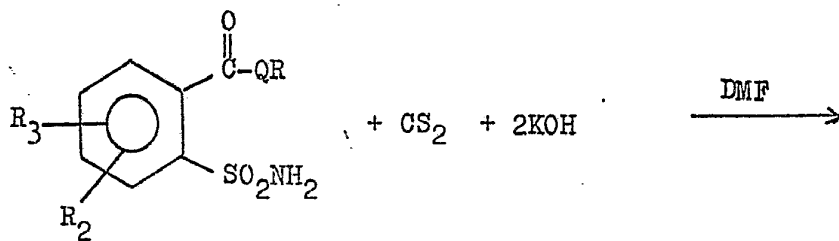
- 1 átomos de F, Cl o Br y 0-2 grupos metoxi; alquenilo C₃-C₆ sustituido con 1-3 átomos de F, Cl o Br; cicloalquilo C₅-C₈; cicloalquenilo C₅-C₈; cicloalquilo C₅-C₆ sustituido con 1 a 4 de cualquier sustituyente metilo,
- 5 metoxi, alquilo C₂-C₄, F, Cl o Br; cicloalquilalquilo C₄-C₁₀; cicloalquilalquilo C₄-C₈ con 1-2 grupos CH₃; -CH₂CH₂OR₇; -CH₂CH₂CH₂OR₇; -CH(CH₃)CH₂OR₇ donde R₇ es
- 10 -CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, fenilo, -CH₂CH₂Cl o -CH₂CCl₃;
 -(CH₂CH₂O)_{n'}-R₈; -(CH(CH₃)CH₂O)_{n'}-R₈ donde R₈ es -CH₃,
 -CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, fenilo, -CH₂CH₂Cl o -CH₂CCl₃ y n' es 2 o 3;
- 15 - NH₂ R₂ es H, Cl, Br, F, alquilo C₁-C₃, -NO₂, -OCH₃, -SCH₃,
 -CF₃, -SO₂CH₃, -N(CH₃)₂ o -CN; y
- F R₃ es H, Cl, Br o CH₃.

Cuando W = S en la Fórmula I, los sulfonilisotiocianatos intermedios útiles se preparan de acuerdo con las Ecuaciones 2 y 2'.

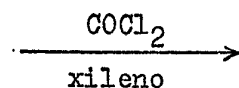
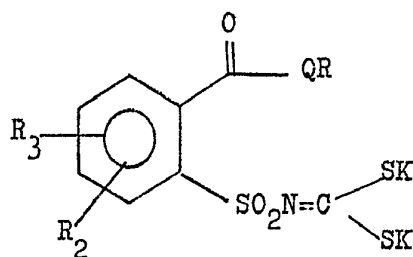
20

Ecuación 2

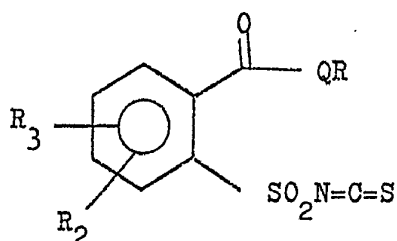
25



1



5



10

15

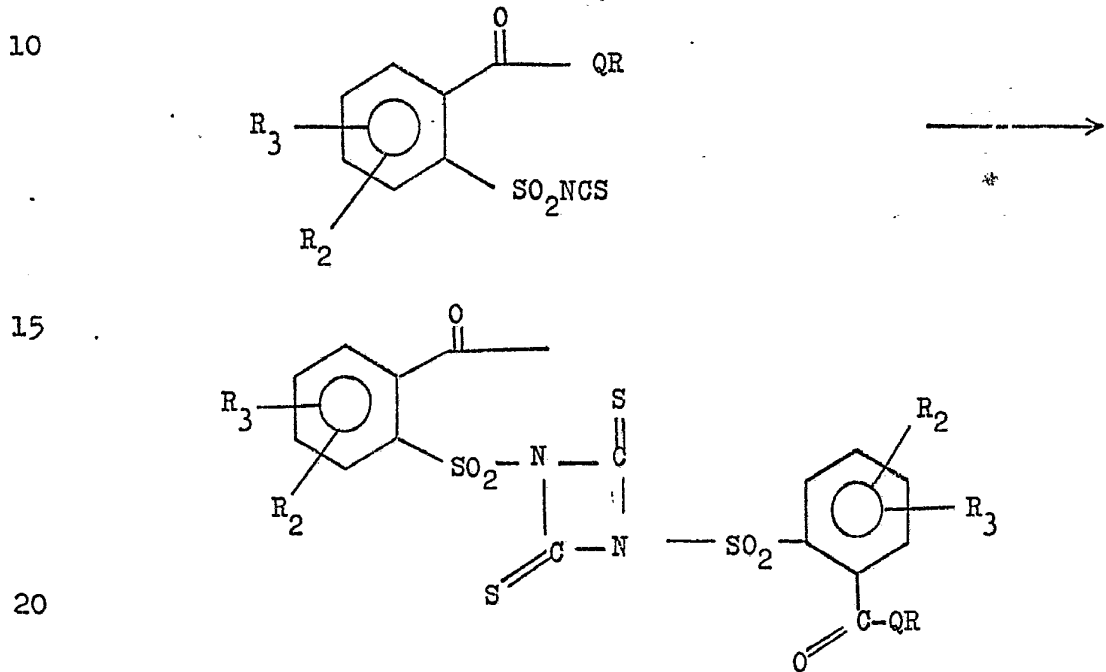
20

25

La o-carbonilsulfonamida se disuelve en dimetilformamida (DMF) con una cantidad equivalente de disulfuro de carbono y se agregan poco a poco, a la temperatura ambiente, 2 equivalentes de hidróxido potásico. La mezcla se agita durante 1-8 horas y se diluye con acetato de etilo, éter etílico o un disolvente aprótico similar para que precipite la sal dipotásica del ácido ditiocarbámico. La sal se aísla, se seca y se suspende en un disolvente inerte como xileno, benceno, tetracloruro de carbono o cloruro de metileno. Se agrega fosgeno a la suspensión agitada por debajo de la temperatura ambiente y la mezcla se agita durante 1 a 3 horas. En lugar de fosgeno, puede utilizarse un éster clorofórmico (v.g. cloroformiato de metilo), pentacloruro de fósforo, cloruro de sulfurilo o cloruro de tionilo.

1 El sulfonilisotiocianato que se forma es habitualmen-
te soluble en el disolvente y se aísla separando por fil-
tración el cloruro potásico inorgánico y concentrando el
filtrado. Estos isotiocianatos suelen ser inestables y se
5 dimerizan fácilmente (Ecuación 2'); no obstante, pueden
utilizarse los dímeros de la misma manera que los isotiocia-
natos originales para los fines de esta invención.

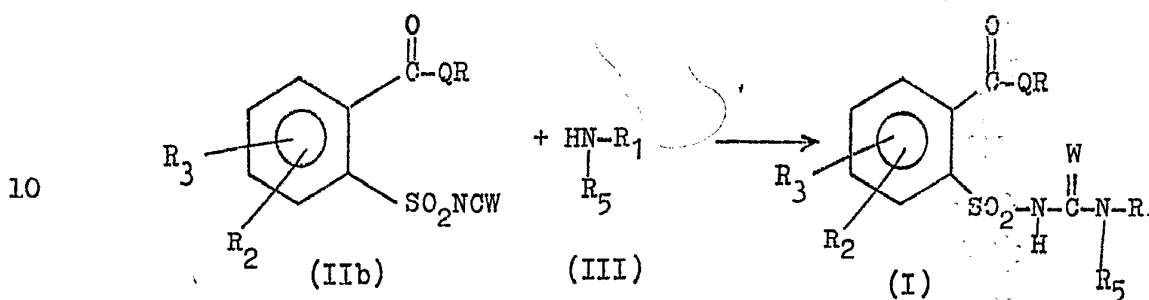
Ecuación 2'



25 El método de síntesis elegido para la preparación
de los compuestos de Fórmula I depende en gran parte de los
sustituyentes R y R₄. Como se indica en la Ecuación 3, los
compuestos de Fórmula I donde Q, R, R₂ y R₃ son los defi-

1 nidos en la Ecuación 1, se preparan convenientemente hacien-
do reaccionar un carbonilbencenosulfonilisocianato o isotio-
cianato adecuadamente sustituido de Fórmula IIb con una
aminopiridina o aminotriazina apropiadamente sustituida
5 de Fórmula III:

Ecuación 3



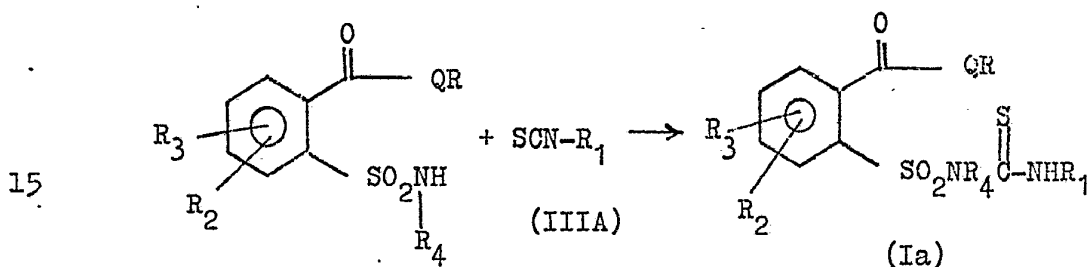
15 La mejor forma de llevar a cabo la reacción de la
Ecuación 3 es utilizando disolventes orgánicos apróticos
inertes como cloruro de metileno, tetrahidrofurano o ace-
tonitrilo, a la presión atmosférica y temperatura ambien-
te. La forma de adición no es crítica; sin embargo, con
frecuencia conviene agregar el sulfonilisocianato o isotio-
cianato a una suspensión agitada de la amina III. Como estos
20 isocianatos e isotiocianatos son líquidos, sólidos de bajo
punto de fusión o fácilmente solubles en disolventes como
los citados anteriormente, su adición puede ser fácilmente
controlada.

25 La reacción es generalmente exotérmica. En algunos
casos, el producto deseado es soluble en el medio de reac-

1 ción caliente y al enfriar cristaliza en forma pura. Otros
productos que son solubles en el medio de reacción son ais-
5 lados por evaporación del disolvente, trituración del re-
siduo sólido con disolventes como 1-clorobutano o éter etí-
lico y filtración.

Como muestra la Ecuación 3A, los compuestos de Fórm-
ula Ia donde R no es H o M, W es S y R₅ es H, se preparan
también por reacción de una o-carbonilbencenosulfonamida
adecuadamente sustituida con el triazin- o pirimidin-isocia-
10 nato apropiado de Fórmula IIIA.

Ecuación 3A



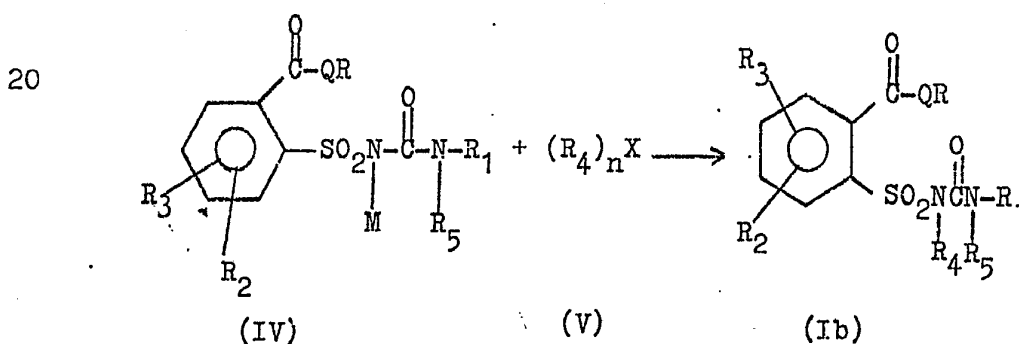
La mejor forma de llevar a cabo la reacción de la
Ecuación 3A es disolviendo o suspendiendo la sulfonamida
y el isotiocianato en un disolvente polar como acetona,
20 acetonitrilo, acetato de etilo o metiletilcetona, agregando
un equivalente de una base como carbonato potásico y agitan-
do la mezcla desde la temperatura ambiente hasta la tempe-
ratura de reflujo, durante 1 a 24 horas. En algunos casos,
el producto precipita de la mezcla de reacción y puede ser
25 separado por filtración. El producto se agita en un ácido

1 mineral diluido, se filtra y se lava con agua fría. Si
el producto no precipita de la mezcla de reacción, puede
ser aislado por evaporación del disolvente, trituración
del residuo con un ácido mineral diluido y filtración del
5 producto insoluble.

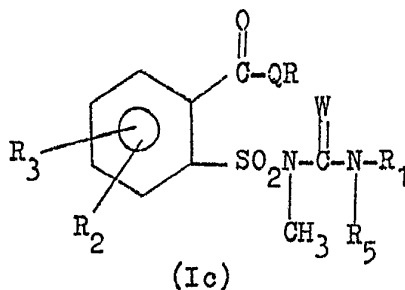
Los isotiocianatos heterocíclicos que se utilizan en
el procedimiento del Ejemplo 3A se preparan, por ejemplo,
por el método de la solicitud de patente japonesa publi-
cada Kokai 51-143686, 5 de Junio de 1976 o el de W. Abraham
10 y G. Barnikow, Tetrahedron 29, 691-697 (1973).

Como indica la Ecuación 4, los compuestos de Fórmu-
la I donde Q es O, S o -N- , R es el definido en la Ecua-
ción 1, R₄ es metilo y W es O, pueden ser preparados por
15 metilación de las sales IV donde M es un catión metálico
alcalino como sodio (derivado de compuestos de Fórmula I
donde R₄ es hidrógeno):

Ecuación 4



1



5

10

15

20

25

La preparación de ureas y tioureas, como las de Fórmula Ic, a partir de aminas y cloruros de carbamilo y cloruros de tiocarbamilo es muy conocida. La mejor forma de llevar a cabo la reacción es agregando cantidades equivalentes del cloruro VI y la amina III a un disolvente orgánico inerte, como tetrahidrofurano, xileno o cloruro de metileno, en presencia de un aceptor de ácido, como trietilamina, piridina o carbonato sódico, empleando temperaturas de 20° a 130°C. Los productos solubles pueden ser aislados separando por filtración las sales precipitadas y concentrando el filtrado. Los productos insolubles pueden ser separados por filtración y lavados con agua para eliminar las sales.

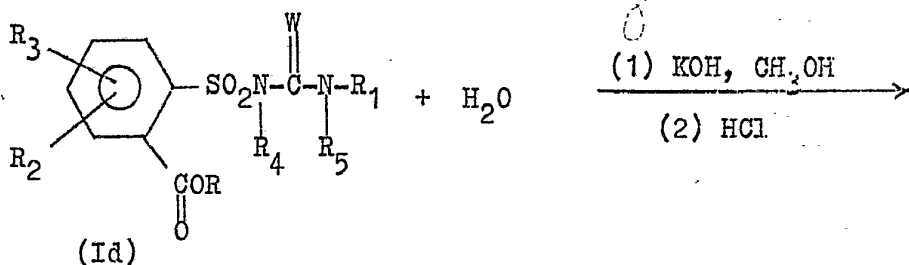
Los cloruros de Fórmula VI pueden ser preparados por fosgenación o tiofosgenación de sales de N-alquilsulfonamida. La sal de sulfonamida se agrega a un exceso de fosgeno o tiofosgeno en un disolvente orgánico inerte, como tetrahidrofurano, tolueno o xileno y, después de separar el exceso de fosgeno, el cloruro VI puede ser aisla-

1 do o puede reaccionar in situ con la amina III.

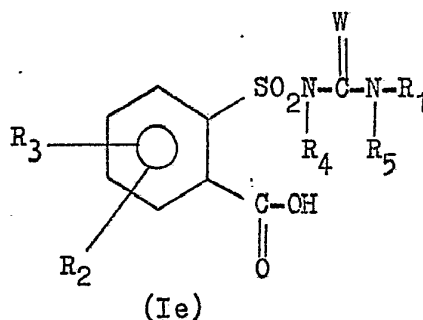
Los compuestos de Fórmula Ie, donde R es H, pueden ser preparados por hidrólisis de ésteres de Fórmula Id donde R es alquilo C₁-C₁₂. Como indica la Ecuación 6, la
5 hidrólisis catalizada por bases metálicas alcalinas en metanol acuoso produce el carboxilato metálico alcalino a partir del cual se obtiene el ácido carboxílico por tratamiento con ácidos minerales como HCl.

Ecuación 6

10



15



20

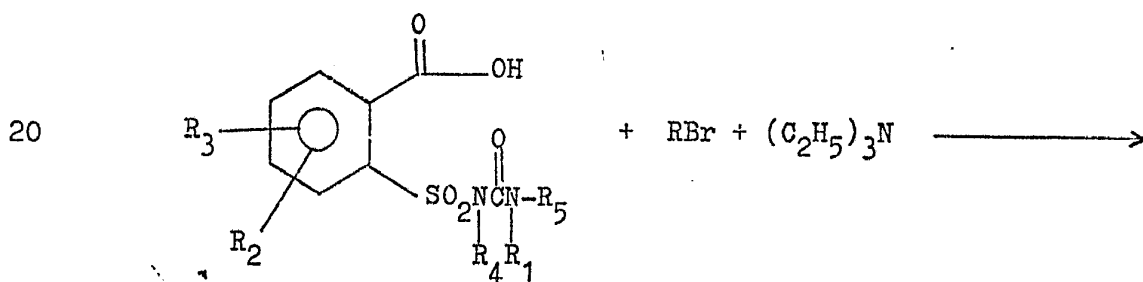
25

La mejor forma de llevar a cabo la reacción de la Ecuación 6 es en una solución que contiene el compuesto que está siendo hidrolizado, 2 a 10 partes de metanol, 10 a 50 partes de agua y 2 a 10 equivalentes de una base

1 como hidróxido sódico o potásico, manteniendo la tempe-
ratura a 30-90°C durante 3-24 horas. Mediante esta reac-
ción se forma la sal de metal alcalino del ácido carboxí-
lico, soluble, que es adecuada para los fines de esta in-
5 vención. La conversión de estas sales en la forma ácida
se realiza fácilmente por adición de ácidos minerales fuer-
tes al medio de reacción, como ácido clorhídrico o sulfúri-
co, haciendo que precipiten de la solución los ácidos car-
boxílicos deseados.

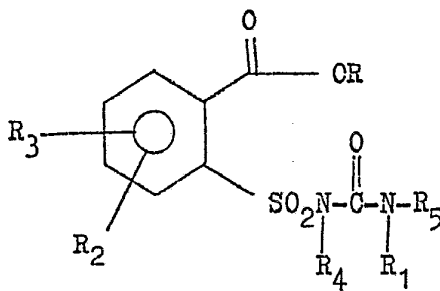
10 Los compuestos donde W y Q son O y R es H pueden ser
convertidos en los compuestos de esta invención donde R es
un grupo alquilo superior o hidrocarbilo sustituido, como
ya se ha descrito aquí, por reacción de las sales del áci-
do original (R = H) con R-Halógeno como se indica en la
15 Ecuación 6A.

Ecuación 6A



25

1



5

10

La reacción del Ejemplo 3 puede utilizarse cuando el compuesto intermedio R-Halógeno contiene un halógeno fácilmente sustituible, como ocurre en el caso de los haluros alílicos o bencílicos sustituidos o no sustituidos, α -halonitrilos o α -halocarbonil-derivados.

15

La mejor forma de llevar a cabo el procedimiento de la Ecuación 6A es en disolventes polares inertes como tetrahidrofurano, acetonitrilo o acetona, combinando el ácido carboxílico adecuadamente sustituido y la base, como trietilamina o 1,4-diaza[2.2.2]bicyclooctano, agregando el haluro adecuado y calentando la mezcla a reflujo con agitación durante 1 a 16 horas. La mezcla de reacción puede ser evaporada a sequedad y el residuo triturado con agua, filtrado y lavado con agua para separar el producto deseado de la sal soluble en agua.

20

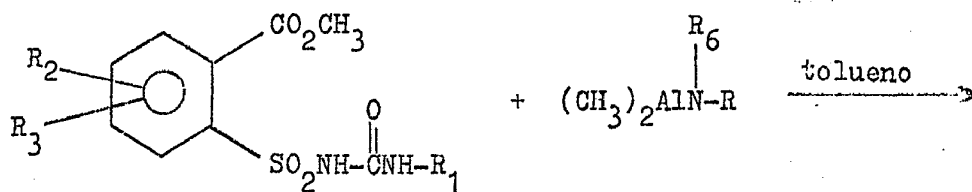
25

Cuando Q es NR₆, los compuestos pueden ser preparados a partir de los ésteres de esta invención donde R es alquilo C₁-C₄ (preferiblemente C₁), por reacción de los ésteres con derivados de dialquilaluminio-N-alquilamida

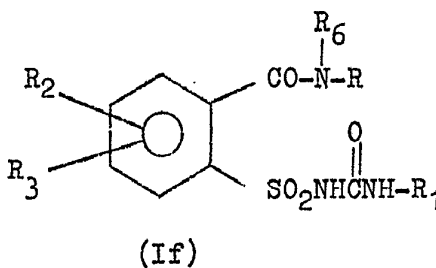
1 de acuerdo con la Ecuación 7, donde R, R₁, R₂, R₃ y R₆ son los definidos anteriormente.

Ecuación 7

5



10



15

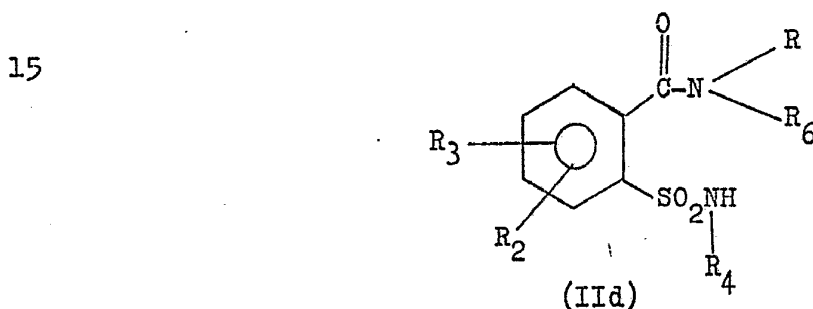
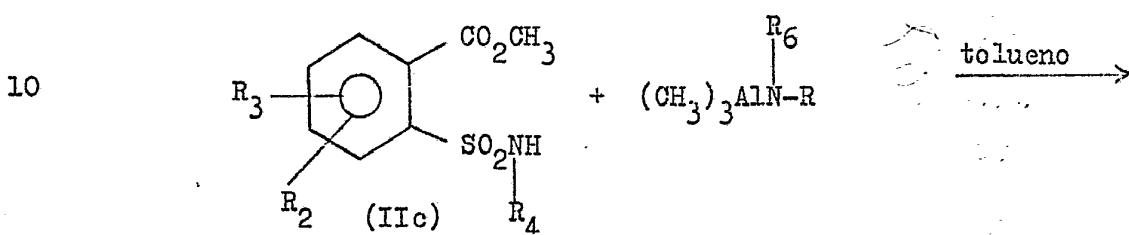
Los compuestos de alquilaminoaluminio intermedios, preparados de acuerdo con A. Basha, M. Lipton y S.W. Weinreb, Tetrahedron Letters 4171 (1977), se mezclan con una suspensión de los ésteres en tolueno o en un disolvente inerte similar y la mezcla se calienta a reflujo durante 1 a 6 horas. El producto puede ser aislado por evaporación del tolueno disolvente, adición de cloruro de metileno y ácido clorhídrico acuoso para descomponer la masa de reacción residual y extracción del producto deseado en cloruro de metileno. Por evaporación del cloruro de metileno se obtie-

25

1 ne el producto deseado en forma suficientemente pura para los fines de esta invención.

5 Los compuestos de Fórmula IID donde Q es NR₆ y R₁, R₂, R₃ y R₄ son los definidos anteriormente en la fórmula general, que son útiles como intermediarios en la Ecuación 3A, se preparan como indica la Ecuación 7A.

Ecuación 7A



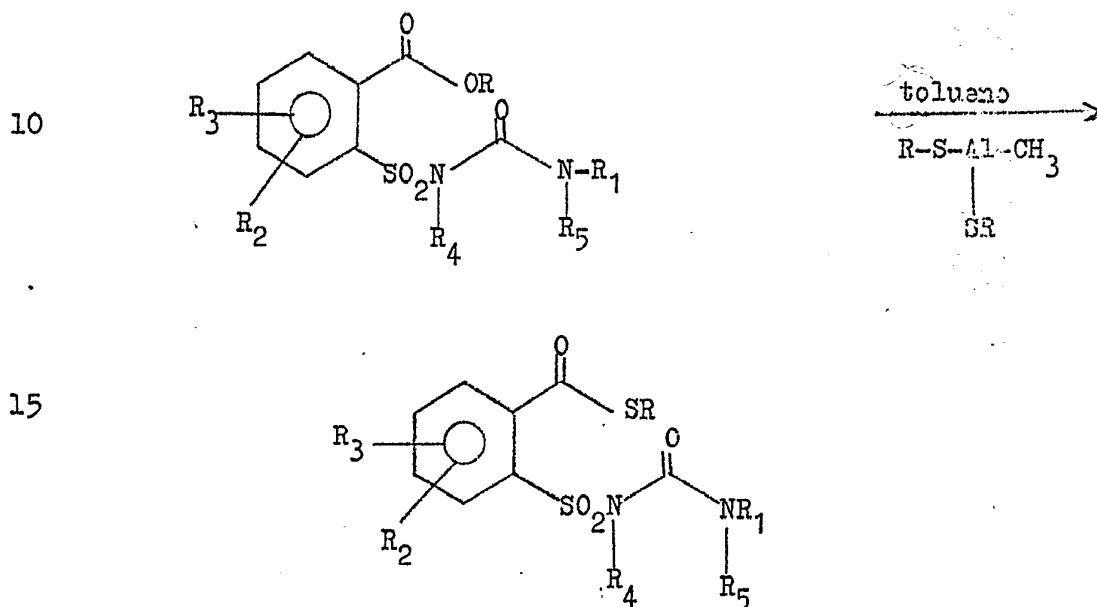
20 Las condiciones descritas para la Ecuación 7 son adecuadas para la conversión de los ésteres de Fórmula IIC en las amidas IID como indica la Ecuación 7A.

25 Los productos de la Ecuación 7A son especialmente útiles para la preparación de compuestos de Fórmula Ia donde Y contiene un sustituyente éster CO₂(C₁-C₆), por la

1 vía descrita en la Ecuación 3A.

5 Cuando Q es S, los compuestos pueden ser preparados a partir de los ésteres de esta invención donde QR es alcoxi C₁-C₄ (preferiblemente C₁), por reacción de los ésteres con el alquiltiolato de dialquilaluminio adecuado, de acuerdo con la Ecuación 8.

Ecuación 8



20 Los tiolatos de aluminio intermedios pueden ser preparados de acuerdo con R.P. Hatch y S.W. Weinreb, Journal of Organic Chemistry, Vol. 42, 3960 (1977). La mejor forma de llevar a cabo la reacción del tiolato con el éster de esta invención es en un disolvente neutro como tolueno o xileno, a reflujo, durante 1 a 3 horas.

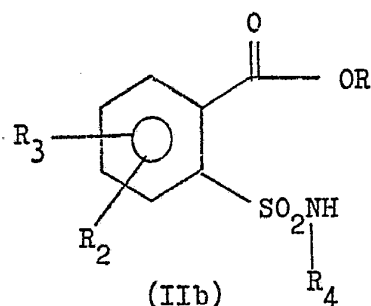
25 Los mejores resultados se obtienen cuando el tiolato de

1 aluminio está presente en exceso sobre la cantidad este-
quiométrica requerida.

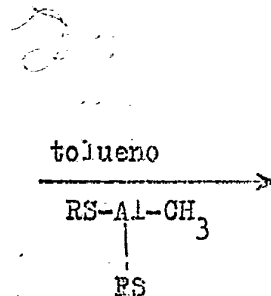
5 Las sulfonamidas de Fórmula I Ib también se convier-
ten de ésteres de ácido carboxílico en tiolésteres como
muestra la Ecuación 8A, de acuerdo con el método de R.P.
Hatch y S.W. Veinreb, como se ha descrito para la Ecu-
ación 8, donde R, R₂, R₃ y R₄ son los definidos anterior-
mente.

Ecuación 8A

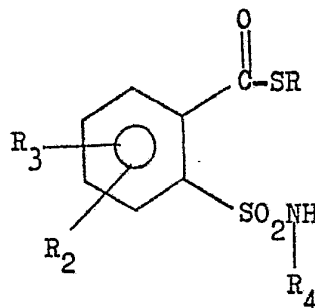
10



15



20



25

Las condiciones descritas para la Ecuación 8 son
adecuadas para la conversión de las sulfonamidas de Fór-
mula I Ib como indica la Ecuación 8A.

Los productos de la Ecuación 8A son especialmente

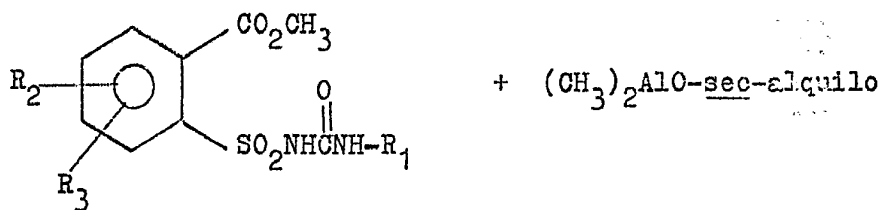
1 útiles para la preparación de compuestos de Fórmula Ia,
donde Y tiene un sustituyente (CO₂-alquilo C₁-C₆) por
la vía descrita para la Ecuación 3A.

5 Otra vía posible para la preparación de compuestos
donde R está unido a Q (Q = O) por el átomo de carbono
secundario implica la reacción del alcoholato de dialquil-
aluminio adecuado y un éster de esta invención donde R
es un grupo alquilo inferior primario, preferiblemente
metilo, de acuerdo con la Ecuación 9.

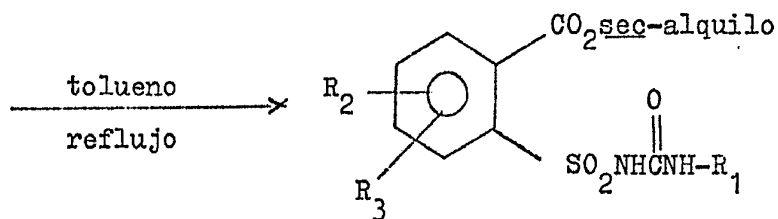
10

Ecuación 9

15



20



25

La reacción se lleva a cabo en un disolvente neutro
como tolueno, con un punto de ebullición suficientemente
alto para que la reacción se produzca mientras se mantie-
ne el reflujo. Para obtener los mejores rendimientos, el

1 alcoholato de dialquilaluminio se encuentra en una canti-
dad superior a la equivalente al éster. Después de calen-
tar a reflujo durante 1 a 15 horas, la mezcla de reacción
se descompone con ácido clorhídrico diluído y el producto
5 se extrae en cloruro de metileno. Por evaporación del clo-
ruro de metileno se obtiene el compuesto deseado suficiente-
mente puro para los fines de esta invención. El producto
puede ser triturado con un disolvente, v.g. 1-clorobutano,
para separar las impurezas.

10 La síntesis de las aminas heterocíclicas ha sido
revisada en "The Chemistry of Heterocyclic Compounds",
una serie publicada por Interscience Publ., New York y
Londres. Las 2-aminopirimidinas han sido descritas por
D.J. Brown en "The Pyrimidines", Vol. XVI de esta serie.
15 Las 2-amino-1,3,5-triazinas han sido revisadas por K.R.
Huffman y en "The Triazines" de esta misma serie. La sín-
tesis de las triazinas también ha sido descrita por F.C.
Schaefer, patente estadounidense n° 3.154.547 y por K.R.
Huffman y F.C. Schaeffer, J.Org.Chem. 28, 1816-1821 (1963).

20 La preparación de sales agrícolamente adecuadas de
los compuestos de Fórmula I, así como los materiales de
partida e intermediarios para dichos compuestos, no des-
critos por lo demás aquí, está descrita en nuestra solici-
tud de patente estadounidense n° 824.805, presentada el
25 15 de Agosto de 1977 y n° 840.389, presentada el 6 de Octu-

1 bre de 1977, que se incorporan aquí por referencia. Los
compuestos de esta invención y su preparación son ilustra-
dos mediante los siguientes ejemplos, donde las tempera-
5 turas se dan en grados centígrados y las partes en peso
salvo indicación en contrario.

EJEMPLO 1

2-(Isocianatosulfonil)benzoato de metilo

Se calienta a reflujo durante media hora una mezcla
agitada que contiene 157 g de 2-sulfamoilbenzoato de me-
10 zilo, 73 g de isocianato de butilo, 0,3 g de 1,4-diazabi-
ciclo[2.2.2]octano y 1,0 litros de xileno. Después se ha-
ce pasar fosgeno gaseoso a través del sistema bajo un re-
frigerante de reflujo de hielo seco, dejando que la tempe-
ratura de la reacción descienda a 120°. Esta adición se
15 prosigue hasta que la temperatura de reflujo se mantiene
a 120° sin más adición de fosgeno. La temperatura de la
mezcla de reacción se eleva después a 136° (retirando el
refrigerante de reflujo de hielo seco), después de lo cual
se enfría a la temperatura ambiente y se filtra. Por eva-
20 poración del filtrado se obtiene el sulfonilisocianato
crudo deseado que puede ser purificado por destilación a
132-138°C bajo una presión de 1,0 a 1,1 mm de mercurio.
El producto es extraordinariamente reactivo con agua, de
manera que debe evitarse escrupulosamente el contacto con
25 la humedad.

1

EJEMPLO 2

2-(Isocianatosulfonil)benzoato de isopropilo

5

A 60,7 g (0,25 moles) de 2-sulfamoilbenzoato de isopropilo en 300 ml de xileno seco (tamices moleculares) se agregan 25,0 g (0,25 moles) de N-butilisocianato y 0,1 g de 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano. La mezcla se calienta a la temperatura de reflujo y se hace borbotear flogeno lentamente a través de la solución durante 2 horas.

10

Un espectro de infrarrojo de la mezcla de reacción indica la formación del sulfonilisocianato deseado (2250 cm^{-1}). La solución turbia resultante se enfría a la temperatura ambiente y se separa por decantación de una pequeña cantidad de impurezas sólidas. Por evaporación de la solución transparente resultante se obtiene el sulfonilisocianato crudo deseado que se utiliza en las etapas posteriores sin purificarlo más.

15

EJEMPLO 3

20

N-[(4,6-Dimetilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida

25

A 37 g de 2-amino-4,6-dimetilpirimidina en 500 ml de acetonitrilo anhidro se agregan 67 g de 2-metoxicarbonilbencenosulfonilisocianato, agitando a la temperatura ambiente. Después la mezcla resultante se agita durante 16 horas y a continuación se filtra para separar el producto deseado.

1 do que ha precipitado en forma de sólido blanco, p.f.
198-202. Presenta picos de absorción de infrarrojo a
1750, 1700, 1600 y 1550 cm^{-1} , concordantes con el compues-
to deseado.

5

EJEMPLO 4

N-[(Pirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbenceno-
sulfonamida

Agitando a la temperatura ambiente, se agregan
1,0 g de 2-aminopiridina en 25 ml de acetonitrilo anhi-
dro a 2,4 g de 2-metoxicarbonilbencenosulfonilisocianato.
Después de agitar esta mezcla durante 24 horas, el preci-
pitado resultante se separa por filtración para dar 2,2 g
del compuesto deseado que funde a 188-192°. Presenta picos
de absorción en infrarrojo a 1700, 1680 y 1580 cm^{-1} que
concuerdan con la N-[(pirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-me-
toxicarbonilbencenosulfonamida.

15

EJEMPLO 5

N-[(4-Metoxi-6-metilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-meto-
xicarbonilbencenosulfonamida

20

A una suspensión agitada de 1,4 g de 2-amino-4-me-
toxi-6-metilpirimidina en 30 ml de cloruro de metileno
anhidro se agregan a la temperatura ambiente 2,4 g de
2-metoxicarbonilbencenosulfonilisocianato. Después de
agitar durante 16 horas, la mezcla anterior se filtra pa-
ra separar la amina que no ha reaccionado y el filtrado

25

1 se evapora a temperaturas de hasta 40° y a presión redu-
cida. El residuo resultante se agita en 25 ml de agua,
se ajusta el pH a 10 por adición de hidróxido sódico al
50 % y se filtra la solución. Acidulando el filtrado a
5 pH 3 con ácido clorhídrico precipita el producto deseado
que se separa por filtración y se seca para dar 0,8 g de
un producto que funde a 173-179°. Presenta picos de absor-
ción en infrarrojo a 1720, 1680, 1630 y 1550 cm^{-1} , que
conducen con la N-[4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il]ami-
10 nocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida.

EJEMPLO 6

N-[4,6-Dimetoxipirimidin-2-il]aminocarbonil]-2-metoxicar-
bonilbencenosulfonamida

15 Se agita a la temperatura ambiente y a la presión
atmosférica, durante 16 horas, una mezcla que contiene
1,6 g de 2-amino-4,6-dimetoxipirimidina, 30 ml de cloruro
de metileno anhidro y 2,4 g de 2-metoxicarbonilbencenosulfo-
nilisocianato. Después se filtra para separar la amina que
no ha reaccionado y el filtrado se evapora a temperaturas
20 hasta de 40° y a presión reducida. El residuo así obtenido
se agita en 25 ml de agua, se ajusta el pH a 10 por adi-
ción de una solución acuosa de hidróxido sódico al 50 %
y se filtra la solución. Acidulando el filtrado a pH 3
se forma un precipitado. Filtrando y secando el precipi-
25 tado se obtienen 1,7 g del producto deseado que funde a

1 185-190°. Sus picos de absorción en infrarrojo a 1700 y
1710 cm^{-1} concuerdan con la estructura deseada y los picos
de absorción y resonancia magnética nuclear a 3,8 y 3,85
5 concuerdan con los dos tipos diferentes de grupos metoxi
introducidos en este producto.

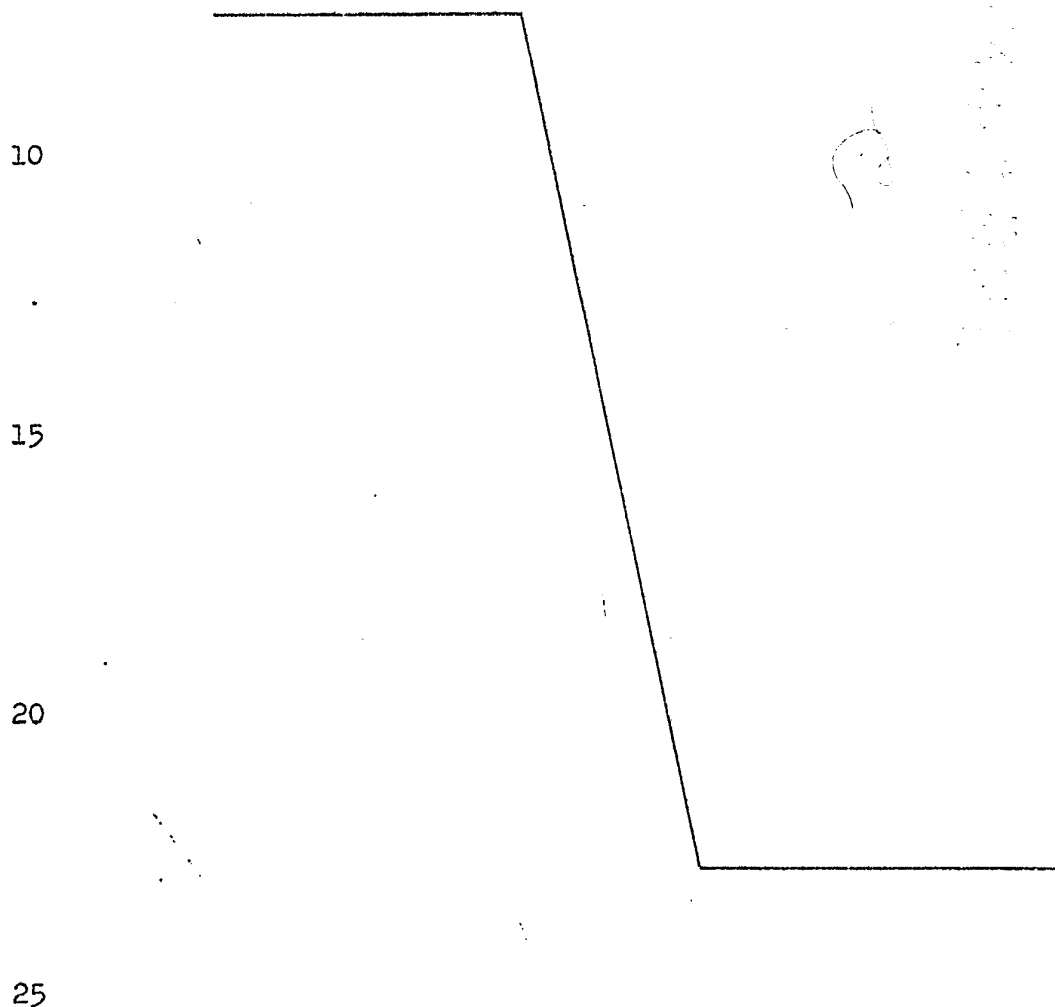
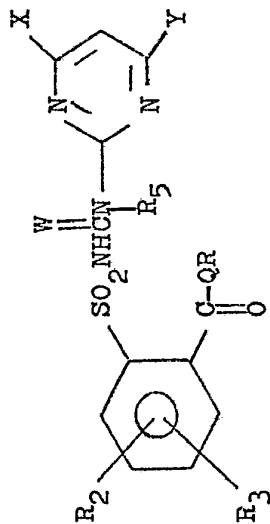


TABLA I



QR	R ₂	R ₃	R ₃	W	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	H	O	H	CH ₃	H
OCH ₃	5-F	H	H	O	H	H	Cl
OCH ₃	5-Cl	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₃	5-Br	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
OCH ₃	5-NO ₂	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
OCH ₃	5-OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
OCH ₃	5-CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
OCH ₃	5-i-C ₃ H ₇	H	H	O	H	CF ₃	OC ₂ H ₅
OCH ₃	5-SCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₃	5-Cl	3-Cl	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-Cl	3-CH ₃	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-F	3-Cl	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-NO ₂	3-Cl	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-Br	3-Br	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OC ₂ H ₅	6-Cl	H	S	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	1
OC ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	45
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1
OC ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	OCH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	108-110°
OC ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	
OC ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	
OCH ₃	H	H	O	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	
OC ₂ H ₅	H	H	O	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-Cl	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₃	6-Cl	H	O	CH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
OCH ₃	3-CH ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	

6

6

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH ₂ COOCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	S(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	152,5-160°
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	S(CH ₂) ₂ COOC ₂ H ₅	
O-n-C ₃ H ₇	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	162-166
O-n-C ₃ H ₇	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	157-160
O-C ₂ H ₅	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	168-170
O-CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	120-124
O-CH-CH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	152-155
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	150-154
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	157-160
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	98-101
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	87-90

TABLA I (continuación)


QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	170-172
OCH ₃	4-Cl	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	166-168
OCH ₃	4-Cl	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	158-160
O-i-C ₃ H ₇	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	175-179
O-i-C ₃ H ₇	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	189-190
O-n-C ₄ H ₉	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	124-126
O-n-C ₄ H ₉	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	140-149
OC ₂ H ₅	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	149-153
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	
OCH(CH ₂) ₄ CH ₃ CH ₂ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CO ₂ CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
O-CHCH ₂ Cl CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	100-104
OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ Cl	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH=CH ₂ Cl	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
O-CHCH ₂ Cl CH ₂ Cl	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CCl ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CF ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ Br	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ C ₂ H ₅	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
O(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH(CH ₂) ₂ CH=CH ₂ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P. f. °C
OCH ₃	4-Cl	5-Cl	O	H	OCH ₃	CH ₃	193-194°
OCH ₃	4-Cl	5-Cl	O	H	OCH ₃	OCH ₃	202-204°
OCH ₃	4-F	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	201-203°
OCH ₃	4-Br	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	108-111°
O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	166-168°
O(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	87-89°
OCH ₂ CH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	130-132°
OCH ₂ CH ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	153-155°
OCH ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH-CHCH ₃ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CBF ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
$\begin{array}{c} \text{OCHCH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CN} \\ / \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{H} \end{array}$	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CN} \\ / \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CN} \\ / \quad \backslash \\ \text{C}_2\text{H}_5 \quad \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CN} \\ / \quad \backslash \\ \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \quad \text{H} \end{array}$	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CN} \\ / \quad \backslash \\ \text{H} \quad \text{H} \end{array}$	
OCH ₃	H	H	O	F	OCH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CN} \\ / \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{OCH}_3 \end{array}$	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2\text{CNH}_2 \end{array}$	

TABLA I (continuación)



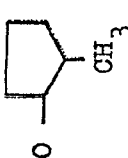
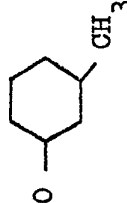
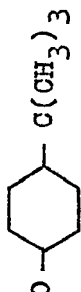
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	105-110
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	130-134
OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	163-166
O-i-C ₃ H ₇	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	194-196
OCH ₃	4-F	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	200-202
OCH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	121-124
OCH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	151-153
OCH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	90-93
OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	H	O	H	Cl	Cl	122-126
O-i-C ₃ H ₇	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	aceite
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	156-160
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCHCO ₂ CH ₃ CH ₃	143-155

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CO ₂ CH ₃	174-180
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	154-156
OCH ₃	H	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	159-174
OCH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	Cl	61-64
OCH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	aceite n _D ²⁵ 1,5408
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	118-120
O(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH-(CH ₂) ₉ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH-CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃ C ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH(CH ₂) ₇ CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₂ C=CHCH(CH ₃) ₂ Cl	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₂ CH=CCL ₂	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	

TABLE I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P. f. °C
$\text{OCHCH}=\text{CF}_2$ CH_3	H	H	O	H	CH_3	OCH_3	
$\text{OCHCH}=\text{CF}_2$ CH_3	H	H	O	H	CH_3	OCH_3	
$\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	O	H	OCH_3	OCH_3	132-134
$\text{O}(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	H	O	H	OCH_3	OCH_3	134-136
	H	H	O	H	CH_3	CH_3	
	H	H	O	H	CH_3	OCH_3	
	H	H	O	H	CH_3	OCH_3	

U

U

TABLA I (continuación)


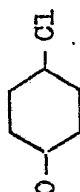
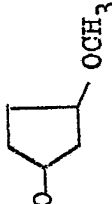
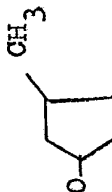
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
O-ciclo-C ₈ H ₁₅	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

TABLA I (continuación)

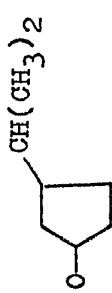
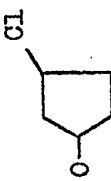
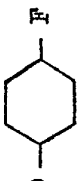
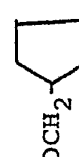
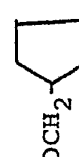
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃ O	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	N ₃	173-176
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃ O	

TABLA I (continuación)

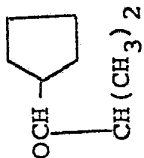
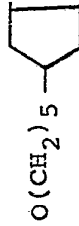
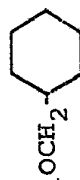
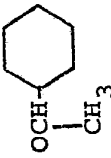
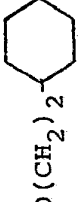
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃ O
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃

TABLA I (continuación)


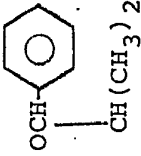
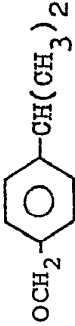
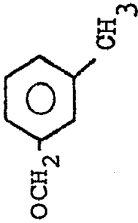
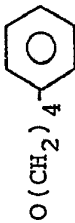
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	CF ₃	OCH ₃

TABLA I (continuación)

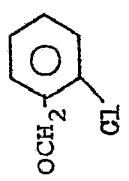
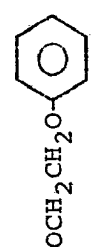
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. °C
	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
O(CH ₂ CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ C ₂ H ₄ Cl	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	²⁵ n _D 1,5458
OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
O(CH ₂) ₃ SC ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ SOCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ SO ₂ C ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
O(CH ₂) ₃ SO ₂ C ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₄ Cl	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	124-127
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ C ₂ H ₄ Cl	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	²⁵ n _D 1,5421
OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	129-131
OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	142-145
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	114-117

TABLA I (continuación)

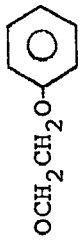
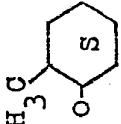
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P. f. °C
	H	H	O	H	Cl	Cl	65-69
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	153-156
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	150-152
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	(CH ₂) ₄ CN	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CCl ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH-CO ₂ CH ₃ CH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	(CH ₂) ₃ CH ₂ Cl	
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₂ C≡C-CH ₃	

TABLA I (continuación)


QR ₁	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₂ C≡C-CH ₂ Cl
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	NHnC ₄ H ₉
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	-N-(CH ₂) ₄ CN CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	-NCH ₂ CO ₂ CH ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	NH(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	-NCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	O(CH ₂) ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ Br
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CCl ₃
OCH ₃	H	H	O	K	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CN
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂

TABLA I (continuación)

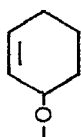
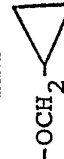
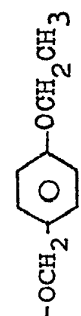
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH-CO ₂ CH ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CO ₂ n-C ₆ H ₁₃
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CO ₂ n-C ₆ H ₁₃
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ SCH ₃ O
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	SCH ₂ C≡CH
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃

TABLA I (continuación)

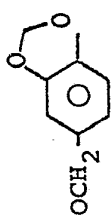


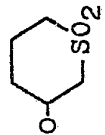

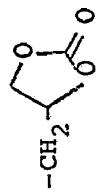
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃

TABLA I (continuación)

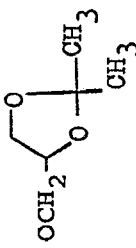
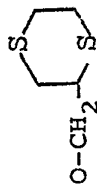
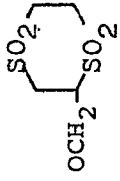
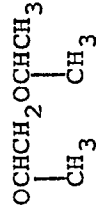

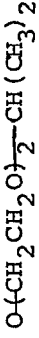

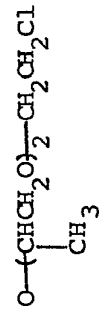
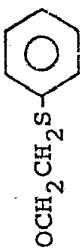
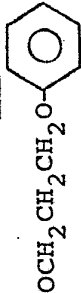
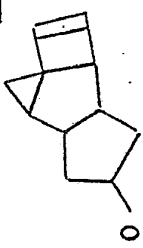
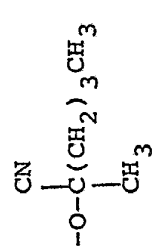
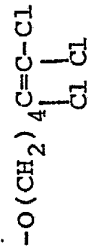
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃

TABLA I (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃

1

EJEMPLO 7

2-(Benciloxicarbonil)-N-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)amino-
carbonil]bencenosulfonamida

5

A 1,75 g de ácido 2-(4,6-dimetilpirimidin-2-il-amino-carbonilsulfamoyl)benzoico se añaden 0,51 g de trietilamina en 10 ml de tetrahidrofurano y 0,88 g de bromuro de bencilo en 10 ml de tetrahidrofurano. La mezcla se calienta a reflujo durante hora y media, se filtra y el tetrahidrofurano se evapora a vacío. El residuo se extrae en 1-clorobutano caliente, se diluye con acetato de etilo y se lava con agua y solución acuosa saturada de bicarbonato sódico. La fase orgánica se seca sobre sulfato magnésico, se filtra y los disolventes se evaporan a vacío. El residuo resultante se cristaliza en 1-clorobutano hasta un punto de fusión de 157°.

10

15

Este producto presenta picos de absorción en la región infrarroja a 1720, 1600 y 1560 cm^{-1} , concordantes con el éster deseado y absorción por resonancia magnética nuclear a 2,45 δ , singlete, para CH_3 ; 5,3 δ , singlete, CH_2 sobre bencilo; 6,65 δ , singlete, CH de pirimidina y picos de arilo a 7-8 δ .

20

Siguiendo los procedimientos de los Ejemplos 3 a 6 con una cantidad equivalente de la 2-aminopirimidina y de sulfonilisocianatos o isotiocianatos adecuadamente sustituidos, pueden prepararse los compuestos de la Tabla I.

25

Alternativamente, los compuestos de la Tabla I donde R es un grupo que forma un organohaluro con un halógeno lábil

1 pueden ser preparados por el procedimiento del Ejemplo 7,
utilizando cantidades equivalentes de derivados de ácido
benzoico y organohaluros adecuadamente sustituidos.

EJEMPLO 8

5 N-[4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)bencenosulfonamida

A 0,7 g de 2-amino-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazina en
10 ml de cloruro de metileno anhidro disolvente se añaden
1,45 g de 2-(β-cloroetoxicarbonil)bencenosulfonilísociana-
10 to. Después de agitar a la temperatura ambiente durante 16
horas, el disolvente se separa a presión reducida, el re-
sido se tritura con éter y el producto sólido se separa
por filtración, dando 1,21g. P.f. 171-174°C. El sólido pre-
senta picos de absorción en infrarrojo a 1705 y 1715 cm⁻¹,
15 concordantes con la N-[4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)ami-
nocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)bencenosulfonamida.

EJEMPLO 9

N-[4-Metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)bencenosulfonamida

20 A 0,7 g de 2-amino-4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazina en
10 ml de cloruro de metileno anhidro disolvente se añaden
1,45 g de 2-(β-cloroetoxicarbonil)bencenosulfonilísocianato,
agitando a la temperatura ambiente. Después la mezcla se
agita durante 16 horas. Se evapora el disolvente a presión
25 reducida y el residuo se tritura con hexano y se filtra para

1 dar 1,72 g de un compuesto que funde a 167-170°C. El sólido
do presenta picos de absorción en infrarrojo a 1700 y
1705 cm^{-1} , concordantes con la N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-
5 triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)bence-
nosulfonamida.

EJEMPLO 10

N-[(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(iso-
propoxicarbonil)bencenosulfonamida

10 A 0,7 g de 2-amino-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazina suspen-
didos en 5,0 ml de cloruro de metileno anhidro se añaden
1,6 g de 2-isopropoxicarbonilbencenosulfonilisocianato en
5,0 ml de cloruro de metileno anhidro. Se filtra la mezcla
resultante para separar algo de 2-amino-4,6-dimetoxitriazina
que no ha reaccionado, se evapora el filtrado de cloruro
15 de metileno a presión reducida y el residuo se tritura con
clorobutano para dar 0,5 g del producto deseado que funde
a 192-195°C. El sólido presenta picos de absorción en infra-
rojo a 1705 y 1715 cm^{-1} , concordantes con la N-[(4,6-dime-
20 toxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(isopropoxicarbo-
nil)bencenosulfonamida.

EJEMPLO 11

N-[(4-Metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-
(isopropoxicarbonil)bencenosulfonamida

25 A 26,8 g de 2-amino-4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazina
en 300 ml de cloruro de metileno anhidro se agregan 67,0 g

1 de 2-isopropoxicarbonilbencenosulfonilisocianato en 100 ml
de cloruro de metileno anhidro. La suspensión resultante
se agita a la temperatura ambiente durante 72 horas y se
5 filtra para dar 40,0 g del producto deseado en forma de
sólido blanco, p.f. 193-196°C. El sólido presenta picos
de absorción en infrarrojo a 1700 y 1710 cm^{-1} , concordan-
tes con la N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)amino-
carbonil]-2-(isopropoxicarbonil)bencenosulfonamida.

EJEMPLO 12

10 N-[(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-meto-
xicarbonilbencenosulfonamida

Se agita a la temperatura ambiente durante 16 horas
una mezcla de 1,6 g de 2-amino-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazina,
25 ml de cloruro de metileno anhidro y 2,4 g de 2-metoxicar-
15 bonilbencenosulfonilisocianato. Después se filtra para se-
parar la amina que no ha reaccionado y el filtrado se evapo-
ra a temperaturas de hasta 40° bajo presión reducida. El re-
siduo se tritura con cloruro de butilo y se filtra para
dar el compuesto deseado que funde por encima de 170° con
20 descomposición.

EJEMPLO 13

N-[(4-Metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-
metoxicarbonilbencenosulfonamida

A una suspensión anhidra de 1,4 g de 2-amino-4-metoxi-
25 6-metil-1,3,5-triazina en 25 ml de cloruro de metileno se

1 agregan con agitación, a la temperatura ambiente y presión
atmosférica, 2,4 g de 2-metoxicarbonilbencenosulfoniliso-
cianato. Después la mezcla se agita durante 16 horas y se
5 filtra. El filtrado se evapora a sequedad, se tritura el
residuo con cloruro de butilo y el producto se separa por
filtración. El producto así obtenido funde a 165° y presen-
ta picos de absorción en infrarrojo a 1550, 1600, 1680
y 1700 cm^{-1} y en el espectro de RMN a 2,5, 3,65, 4,0 con
un multiplete aromático a 7,2-8 ppm.

10 Siguiendo los procedimientos de los Ejemplos 8 a 13,
con cantidades equivalentes de las 2-amino-1,3,5-triazinas
adecuadas y los sulfonilisocianatos o isotiocianatos apropia-
damente sustituidos, pueden prepararse los compuestos de la
Tabla II.

15

EJEMPLO 14

N-[(4-Metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(1-
pentiloxicarbonil)bencenosulfonamida

20

Se añaden lentamente 0,61 g de 2-hexanol en 2 ml de
tolueno seco, a la temperatura ambiente, sobre una solución
de 1,5 ml de trimetilaluminio 2M diluída con 5,0 ml de to-
lueno seco, bajo nitrógeno. La mezcla se agita a la tempe-
ratura ambiente durante 15 minutos y se agregan 0,95 g de
N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-
25 metoxicarbonilbencenosulfonamida. La mezcla se calienta a
la temperatura de reflujo bajo nitrógeno durante 2,5 horas,

1 se enfría a la temperatura ambiente y se apaga cuidadosa-
mente con 20 ml de HCl al 10 %. La fase orgánica se reco-
ge en cloruro de metileno, se separa, se lava con agua,
5 se seca sobre sulfato magnésico, se filtra y el disolven-
te se evapora a presión reducida para dar 0,65 g del com-
puesto deseado que funde a 125-130°C. El espectro infrarro-
jo presenta la absorción característica del producto a
3300, 1725, 1730, 1585, 1555 cm^{-1} .

Alternativamente, los compuestos de las Tablas I y
10 II donde el grupo éster R deseado es alcano superior
($\text{C}_5\text{-C}_{12}$) también se preparan por el procedimiento del Ejem-
plo 14 con una cantidad equivalente del alcoholato de di-
alquilaluminio adecuado y un éster alquílico inferior apro-
piadamente sustituido de esta invención.

15

EJEMPLO 15

N-[(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminotioxometil]-2-meto-
xicarbonilbencenosulfonamida

20

Se calienta a 40° con agitación una mezcla de 4,2 g
de 2-sulfamoilbenzoato de metilo, 4,0 g de 4,6-dimetoxi-
2-isotiocianato-1,3,5-triazina y 2,7 g de carbonato potás-
sico anhidro en 70 ml de acetona. Al cabo de 2 horas se
forma un precipitado denso y se continúa agitando durante
3 horas más a la temperatura ambiente. El precipitado se
separa por filtración, se suspende en 150 ml de agua, se
25 agita y se ajusta el pH a 2 por adición de ácido clorhídrico.

1 El producto deseado se separa por filtración, se lava con agua fría y se seca para dar 4,8 g de producto que funde a 165-170°. Presenta picos de absorción en infrarrojo a 1760, 1650 y 1600 cm^{-1} y picos de resonancia magnética nuclear para los grupos metoxi a 4,0 y 3,0 (singletes) y 8,0-8,7 (multiplete), concordantes con el producto deseado.

5 El Ejemplo 15 ilustra un método mediante el cual pueden prepararse los compuestos de esta invención donde W es S, utilizando cantidades equivalentes del isotiocianato-pirimidina o triazina apropiado y una bencenosulfonamida adecuadamente sustituida.

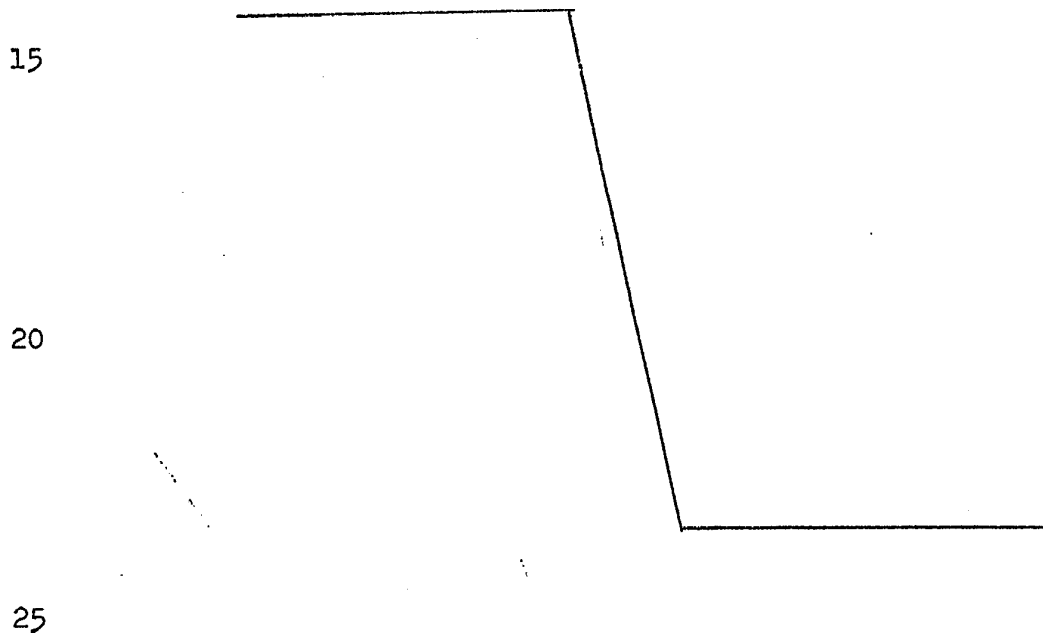
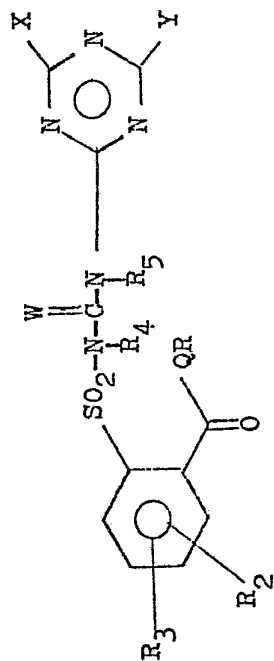


TABLE II



QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	187-189
OCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	72
OCH ₃	H	H	O	H	H	H	H	
OCH ₃	H	H	S	H	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	3-Cl	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	3-CH ₃	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
OC ₂ H ₅	3-Cl	5-Cl	O	H	H	OC ₂ H ₅	OCH ₃	
O-i-C ₃ H ₇	5-NO ₂	H	O	H	H	OC ₂ H ₅	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂	
O-nC ₃ H ₇	3-Cl	6-Cl	O	H	H	CH ₃ CH ₂ O	CH ₃ O	
O-nC ₄ H ₉	H	H	O	H	H	CH ₃ O	CF ₃	

C

C

TABLA II (continuación)

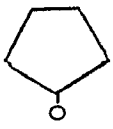
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	3-OCH ₃	H	S	H	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	
OC ₂ H ₅	5-SCH ₃	H	O	H	H	CH ₃	O(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	
OCH ₃	5-F	H	O	H	H	OCH ₃	O(CH ₂) ₂ COOC ₂ H ₅	
OCH ₃	5-CH ₃	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-F	H	O	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	3-Cl	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
OCH ₃	5-CH ₃	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	160-162
OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	167-170
O(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	133-135
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	SCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	SCH ₂ COOCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	S(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	
O-nC ₃ H ₇	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	160-165

TABLA II (continuación)


QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f. °C
O-nC ₃ H ₇	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH	177-179
O-nC ₄ H ₉	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH	147-150
O-nC ₄ H ₉	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH	144-145
O-C ₂ H ₅	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH	163-165
O-C ₂ H ₅	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH	164-167
OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	143-144
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH	171-174
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH	129-130
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH	94-97
	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH	139-143
OCH ₃	4-Cl	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	142-145
OCH ₂ C=CH ₂	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	155-158
O-iC ₃ H ₇	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	187-189
OCH(CH ₂) ₇ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLA II. (continuación)


QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ Cl	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ Br	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ C ₂ H ₅	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	153-155
O(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₃	4-Cl	5-Cl	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	172-175
OCH ₃	4-F	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	192-194
OCH ₃	4-Cl	5-Cl	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	159-161
OCH ₃	4-F	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	169-172
OCH ₃	4-Br	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
O(CH ₂) ₃ F	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CCl ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	

TABLA II (continuación)

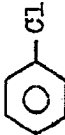
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₂ CF ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CHCH ₃ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	aceite
O(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCHCH ₂ CH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	136-138
OCH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	120-123
OCH ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	76
OCHCHCH ₃ CH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CBF ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
OCHCH ₂ Cl CH ₂ F	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	
OCH ₂ - 	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	192-194

TABLA II (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P. f. °C
$\text{O}-\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{CH}_2\text{Cl}$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	179-181
$\text{OCH}(\text{CH}_2)_3\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}_3$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	125-130
$\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	122-125
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	N(CH ₃) ₂	190-191
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	vidrio
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	vidrio
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	vidrio
OCH ₃	H	H	O	H	H	Cl	Cl	
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	$\text{O}=\text{C}(\text{NH}_2)_2$	
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	$\text{O}=\text{C}(\text{NH})\text{C}_2\text{H}_5$	

TABLA II (continuación)

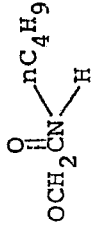
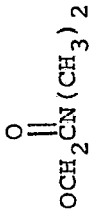
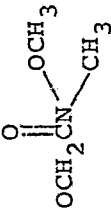
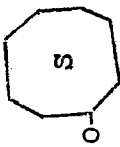
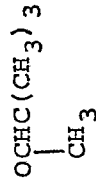
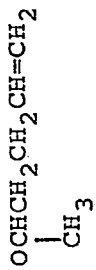
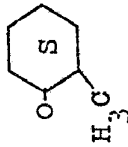
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P. f. °C
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃		
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃		
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃		
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	170-172
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	120-126
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	120-124
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	132-136

TABLA II (continuación)



QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P. f. °C
$\text{OCHCH}_2\text{CH}_3$ CH_3	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	144-146
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	123-127
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	168-170
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃	137-139
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	125-128
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	125-130
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	130-134
$\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_2\text{C}_2\text{H}_4\text{Cl}$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	n_D^{25} 1,5311
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃	80-84
$\text{O}(\text{CH}_2)_{11}\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃₀	

TABLA II (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
$\text{OCH}(\text{CH}_2)_9\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCHCH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCH}(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCH}_2\text{CH}_2-\text{C}=\text{CH}_2$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCH}_2\text{C}=\text{CHCH}(\text{CH}_3)_2$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
CH_2Cl	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCH}-\text{C}=\text{CH}_2$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
$\text{OCHCH}=\text{CF}_2$	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O

TABLE II (continuación)

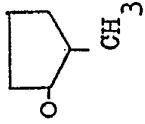
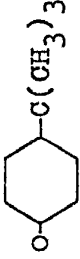
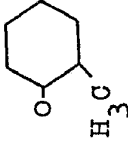
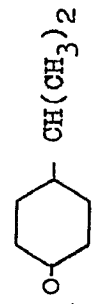
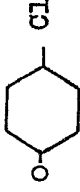
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃

TABLE II (continuación)

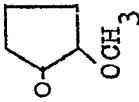
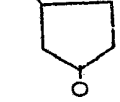
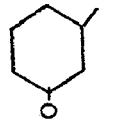

QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
O-cicloC ₈ H ₁₅	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O

TABLA II (continuación)

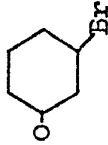
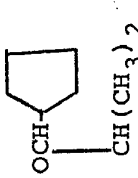
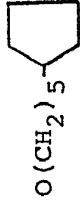

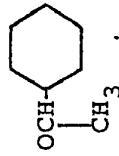
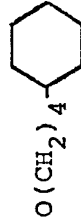
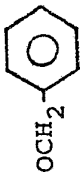
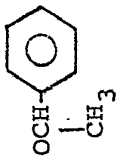
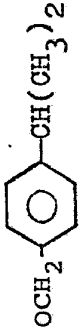
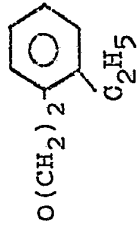
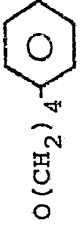
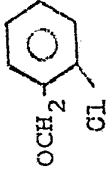
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃ O
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃

TABLA II (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P. f. °C
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	155-158
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	

0

0

TABLA II (continuación)


QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f.: °C
	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
O(CH ₂ CH ₂ O) ₄ CH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
O(CH ₂ CH ₂ O) ₃ C ₂ H ₅	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ C ₂ H ₄ Cl	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₃	
OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	185
OCH ₂ CH ₂ SC ₂ H ₅	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	185
O(CH ₂) ₃ SC ₂ H ₅	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	185
OCH ₂ CH ₂ SO ₂ C ₂ H ₅	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
O(CH ₂) ₃ SOCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃	
O-IC ₃ H ₇	H	H	O	H	H	CH ₃	N(CH ₃) ₂	151-157
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	142-145
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	100-105
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	vidrio
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	126-128

TABLA II (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y	P.f. °C
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CO ₂ CH ₃	176-178
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	105-110
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CF ₃	165-168
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	125-135
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	170-172
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCHCO ₂ CH ₃ CH ₃	vidrio
OCH(CH ₃) ₂	H	H	O	H	H	CH ₃	OCHCO ₂ CH ₃ CH ₃	vidrio
OCH ₃	H	H	O	H	H	H	OCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	nC ₄ H ₉	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ CN	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	(CH ₂) ₃ CN	
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	(CH ₂) ₄ CO ₂ CH ₃	

TABLA II (continuación)


QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ Cl
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	(CH ₂) ₃ Br
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	NHnC ₄ H ₉
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	-N(CH ₂) ₄ CN CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	-NCH ₂ CO ₂ CH ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	-NCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CCl ₃

TABLA II (continuación)


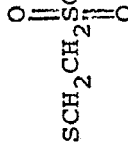
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CN
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ C≡CCH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ 
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	SCHCO ₂ CH ₃ CH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	O(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ 
OCH ₃	H	H	C	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ SCH(CH ₃) ₂
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₃

TABLA II (continuación)


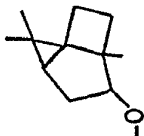

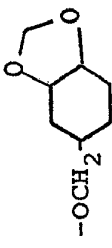
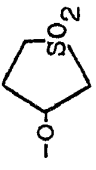
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CN
OCH ₃	H	H	O	H	H	CH ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
OCH ₂ - 	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	CH ₃	CH ₃

TABLA II (continuación)


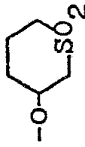
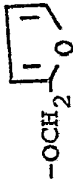
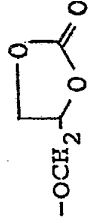
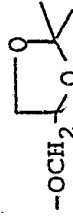
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃

TABLE II (continuación)

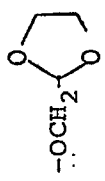
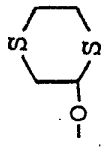
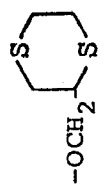
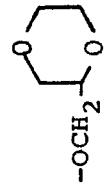
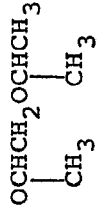
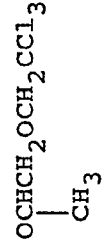

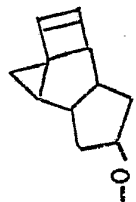
QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃

TABLA II (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₄	R ₅	X	Y
$O(CH_2CH_2O)_2$ 	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
$O(CHCH_2O)_2CH_2CH_2Cl$ CH ₃	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
$OCH_2CH_2SCH(CH_3)_2$	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
 OCH ₂ CN	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
$OC(CH_2)_3CH_3$ CN	H	H	O	H	H	OCH ₃	OCH ₃
$OCH_2-C=C-Cl$ ClCl	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃
$O(CH_2)_4-C=CCl_2$ Cl	H	H	O	H	H	OCH ₃	CH ₃

1

EJEMPLO 16

N-[(5,6-Dimetil-1,2,4-triazin-3-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida

5

A una suspensión agitada de 1,2 g de 3-amino-5,6-dimetil-1,2,4-triazina en 25 ml de acetonitrilo, anhidro se agregan a la temperatura ambiente 2,4 g de 2-metoxicarbonilbencenosulfonilisocianato. Después de agitar durante 24 horas a la temperatura ambiente, el precipitado resultante se separa por filtración para dar 2,5 g del compuesto deseado que funde a 150-151°. Presenta picos de absorción en infrarrojo a 1700, 1680 y 1550 cm^{-1} , concordantes con la N-[(5,6-dimetil-1,2,4-triazin-3-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida.

10

15

Siguiendo el procedimiento del Ejemplo 16, con una cantidad equivalente de una 3-amino-1,2,4-triazina y un bencenosulfonilisocianato o isotiocianato adecuadamente sustituido, pueden prepararse los compuestos de la Tabla III.

20

25

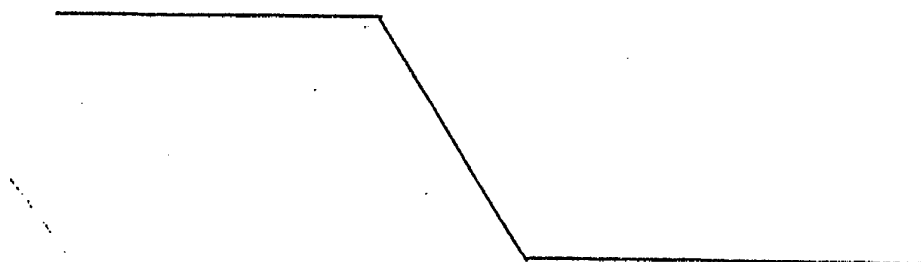


TABLE III

	QR	R ₂	R ₃	W	X ₁	Y ₁
OCH ₃		5-Cl	H	O	CH ₃	CH ₃
OCH ₃		5-NO ₂	H	O	CH ₃	CH ₃
OC ₂ H ₅		5-CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃
O- <i>i</i> -C ₃ H ₇		5-F	H	O	CH ₃	CH ₃
O- <i>n</i> -C ₄ H ₉		H	H	O	CH ₃	CH ₃
O- <i>sec</i> -C ₄ H ₉		H	H	O	CH ₃	CH ₃
O- <i>ter</i> -C ₄ H ₉		6-Cl	H	O	CH ₃	CH ₃
OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅		H	H	O	H	CH ₃
OCH ₃		H	H	S	CH ₃	CH ₃
OCH ₃		3-Cl	5-Cl	O	OCH ₃	OCH ₃

TABLA III (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	X ₁	Y ₁	P. f. °C
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	0	OCH ₃	OCH ₃	
OCHCH ₃ CH ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CCl ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CF ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CHCH ₃ CH ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
O(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	0	CH ₃	CH ₃	124-127
OCH ₂ CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCH-CHCH ₃ CH ₃ CH ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCH ₂ CBr ₃	H	H	0	CH ₃	CH ₃	
OCHCH ₂ Cl CH ₂ F	H	H	0	CH ₃	CH ₃	

1

EJEMPLO 17

N-[(2,6-Dimetilpirimidin-4-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbo-
nilbencenosulfonamida

5

A una suspensión de 1,2 g de 4-amino-2,6-dimetil-
pirimidina en 30 ml de acetonitrilo seco se añaden con agi-
tación 2,4 g de 2-metoxicarbonilbencenosulfonilisocianato.

10

La mezcla se agita durante 2 horas a la temperatura ambien-
te, se deja en reposo durante 16 horas y el producto desea-
do, que ha precipitado, se separa por filtración y se lava
con cloruro de butilo para dar 2,4 g de producto, p.f.

125-127°. El producto presenta picos de absorción por re-
sonancia magnética nuclear a 4,0, 2,62 y 2,9 ppm, concor-
dantes con los del producto.

15

Siguiendo el procedimiento del Ejemplo 17 con can-
tidades equivalentes de 4-aminopirimidinas adecuadas y sul-
fonilisocianatos o isotiocianatos apropiadamente sustituidos,
pueden prepararse los compuestos de la Tabla IV.

20

25

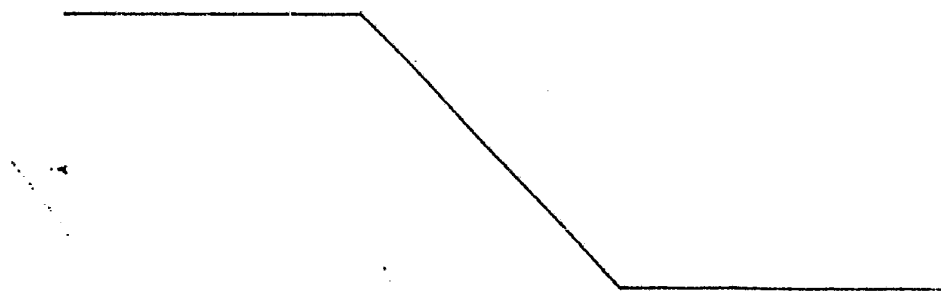
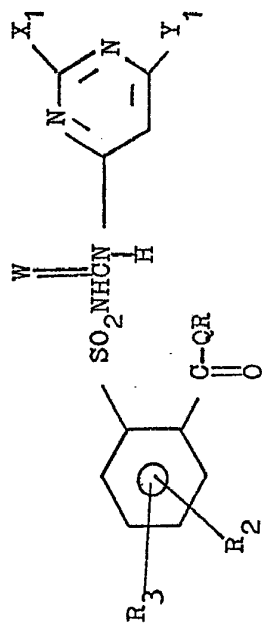


TABLA IV



QR	R ₂	R ₃	W	X ₁	Y ₁
OCH ₃	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
OCH ₃	H	H	O	CH ₃	OCH ₃
OC ₂ H ₅	6-Cl	H	O	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₃	3-Cl	5-Cl	O	OCH ₃	C ₂ H ₅
OCH ₃	5-OCH ₃	H	O	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₃	5-NO ₂	3-Cl	O	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃
OC ₂ H ₅	5-Cl	H	O	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃

TABLA IV (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	X ₁	Y ₁
$\begin{array}{c} \text{OCHCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Br}$	H	H	O	Cl	OCH ₃
OCH_2CF_3	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CHCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
$\text{O}(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{CHCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
OCH_2CBr_3	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCHCH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃

1 Utilizando una N-[(triazinil)aminocarbonil]-2-carbonilbencenosulfonamida o N-[(pirimidinil)aminocarbonil]-2-carbonilbencenosulfonamida apropiada, pueden prepararse los
5 el compuesto del Ejemplo 12 puede convertirse en N-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonil-N-metilbencenosulfonamida mediante la reacción de metilación indicada en la Ecuación 2, de la siguiente forma: Puede agregarse una cantidad equivalente de hidruro sódico (dispersión al 50 % en aceite mineral) a una solución del compuesto del
10 Ejemplo 12 en dimetilformamida, en atmósfera de nitrógeno. Cuando cesa el desprendimiento de hidrógeno, puede agregarse una cantidad equivalente de sulfato de dimetilo. La mezcla de reacción resultante puede agitarse durante 2 a 18 horas
15 y después la mezcla de reacción puede ser vertida en un gran volumen de agua para formar un precipitado que puede ser filtrado para dar el producto antes identificado.

20

25

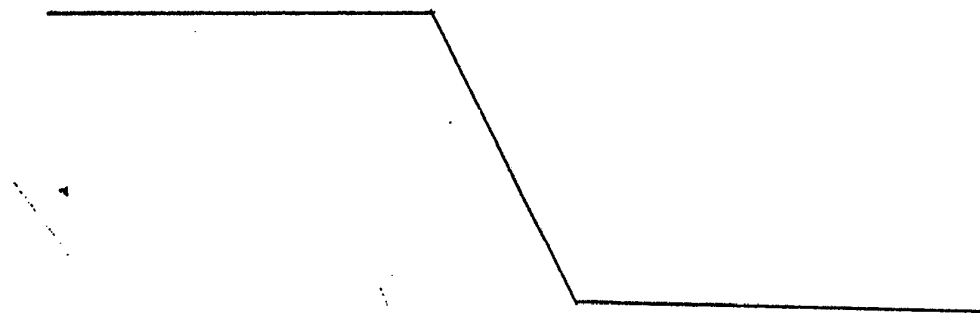
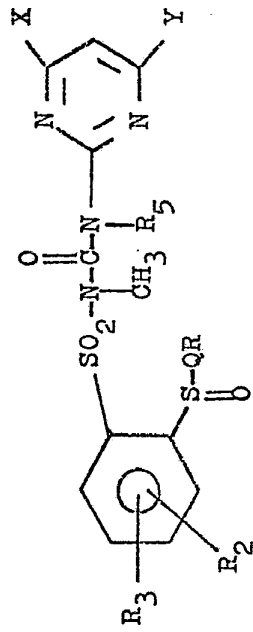


TABLA V-a

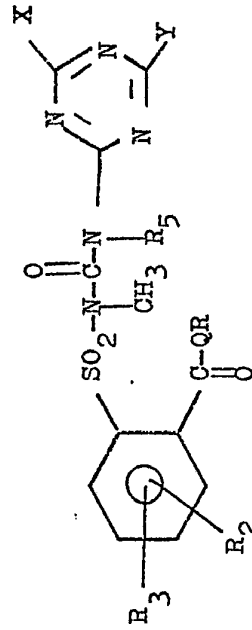


QR	R ₂	R ₃	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₃
OCH ₃	H	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
O-nC ₃ H ₇	H	H	H	CH ₃	CH ₃
O-iC ₃ H ₇	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₃	5-Cl	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCH ₃	3-Cl	6-Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₂
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
O(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
O(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₃

TABLA V-a (continuación)

QR	R ₂	R ₃	R ₅	X	Y
$\text{OCH}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_3$ CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH-CHCH_3 CH ₃ CH ₃	H	H	H	OCH ₃	CH ₃

TABLA V-b



QR	R ₂	R ₃	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
OCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
OC ₂ H ₅	5-NO ₂	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
O-nC ₄ H ₉	6-Cl	H	H	CH ₃	OCHCO ₂ CH ₃ CH ₃

TABLA V-b (continuación)

QR	R ₂	R ₃	R ₅	X	Y
$N(C_2H_5)_2$	H	H	CH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
$N-OCH_3$ CH ₃	H	H	H	OCH ₃	NH(CH ₃)
$O(CH_2)_9CH_3$	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
$O(CH_2CH_2O)_2C_2H_5$	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
$OCHCH_3$ CH ₃	H	H	H	OCH ₃	CH ₃
OCH_2CHCH_3 CH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₃
$O(CH_2)_4CH_3$	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃
$OCHCH_2CH_2CH_3$ CH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₃
$OCHCH_2CH_3$ CH ₂ CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃

TABLA V-b (continuación)

QR	R ₂	R ₃	R ₅	X	Y
$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	H	CH ₃	CH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCH-CHCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	H	CH ₃	CH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CBx}_3 \\ \\ \text{OCHCH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$	H	H	H	CH ₃ OCH ₃	CH ₃ CH ₃

1 Utilizando el cloruro de sulfonil-N-alquilbenceno-
carbamilo o el cloruro de tiocarbamilo adecuadamente sus-
tituidos y una aminopirimidina o aminotriazina apropiada,
pueden prepararse por el procedimiento de la Ecuación 5
5 los compuestos de Fórmula I descritos en la Tabla VI. Por
ejemplo, la N-[N-(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)-N-metil-
aminocarbonil]-2-metoxicarbonil-N-metilbencenosulfonamida
puede ser preparada por adición de 3,0 g de cloruro de N-
[(2-metoxicarbonilfenil)sulfonil]-N-metilcarbamilato en 50 ml
10 de tetrahidrofurano conteniendo 1,0 g de trietilamina a
1,5 g de 2-metilamino-4-metoxi-6-metilpirimidina. Esta mez-
cla puede ser agitada a reflujo durante varias horas; las
sales precipitadas pueden ser separadas por filtración y
el filtrado puede ser concentrado para dar el producto
15 antes mencionado.

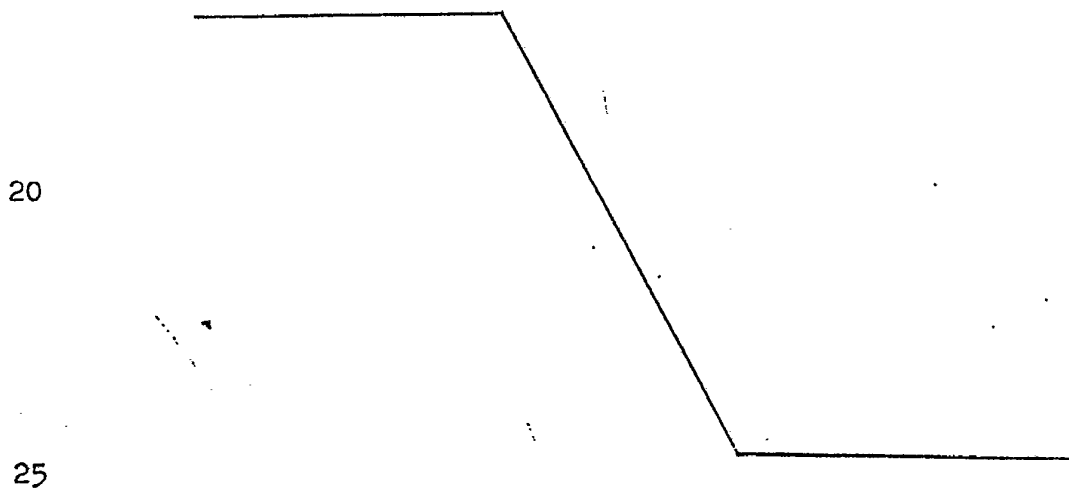
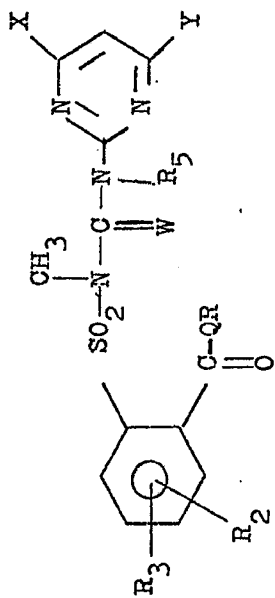


TABLA VI-a

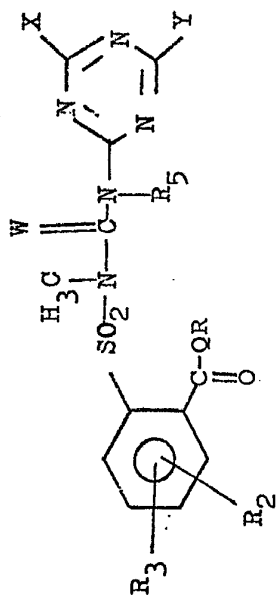


QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	S	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ H	H	H	S	H	CH ₃	CH ₃
OCH ₃	6-CH ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
O(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ CH ₂ Cl	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ CHCH ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
O(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

TABLA VI-a (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
$\text{OCHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
$\text{OCHCH}_2\text{CH}_3$ CH ₂ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
$\text{OCH}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_3$ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
OCH-CHCH_3 CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
OCH_2CBr_3	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
OCHCH_2Cl CH ₂ F	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}$	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH_2CCl_3	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃

TABLA VI-b



QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
OCH ₃	H	H	S	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
O-iC ₃ H ₇	5-F	H	S	CH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅
O(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
O(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ CHCH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
O(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCHCH ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

TABLA VI-b (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCH-CHCH}_3 \\ \quad \\ \text{CH}_3\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ CBF ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{OCHCH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃

1

EJEMPLO 18

N-[(4,6-Dimetilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-carboxiben-
cenosulfonamida

5 Se calienta en un baño de vapor, mientras se agita,
una mezcla de 2,0 g de N-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)amino-
carbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida y 11 ml de
solución acuosa de hidróxido sódico al 50 %; se añaden
40 ml de agua y se continúa calentando y agitando durante
10 la media hora siguiente. Después se filtra la solución re-
sultante y el filtrado se acidula con ácido clorhídrico has-
ta pH 2 para formar un precipitado que se aísla por filtra-
ción para obtener 0,7 g del compuesto del título que funde
a 160° con descomposición. El espectro de resonancia magné-
tica nuclear presenta picos de resonancia para los sustituy-
15 entes metilo del anillo de pirimidina a 2,66 ppm y para
los hidrógenos del anillo a 7,2 y 8,4 ppm. La desaparición
del pico de resonancia a 4,0 ppm confirma la conversión del
éster metílico en un grupo carboxi.

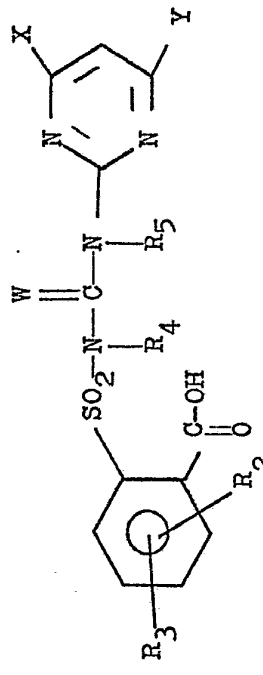
15

20

Utilizando una N-[(triazinil)aminocarbonil]-2-alcoxi-
carbonilbencenosulfonamida o una N-[(pirimidinil)aminocarbo-
nil]-2-alcoxicarbonilbencenosulfonamida apropiadas o sus
amfotioxometil-análogos (W = S), pueden prepararse los
compuestos de Fórmula I indicados en la Tabla VII por el
procedimiento del Ejemplo 18.

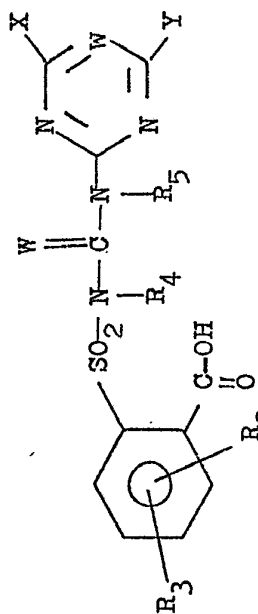
25

TABLA VII-a



R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	W	X	Y
H	H	H	H	O	CH ₃	OCH ₃
6-Cl	H	CH ₃	H	O	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃
6-Cl	H	H	H	S	OCH ₃	CH ₃
3-Cl	5-Cl	H	H	S	OCH ₃	N(CH ₃) ₂

TABLA VII-b

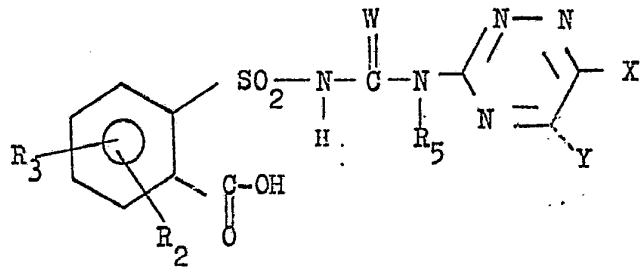


R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	W	X	Y
H	H	H	H	O	CH ₃	OCH ₃
H	H	H	H	S	OCH ₃	OCH ₃
4-Cl	6-Cl	H	H	O	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃

1

TABLA VII-c

5

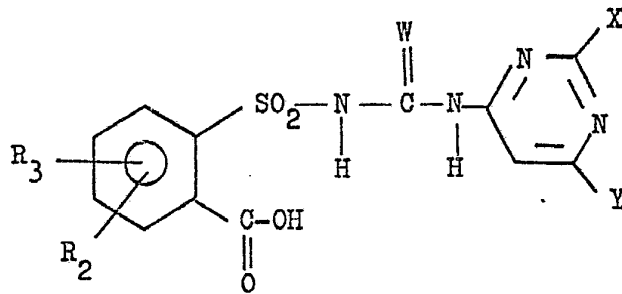


10

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	H	O	CH ₃	CH ₃
H	H	S	CH ₃	CH ₃

TABLA VII-d

15



20

<u>R₂</u>	<u>R₃</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>
H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
H	H	S	OCH ₃	OCH ₃
3-Cl	H	O	OCH ₃	CH ₃

25

EJEMPLO 19

N-[(4,6-Dimetilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-dimetilamino-
carbonilbencenosulfonamida

A 4,1 g de N-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-2-metoxicar-
bonil]bencenosulfonamida en 75 ml de tolueno se agregan
37 ml de una solución 3:5 de cloruro de metileno y tolueno
que contiene 1,25 g de dimetilamida de dimetilaluminio, agi-
tando a la temperatura ambiente. La mezcla se calienta a re-
flujo (82°C) durante 2 horas, se enfría, se añaden 10 ml de
metanol y los disolventes se evaporan a vacío. El residuo se
trata con una mezcla de metanol, agua y ácido clorhídrico
diluido y el producto precipitado se separa por filtración
para dar 1,25 g del producto deseado. Por extracción del fil-
trado acuoso en cloruro de metileno se obtienen 1,12 g más
de producto, p.f. 166-168°C. El producto presenta picos de
absorción de RMN a 2,5 ppm, metilo de pirimidina; 2,85 y 3,1
ppm, grupos metilo no equivalentes de la dimetilamida; 6,8
ppm, H de pirimidina y 7,2-8,4 ppm, hidrógenos aromáticos.

EJEMPLO 20

N-[(4,6-Dimetoxipirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-isopropilami-
carbonilbencenosulfonamida

A 4,5 g de N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)aminocarbonil]-
2-metoxycarbonilbencenosulfonamida en 75 ml de cloruro de me-
tileno se agregan con agitación, a la temperatura ambiente,
37 ml de una solución de cloruro de metileno que contiene

1 1,44 g de isopropilamida de dimetilaluminio. La mezcla se
calienta a reflujo y el cloruro de metileno se separa por
destilación mientras se agrega tolueno seco hasta que se al-
canza una temperatura de 100°C. Se continúa calentando a re-
5 flujo durante 2 horas a 100°C y después la mezcla se enfría,
se agregan 10 ml de metanol y se evaporan los disolventes
a vacío. Después el residuo se tritura con una mezcla de me-
tanol, agua y HCl diluido y el producto se extrae de esta
suspensión acuosa con cloruro de metileno. Por evaporación
10 del extracto en cloruro de metileno se obtienen 4,28 g del
producto en forma sólida. Por trituración del producto con
1-clorobutano se obtienen 2,0 g de producto puro, p.f.
148-150°C, que muestra una sola mancha por cromatografía en
capa fina (gel de sílice, acetona/hexano 1:1, $R_f = 0,34$) y
15 presenta picos de absorción en el espectro de RMN a 1,15,
4,0, 3,8-4,3 y 7,5-8,2 ppm.

Análisis elemental para $C_{17}H_{21}N_5O_6S$:

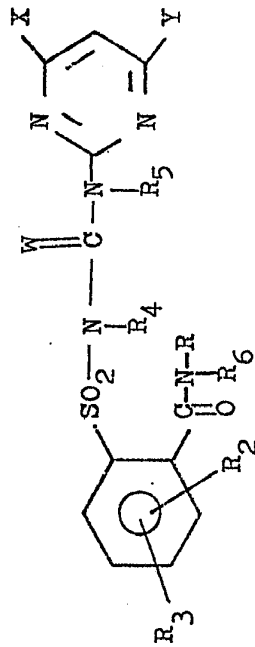
Calculado : C, 48,2; H, 4,96; N, 16,5

Encontrado: C, 48,1; H, 5,20; N, 16,0

20 Siguiendo el procedimiento de los Ejemplos 19 y 20 con
cantidades equivalentes de dialquilaluminio-N-alkilamida
adecuadamente sustituida y ésteres de esta invención adecua-
damente sustituidos, pueden prepararse los compuestos de la
Tabla VIII.

25

TABLA VIII-a



R	Benzene ring substituents						Thiazole ring substituents		P. f. (°C)
	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y		
CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	184-185	
CH ₃	H	H	H	H	H	H	OCH ₃	168-170	
nC ₃ H ₇	H	H	H	H	H	H	OCH ₃		
iC ₃ H ₇	5-Cl	H	H	H	H	H	CH ₃		
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H	H	H	OCH ₃	95-102	
H	H	H	H	H	H	H	CH ₃		
CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	166-168	
iC ₃ H ₇	H	H	H	H	H	H	OCH ₃	148-150	
nC ₃ H ₇	H	H	H	H	H	C ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂		

TABLE VIII-a (continuación)


R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y	P. f. (°C)
(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃ O	
(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃ O	65-70
iC ₃ H ₇	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	157-158
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
H	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	148-150
CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	116
	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	127-130
CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	162-165
C ₂ H ₅	H	H	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	
C ₂ H ₅	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	
C ₂ H ₅	H	H	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	
nC ₄ H ₉	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
CHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	

TABLA VIII-a (continuación)

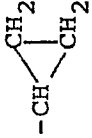
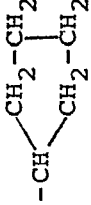



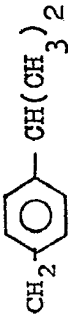
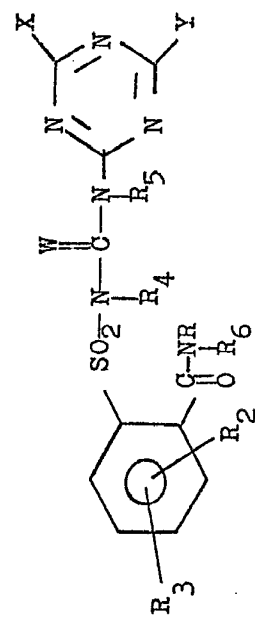
R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y	P.f. (°C)
iC ₃ H ₇	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	179
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	122-124
	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	
(CH ₂) ₃ OCH ₃	H	H	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	
CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
CH(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
CH(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	

TABLA VIII-a (continuación)

R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y	P.f. (°C)
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	175-177
-(CH ₂) ₄ -*	H	H	H	H	*	CH ₃	OCH ₃	189-191
-(CH ₂) ₄ -*	H	H	H	H	*	OCH ₃	OCH ₃	180-181
-(CH ₂) ₄ -*	H	H	H	H	*	CH ₃	CH ₃	
-(CH ₂) ₅ -*	H	H	H	H	*	CH ₃	CH ₃	
-(CH ₂) ₅ -*	H	H	H	H	*	OCH ₃	CH ₃	
-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -*	H	H	H	H	*	OCH ₃	CH ₃	162-164
-(CH ₂) ₂ N(CH ₂) ₂ -* CH ₃	H	H	H	H	*	OCH ₃	CH ₃	
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃	112-117
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	75-85

* R y R₆ están unidos entre sí.

TABLA VIII-b




R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y	P.f. °C
CH ₃	H	H	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃	166-168
CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	172
C ₂ H ₅	5-Cl	H	CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	
CH ₃	4-Cl	6-Cl	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	
(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	107-109
CHC ₆ H ₅ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃ O	
CH ₂ - 	H	H	H	H	H	CH ₃ O	CH ₃ O	217-220

TABLA VIII-b (continuación)

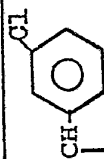
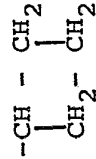
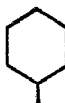
R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y	P.f. °C
	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃ O	
CH ₂ CH ₃								
i-C ₃ H ₇	H	H	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃	102
sec-C ₄ H ₉	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	
C ₂ H ₅	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	
sec-C ₄ H ₉	H	H	H	H	i-C ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	H	H	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	127-130
CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃	118-120
(CH ₂) ₂ OCH ₃	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅	
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H	H	OCH ₃	OCH ₃	
-(CH ₂) ₄ -*	H	H	H	H	*	CH ₃	OCH ₃	
-(CH ₂) ₅ -*	H	H	H	H	*	CH ₃	OCH ₃	

TABLA VIII-b (continuación)


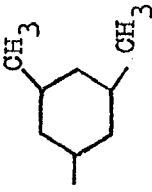
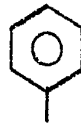
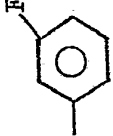

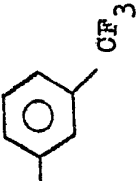
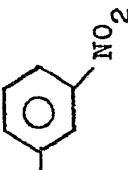
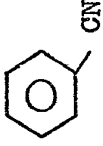
R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y
$-(CH_2)_6^*$	H	H	H	H	*	CH ₃	OCH ₃
nC_4H_9	H	H	H	H	nC_3H_7	CH ₃	OCH ₃
$(CH_2)_6CH_3$	H	H	H	H	nC_3H_7	CH ₃	OCH ₃
$CH(CH_2)_4CH_3$ CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
ciclo-C ₈ H ₁₅	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃

TABLA VIII-b (continuación)

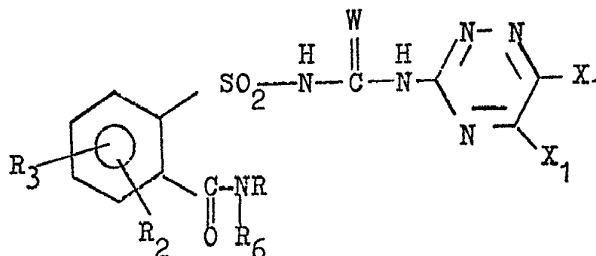
R	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	X	Y
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃
	H	H	H	H	H	CH ₃	OCH ₃

* R y R₆ están unidos entre sí.

1

TABLA VIII-c

5



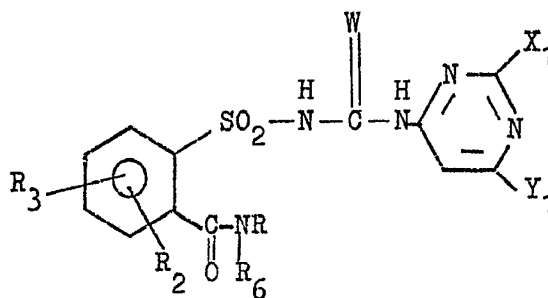
10

R	R ₂	R ₃	W	R ₆	X ₁	Y ₁
H	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
CH ₃	5-Cl	H	S	H	OCH ₃	OCH ₃
CH ₃	6-Cl	H	S	H	CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
sec-C ₄ H ₉	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

15

TABLA VIII-d

20



25

R	R ₂	R ₃	W	R ₆	X ₁	Y ₁
CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	5-Cl	H	O	H	CH ₃	OCH ₃
i-C ₃ H ₇	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

1

EJEMPLO 21

N-[(4-Metoxi-6-metiltriazin-2-il) aminocarbonil]-2-(metiltio)-
carbonilbencenosulfonamida

5

Se introducen con una jeringa 6,0 ml de trimetilaluminio
2M en 15 ml de tolueno seco en atmósfera de nitrógeno y se
añaden poco a poco 3,8 g de N-[(4-metoxi-6-metiltriazin-2-il)-
aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida. Después
de agitar a la temperatura ambiente durante una hora, se ha-
ce pasar metilmercaptano gaseoso a través de la mezcla de
10 reacción hasta que cede el aumento de temperatura inicial,
en cuyo momento se interrumpe la adición. La mezcla de reac-
ción se continúa agitando a la temperatura ambiente durante
una hora y se apaga con 25 ml de HCl al 10 %. La suspensión
blanca resultante se filtra para dar 2,9 g de un sólido blan-
15 co que presenta picos de absorción en infrarrojo a 1740 y
1690 cm^{-1} , concordantes con la N-[(4-metoxi-6-metiltriazin-
2-il) aminocarbonil]-2-(metiltio) carbonilbencenosulfonamida.

15

EJEMPLO 22

N-[(4-Metoxi-6-metilpirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-(n-bu-
20 tiltio) carbonilbencenosulfonamida

20

Se introducen con una jeringa 1,5 ml de trimetilaluminio
2M en 5,0 ml de tolueno seco en atmósfera de nitrógeno y se
añaden poco a poco 0,54 g (0,006 moles) de N-butanotiol en
2,0 ml de tolueno. Se añaden poco a poco 0,95 g de N-[(4-me-
25 toxi-6-metilpirimidin-2-il) aminocarbonil]-2-metoxicarbonil-

25

1 bencenosulfonamida y la mezcla se calienta a 80°C durante
3 horas. Después de enfriar a la temperatura ambiente, la
mezcla se apaga con 25 ml de HCl al 10 %. Se añade cloruro
de metileno, se separa, se seca sobre sulfato magnésico,
5 se filtra y se evapora para dar un aceite crudo. Por tritura-
ción con hexano se obtienen 0,6 g de un sólido blanco, p.f.
115-120°C, que presenta picos de absorción en infrarrojo
a 1725, 1680, 1600 y 1560 cm^{-1} , concordantes con la N-[(4-
metoxi-6-metilpirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-(N-butiltio)-
10 carbonilbencenosulfonamida.

EJEMPLO 23

N-[(4-Metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-
isopropiltiocarbonilbencenosulfonamida

15 A 1,5 ml de trimetilaluminio (2N) en 5 ml de tolueno se-
co bajo nitrógeno se añaden gota a gota 0,48 g (6,0 milimo-
les) de 2-propanotiol en 2 ml de tolueno. El reactivo de
aluminio resultante se agita a la temperatura ambiente
durante 15 minutos y se agregan de una sola vez 0,95 g
(2,5 milimoles) de N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-
20 aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida. La sus-
pensión se calienta a 80°C durante 3 horas, se enfría a la
temperatura ambiente y se añaden 15 ml de HCl al 10 %. Se
agita la mezcla hasta que precipita un sólido fino que se
separa por filtración, se lava con hexano y se seca al aire
25 para dar 0,4 g de producto que funde a 155-158°C. Presenta

1 picos de absorción en infrarrojo concordantes con la N-[(4-
metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-isopro-
piltiocarbonilbencenosulfonamida.

5 Siguiendo los procedimientos de los Ejemplos 21 a 23 con
cantidades equivalentes de alquiltiolatos de dialquilalumi-
nio adecuadamente sustituidos y ésteres adecuadamente susti-
tuídos de esta invención, pueden prepararse los compuestos
de la Tabla IX.

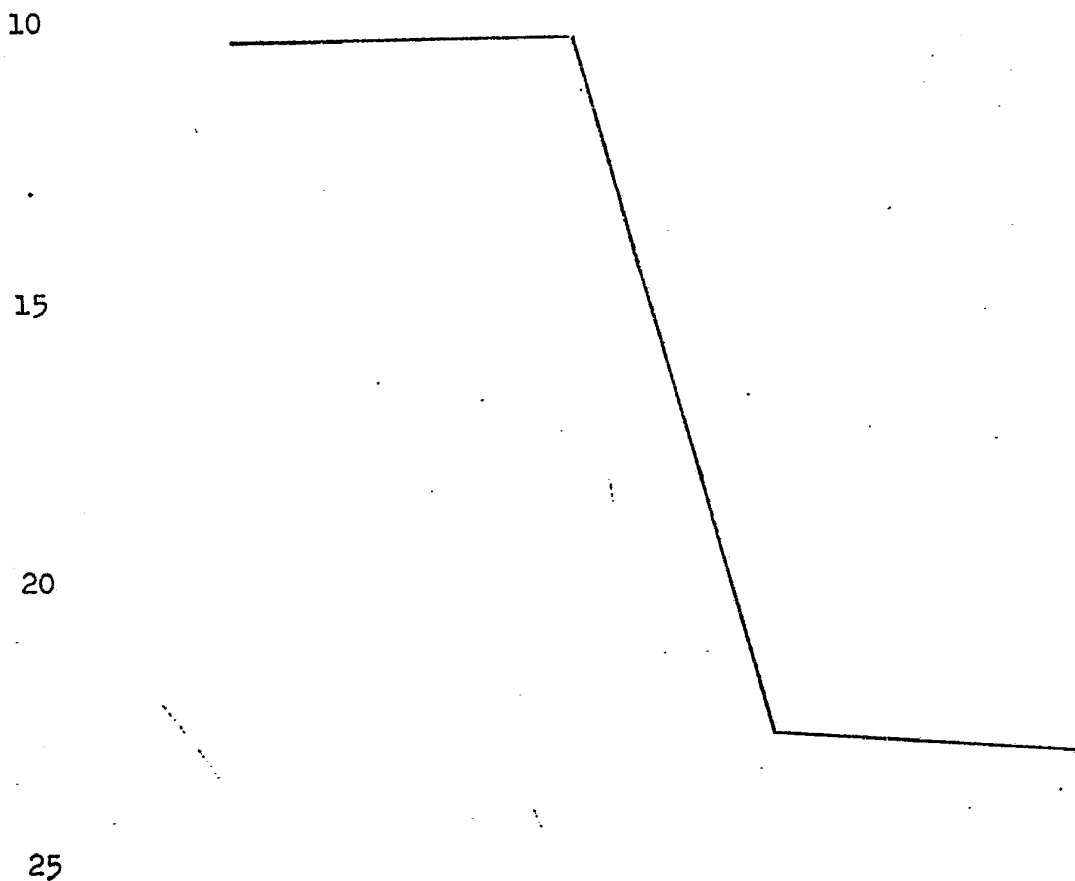
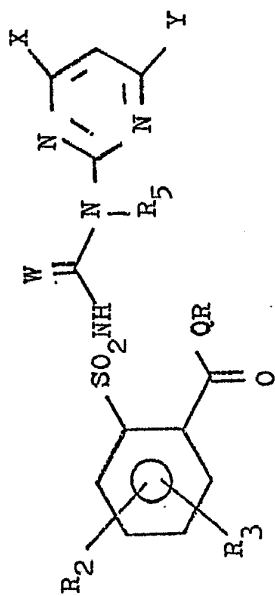


TABLA IX-a



QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P. f. (°C)
SCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
SCH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
SC ₂ H ₅	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	
S-n(C ₇ H ₁₅)	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	
SCHCH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	143-146
SCHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
SCH(CH ₂) ₉ CH ₃ CH ₃	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	

TABLA IX-a (continuación)

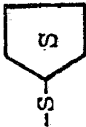
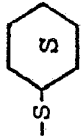

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. (°C)
$\begin{array}{c} \text{SCHCH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
$\begin{array}{c} \text{SCH}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2\text{-Cl} \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	133-136
$\begin{array}{c} \text{SCHCH}_2\text{CHBr} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
$\begin{array}{c} \text{SCHCH}_2\text{CCL}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
S-cíclo-C ₈ H ₁₅	H	H	O	H	CH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLA IX-a (continuación)


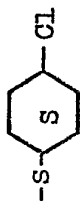
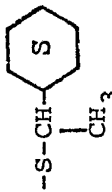

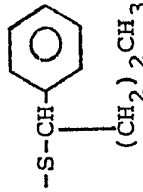
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. (°C)
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	148-150
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLA IX-a (continuación)

P.f. (°C)

Y

X

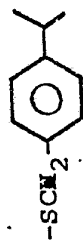
R₅

W

R₃

R₂

QR



CH₃

CH₃

H

O

H

H



CH₃

CH₃

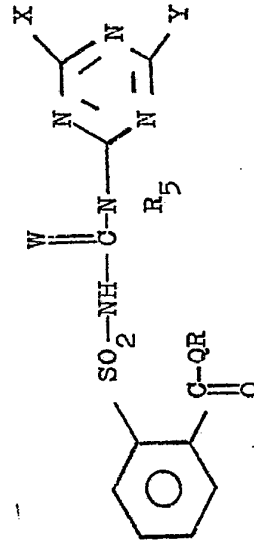
H

O

H

H

TABLA IX-b



P.f. (°C)

Y

X

R₅

W

R₃

R₂

QR

144-146

OCH₃

CH₃

H

O

H

H

SCH₃

OCH₃

OCH₃

H

O

H

H

SC₂H₅

OCH₃

OCH₃

H

O

H

H

S-n(C₅H₁₁)

TABLA IX-b (continuación)

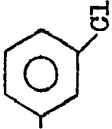
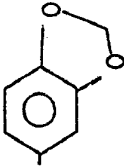
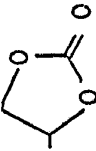
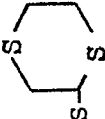
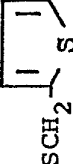
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. (°C)
S-n(C ₈ H ₁₇)	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃	
S-n(C ₄ H ₉)	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	115-120
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLE IX-b (continuación)

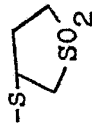

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. (°C)
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	
S(CH ₂) ₈ CH=CH ₂	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLE IX-b (continuación)

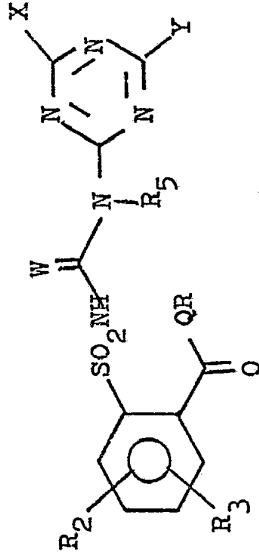
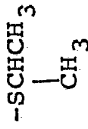
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. (°C)
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	177-178
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	

TABLA IX-b (continuación)



QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
$\begin{array}{c} \text{SCHCH}_2\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
$\begin{array}{c} \text{SCH}(\text{CH}_2)_9\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	OCH ₃
$\begin{array}{c} \text{SCHCH}_2\text{Cl} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
$\begin{array}{c} \text{SCH}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃
$\begin{array}{c} \text{---S---} \\ \text{---} \end{array}$ 	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
$\begin{array}{c} \text{---S---} \\ \text{---} \end{array}$ 	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

TABLA IX-b (continuación)

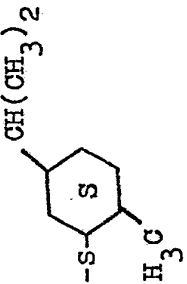

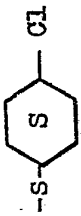
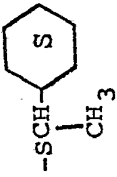

QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y	P.f. (°C)
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃	
	H	H	O	H	OCH ₃	CH ₃	125-130

TABLA IX-b (continuación)

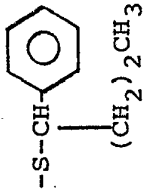
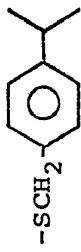
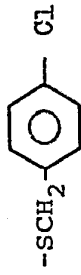
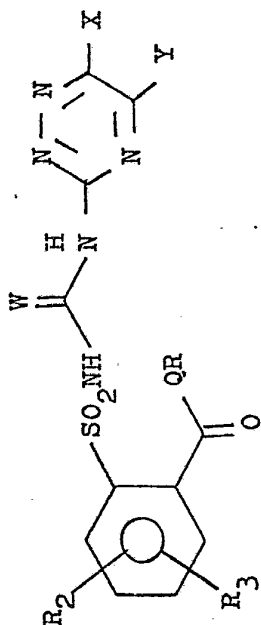
QR	R ₂	R ₃	W	R ₅	X	Y
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃
	H	H	O	H	CH ₃	CH ₃

TABLA IX-C



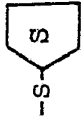
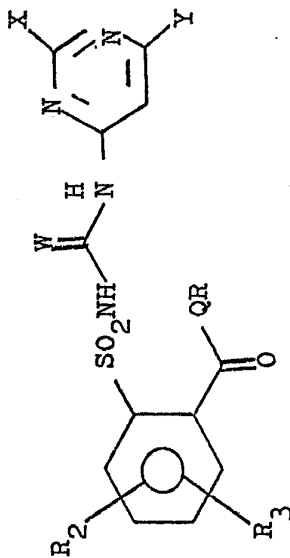
QR	R ₂	R ₃	W	X	Y
SCHCH ₃ CH ₃	H	H	O	CH ₃	CH ₃
SCHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
SCH ₂ CH ₃	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
-S- 	H	H	O	CH ₃	CH ₃
SCHCH ₂ CCl ₃ CH ₃	H	H	C	CH ₃	CH ₃

TABLA IX-c (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	X	Y
S-n(C ₃ H ₇)	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃
SCH ₃	H	H	O	CH ₃	CH ₃

TABLA IX-d




QR	R ₂	R ₃	W	X	Y
SCHCH ₃ CH ₃	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
SCHCH ₂ CH ₃ CH ₃	H	H	O	OCH ₃	CH ₃
-S- 	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃

TABLA IX-d (continuación)

QR	R ₂	R ₃	W	X	Y
SCHCH ₂ CCl ₃ CH ₃	H	H	O	CH ₃	CH ₃
SCH ₃	H	H	O	CH ₃	OCH ₃
S-n (C ₅ H ₁₁)	H	H	O	OCH ₃	OCH ₃

1. Formulaciones

Las formulaciones útiles de los compuestos de Fórmula I pueden prepararse por métodos convencionales. Pueden ser polvos finos, gránulos, granzas, suspensiones, emulsiones, 5 polvos mojables, concentrados emulsionables y similares. Muchas de ellas pueden ser aplicadas directamente. Las formulaciones pulverizables pueden ser diluídas con medios adecuados y utilizadas a volúmenes de pulverización de algunos litros a varios centenares de litros por hectárea. Las 10 formulaciones, en términos generales, contienen alrededor de 0,1 a 99 % en peso de uno o varios ingredientes activos y por lo menos uno de los siguientes ingredientes: a) alrededor de 0,1 a 20 % de uno o varios agentes tensoactivos y b) alrededor de 1 a 99,9 % de uno o varios diluyentes sólidos o líquidos. Más específicamente, contienen estos 15 ingredientes en las proporciones aproximadas indicadas en la Tabla X.

TABLA X

	Porcentaje en peso*		
	<u>Ingrediente activo</u>	<u>Diluyen te(s)</u>	<u>Agente(s) tensoactivo(s)</u>
20 Polvos mojables	20-90	0-74	1-10
Suspensiones y emulsiones oleosas (incluídos los concentrados emulsionables)	3-50	40-95	0-15
25 Suspensiones acuosas	10-50	40-84	1-20

1

TABLA X (continuación)

	Porcentaje en peso*		
	<u>Ingrediente activo</u>	<u>Diluyente(s)</u>	<u>Agente(s) tensoactivo(s)</u>
Polvos finos	1-25	70-99	0-5
5 Gránulos y granzas	0,1-95	5-99,9	0-15

* El ingrediente activo más por lo menos uno de los ingredientes agente tensoactivo o diluyente es igual al 100 % en peso.

10

Naturalmente, pueden utilizarse proporciones mayores o menores de ingrediente activo, de acuerdo con el uso pretendido y las propiedades físicas del compuesto. Algunas veces son convenientes unas relaciones mayores de agente tensoactivo a ingrediente activo y se consiguen por incorporación a la formulación o por mezclado en tanque.

15

Algunos diluyentes sólidos típicos están descritos en la obra de Watkins y colaboradores, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", segunda edición, Dorland Books, Caldwell, New Jersey, pero pueden utilizarse otros sólidos, ya sean minerales o manufacturados. Los diluyentes más absorbentes se prefieren para los polvos mojables y los más densos para los polvos finos. Los diluyentes y disolventes líquidos típicos están descritos en la obra de Marsden, "Solvents Guide", segunda edición, Interscience, New York, 1950. Para los concentrados en suspensión se prefiere una solubilidad inferior al 0,1 %; preferiblemente,

20

25

1 los concentrados en solución son estables contra la se-
paración de fases a 0°C. La obra "McCutcheon's Detergents
and Emulsifiers Annual", MC Publishing Co., Ridgewood, New
Jersey, así como la de Sisely y Wood, "Encyclopedia of
5 Surface Active Agents", Chemical Publishing Co., Inc.,
New York, 1964, contiene listas de agentes tensoactivos y
sus aplicaciones recomendadas. Todas las formulaciones pue-
den contener cantidades minoritarias de aditivos para redu-
cir la formación de espuma, el apelmazamiento, la corrosión,
10 el crecimiento microbiológico, etc.

Los métodos de preparación de estas composiciones son
muy conocidos. Las soluciones se preparan simplemente mez-
clando los ingredientes. Las composiciones sólidas finas se
preparan mezclando y habitualmente moliendo, por ejemplo
15 en un molino de martillos o de energía fluida. Las suspen-
siones se preparan por molienda en mojado (véase, por ejem-
plo, la patente estadounidense 3.060.084 de Littler). Los
gránulos y granzas pueden prepararse pulverizando el mate-
rial activo sobre vehículos granulados preformados o por
20 técnicas de aglomeración. Véase J.E. Browning, "Agglomera-
tion", Chemical Engineering, 4 de Diciembre de 1967, pág.
147ff y "Perry's Chemical Engineer's Handbook", Cuarta edi-
ción, McGraw-Hill, New York, 1963, págs. 8-59ff.

Para más información relativa a la técnica de la for-
25 mulación, véanse, por ejemplo, las siguientes referencias:

1 H.M. Loux, patente estadounidense 3.235.361, columna 6, línea 16 a columna 7, línea 19 y Ejemplos 10 a 41.

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

H. Gysin y E. Knusli, patente estadounidense número 2.891.855, columna 3, línea 66 a columna 5, línea 17 y Ejemplos 1 a 4.

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

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

15 Salvo indicación en contrario, todas las partes están dadas en peso en los siguientes ejemplos.

EJEMPLO 24

Polvo mojable

20	N-[(4,6-Dimetoxipirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	95 %
	Diocilsulfosuccinato sódico	0,1 %
	Ligninsulfonato sódico	1 %
	Sílice sintética fina	4 %

25 Los ingredientes se mezclan y se muelen en un molino de martillos para producir partículas casi todas las cuales tienen un tamaño inferior a 100 micras. Este material

1 se tamiza por un tamiz del n° 50 de las Normas de Estados Unidos y se empaqueta.

EJEMPLO 25

Gránulos

5 Polvo mojable del Ejemplo 23 10 %
Gránulos de atapulgita (tamiz n° 20-40 de las Normas de Estados Unidos ; 0,84-0,42 mm) 90 %

10 Una suspensión del polvo mojable que contiene 50 % de sólidos se pulveriza sobre la superficie de los gránulos de atapulgita en una mezcladora de doble cono. Los gránulos se secan y empaquetan.

EJEMPLO 26

Polvo mojable

15 N-[(4-Metil-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino-carbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida 40 %
Dioctilsulfosuccinato sódico 1,5 %
Ligninsulfonato sódico 3 %
Metilcelulosa de baja viscosidad 1,5 %
Atapulgita 54 %

20 Los ingredientes se mezclan bien y se pasan por un molino neumático para producir un tamaño medio de partícula inferior a 15 micras, se mezclan de nuevo y se tamizan por un tamiz del n° 50 de las Normas de Estados Unidos (aperturas de 0,3 mm) antes de empaquetar.

25

1

EJEMPLO 27

Gránulos

Polvo mojable del Ejemplo 25	25 %
Yeso	64 %
5 Sulfato potásico	11 %

Los ingredientes se mezclan en una mezcladora giratoria y se pulveriza agua sobre esta mezcla para efectuar la granulaci3n. Cuando la mayor parte de los gránulos han alcanzado un tama1o de 1,0 a 0,42 mm (tamices n° 18 a 10 40 de las Normas de Estados Unidos), se retiran, se secan y se tamizan. El material de tama1o excesivo se machaca para producir material adicional del tama1o deseado. Los gránulos resultantes contienen 10 % del ingrediente activo.

EJEMPLO 28

15

Polvo mojable

N-[(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	65 %
Eter dodecilfenílico de polietilenglicol	2 %
Ligninsulfonato sódico	4 %
20 Silicoaluminato sódico	6 %
Montmorillonita (calcinada)	23 %

Los ingredientes se mezclan bien. Se agrega el agente tensoactivo líquido pulverizándolo sobre los ingredientes sólidos contenidos en una mezcladora. Después de moler en 25 un molino de martillos para producir partículas casi todas

1 ellas de un tamaño inferior a 100 micras, el material
se vuelve a mezclar, se tamiza por un tamiz del n° 50
de las Normas de Estados Unidos (aperturas de 0,3 mm) y
se empaqueta.

5

EJEMPLO 29

Suspensión oleosa

N-[(4-metil-6-metoxipirimidin-2-il)aminocarbo- nil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	25 %
Hexaoleato de polioxietilensorbitol	5 %
Aceite hidrocarbonado altamente alifático	70 %

10

Los ingredientes se muelen juntos en un molino de arena hasta que el tamaño de las partículas sólidas se ha reducido a menos de unas 5 micras. La suspensión resultante puede ser aplicada directamente pero es preferible aplicarla después de haberla extendido con aceites o emulsionado con agua.

15

EJEMPLO 30

Suspensión acuosa

N-[(4,6-Dimetil-1,3,5-triazin-2-il)aminocarbo- nil]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	25 %
Atapulgita hidratada	3 %
Ligninsulfonato cálcico crudo	10 %
Dihidrógeno-fosfato sódico	0,5 %
Agua	61,5 %

20

25

Los ingredientes se muelen juntos en un molino de bolas o rodillos hasta que las partículas sólidas se han re-

1 ducido a un tamaño inferior a 10 micras y después se empaquetan.

EJEMPLO 31

Granzas extruídas

5	N-[(4,6-Dimetilpirimidin-2-il) aminocarbo- nil] -2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	25 %
	Sulfato sódico anhidro	10 %
	Ligninsulfonato cálcico crudo	5 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	1 %
	Bentonita cálcica/magnésica	59 %

10

Los ingredientes se mezclan, se muelen a martillos y después se humedecen con alrededor del 12 % de agua. La mezcla se extruye en forma de cilindros de unos 3 mm de diámetro que se cortan para producir granzas de unos 3 mm de longitud. Las granzas pueden ser utilizadas directamente, después de secas, o las granzas secas pueden ser machacadas hasta que atraviesan un tamiz del n° 20 de las Normas de Estados Unidos (aperturas de 0,84 mm). Los gránulos retenidos en un tamiz del n° 40 (aperturas de 0,42 mm) pueden ser empaquetados para uso y los finos reciclados.

15

20

EJEMPLO 32

Solución

	N-[(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il) aminocarbo- nil] -2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	5 %
	Dimetilformamida	95 %

25

Los ingredientes se combinan y agitan para producir

1 una solución que puede ser utilizada para aplicaciones de volumen reducido.

EJEMPLO 33

Polvo mojable

5	N-[(4,6-Dimetilpirimidin-2-il)aminocarbonyl]-2-metoxicarbonilbencenosulfonamida	80 %
	Alquilnaftalensulfonato sódico	2 %
	Ligninsulfonato sódico	2 %
	Sílice amorfa sintética	3 %
	Caolinita	13 %

10

Los ingredientes se mezclan bien y después se muelen en un molino de martillos para producir partículas prácticamente todas ellas de un tamaño inferior a 100 micras; el material se vuelve a mezclar, se tamiza por un tamiz del n° 50 de las Normas de Estados Unidos y se empaqueta.

15

UTILIDAD

Los compuestos de esta invención son herbicidas muy activos. Son útiles para el control de pre-emergencia y/o post-emergencia de un amplio espectro de malas hierbas, en zonas donde se desea un control completo de toda la vegetación, tales como alrededor de los tanques de almacenamiento de combustible, polvorines, zonas de almacenamiento industrial, campos de pozos de petróleo, teatros donde se entra con el coche, alrededor de los carteles de anuncios, carreteras y estructuras del ferrocarril. Seleccionando

25

1 adecuadamente la proporción y el tiempo de aplicación,
los compuestos de esta invención pueden utilizarse también
para modificar beneficiosamente el crecimiento de las plan-
tas y para el control selectivo de las malas hierbas en
5 los cultivos como trigo y cebada.

La cantidad exacta de compuesto de Fórmula I a utili-
zar en cualquier situación dada varía con el resultado fi-
nal determinado deseado, la cantidad de follaje presente,
las malas hierbas a controlar, la especie cultivable, el
10 tipo de terreno, la formulación y el modo de aplicación,
las condiciones atmosféricas, etc. Como intervienen tantas
variables, no es posible establecer una proporción de apli-
cación adecuada para todas las situaciones. En términos ge-
nerales, los compuestos de esta invención se utilizan en
15 proporciones de aproximadamente 0,005 a 20 kg/Ha, con una
proporción preferida de 0,125 a 10 kg/Ha. En general, las
proporciones más altas de aplicación dentro de este inter-
valo se seleccionan para las condiciones adversas o cuando
se desea una persistencia prolongada en el terreno y las
20 proporciones más bajas para el control selectivo de las ma-
las hierbas en los cultivos.

Las combinaciones de los compuestos de Fórmula I con
herbicidas conocidos también permiten controlar eficazmente
las malas hierbas en pequeños cultivos gramíneos tales como
25 trigo y cebada. Los herbicidas típicos que pueden utilizarse

1 son chlorotoluron [3-(3-cloro-4-metilfenil)-1,1-dimetil-
urea], MCPP [ácido(+)-2-(4-cloro-2-metilfenoxi)propanoico],
metoxuron [3-(3-cloro-4-metoxifenil)-1,1-dimetilurea],
methabenzthiazuron [1-(benzotiazol-2-il)-1,3-dimetilurea],
5 dichlofop [2-[4-(2,4-diclorofenoxi)fenoxi]propanoato de me-
tilo], tri-allate [di-isopropiltiocarbamato de S-2,3-diclo-
roalilo], isoproturon [3-(4-isopropilfenil)-1,1-dimetil-
urea] o difenzoquat [ion 1,2-dimetil-3,5-difenilpirazolio].

Los compuestos de Fórmula I también pueden combinarse
10 con otros herbicidas y son especialmente útiles en combina-
ción con ureas, como 3-(3,4-diclorofenil)-1,1-dimetilurea,
3-(3,4-diclorofenil)-1-metoxi-1-metilurea y 1,1-dimetil-
3-(α,α,α -trifluor-m-tolil)urea; las triazinas como 2-clo-
ro-4-(etilamino)-6-(isopropilamino)-s-triazina; los ura-
15 cilos como 5-bromo-3-sec-butil-6-metiluracilo; N-(fosfono-
metil)-glicina; 3-ciclohexil-1-metil-6-dimetilamino-s-tri-
azin-2,4(1H,3H)-diona; N,N-dimetil-2,2-difenilacetamida;
ácido 2,4-diclorofenoxiacético (y compuestos estrechamente
relacionados); 4-cloro-2-butil-3-clorofenilcarbamato;
20 éster S-(2,3,3-tricloroalílico) del ácido diisopropiltio-
carbámico; N-benzoil-N-(3,4-diclorofenil)-2-aminopropiona-
to de etilo; 4-amino-6-ter-butil-3-(metiltio)-1,2,4-triazin-
5(4H)-ona; 2,2-dióxido de 3-isopropil-1H-2,1,3-benzotio-
diazin-(4)-3H-ona; α,α,α -trifluor-2,6-dinitro-N,N-dipropil-
25 p-toluidina; ion 1,1'-dimetil-4,4'-dipiridinio; metanoarso-

1 nato monosódico y 2-cloro-2',6'-dietyl(metoximetil)acetani-
lida.

5 La actividad de estos compuestos fué descubierta en
diversos ensayos en invernadero y en campo. Los ensayos,
así como los datos obtenidos en los mismos, están descri-
tos a continuación. Las clasificaciones se basan en una
escala numérica que se extiende desde 0 = efecto nulo hasta
10 = efecto máximo. Los símbolos descriptivos que acompañan
a estas puntuaciones tienen los siguientes significados:

- 10 C = clorosis o necrosis
D = defoliación
E = inhibición de la emergencia
G = retraso del crecimiento
H = efectos formativos
15 U = pigmentación desusada
6Y = capullos o flores desprendidos.

ENSAYO A

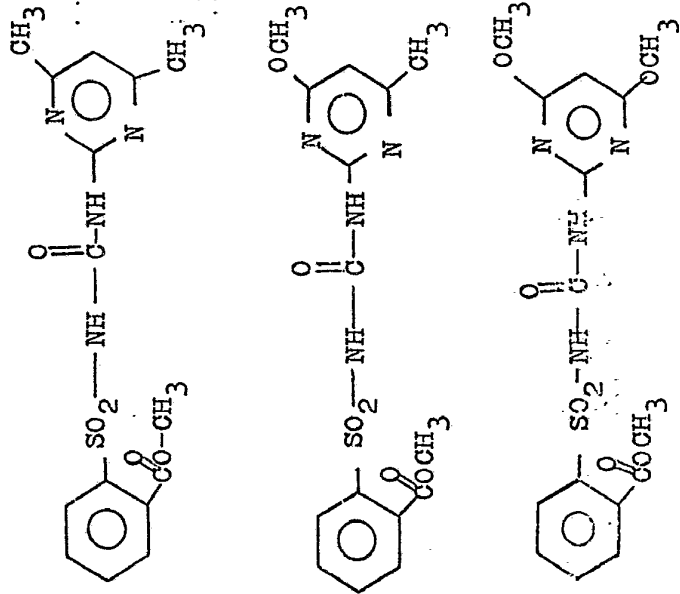
20 En un medio de cultivo se siembran semillas de garran-
chuelo (Digitaria esp.), cereig (Echinochloa crusgalli), avena
loca (Avena fatua), casia (Cassia tora), ipomea (Ipomoea esp.),
cadillo (Xanthium esp.), sorgo, maíz, soja, arroz, trigo y
tubérculos de juncia (Cyperus rotundus) y se someten a un
tratamiento de pre-emergencia con una solución de los com-
puestos de la Tabla XII en un disolvente no fitotóxico. Otros
25 lotes de semillas y tubérculos de todas las malas hierbas

1 y plantas cultivadas anteriores se siembran al mismo
tiempo como controles. Las plantaciones de control se de-
jan sin tratamiento; es decir, no se aplica ningún compues-
to ni ningún disolvente. Al mismo tiempo, se rocían con
5 una solución de los compuestos de la Tabla XII en un di-
solvente no fitotóxico unas plantitas de algodón de 5 ho-
jas (incluidas las cotiledonarias), alubia de riñón arbus-
tiva con la tercera hoja trifoliada en expansión, garran-
chuelo con 2 hojas, cerreig con 2 hojas, avena loca con
10 2 hojas, casia con 3 hojas (incluidas las cotiledonarias),
ipomea con 4 hojas (incluidas las cotiledonarias), cadillo
con 4 hojas (incluidas las cotiledonarias), sorgo con 4 ho-
jas, maíz con 4 hojas, soja con 2 hojas cotiledonarias,
arroz con 3 hojas, trigo con 1 hoja y juncia con 3-5 hojas.
15 Otros grupos de las mismas malas hierbas y las mismas plan-
tas de cultivo se rocían con el mismo disolvente no fitotó-
xico para constituir las plantas de control. Las plantas
que han recibido un tratamiento de pre-emergencia y de post-
emergencia y los controles se mantienen en un invernadero
20 durante 16 días y después todas las plantas tratadas se
comparan con sus controles respectivos y se clasifica visual-
mente su respuesta al tratamiento. Los datos de la Tabla
XII indican que los compuestos de esta invención son muy
eficaces como herbicidas.

25

TABLA XII

1
5
10
15
20
25



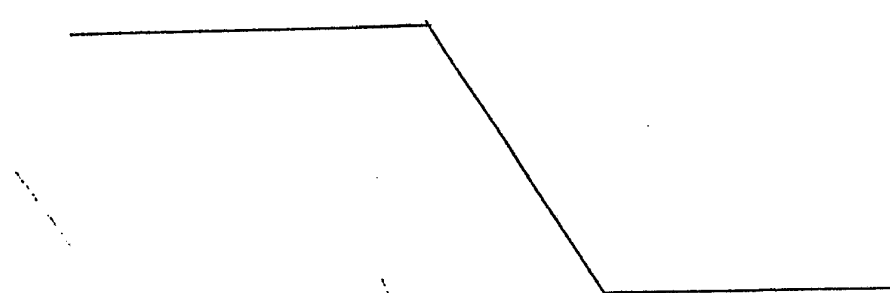
kg/Ha	0,4		2,0	
<u>Post-emergencia</u>				
Alubia arbustiva	9C	9C	9C	9C
Algodón	9C	9C	9C	9C
Ipomea	10C	10C	10C	10C
Cadillo	10C	9C	9C	9C
Casia	9C	9C	9C	9C
Juncia	9C	9C	9C	10C
Garranchuelo	9C	9C	5C,9G	5C,8G
Cerreig	10C	10C	9C	9C
Avena loca	9C	9C	9C	9C
Trigo	9C	9C	9C	9C
Mafz	9C	9C	10C	9C
Soja	9C	6C,9G	9C	9C

TABLA XII (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>2,0</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
1	Arroz	10C	10C	5C,9G	8C
	Sorgo	9C	10C	9C	9C
5	<u>Pre-emergencia</u>				
	Ipomea	9G	9G	9G	9G
	Cadillo	9G	9G	9G	9G
	Casia	8G	9G	9G	9G
	Juncia	10E	10E	10E	10E
10	Garranchuelo	9G	9G	9H	9H
	Cerreig	9H	9H	9H	9H
	Avena loca	3C,9H	3C,9H	9H	9H
	Trigo	9H	9H	9H	9H
	Maíz	10E	10E	10H	9H
15	Soja	9H	9H	9H	10E
	Arroz	10E	10E	10E	10E
	Sorgo	10E	10E	9H	9H

20

25

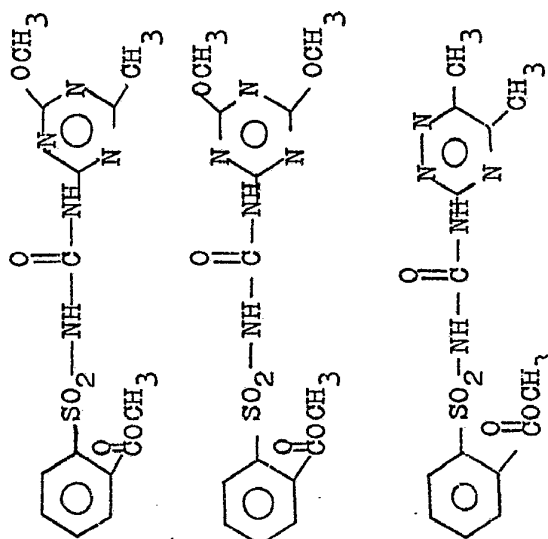


1

TABLA XII (continuación)

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

2

Post-emergencia

15

20

25

Alubia arbustiva	9C	9C	5C,10D
Algodón	9C	5U,5C,9G	5C,9G
Ipomea	10C	10C	5C,9G
Cadillo	9C	9C	9C
Casia	-	9C	9C
Juncia	9C	9C	9C
Garranchuelo	10C	9C	9C
Cerreig	10C	10C	9C
Avena loca	10C	4C,7G	9C
Trigo	10C	3C,7G	10C
Maíz	10C	10C	5U,9C
Soja	9C	9C	9C

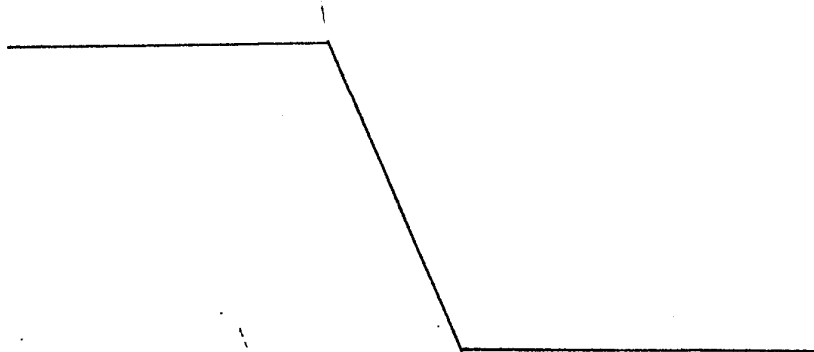
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>2</u>	
Arroz	10C	10C	9C	
Sorgo	10C	9C	9C	
5	<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9H	9G	9C	
Cadillo	9G	9G	9G	
Casia	9G	9G	9C	
Juncia	10E	9G	10E	
10	Garranchuelo	10E	9H	4C, 9G
	Cerreig	9H	9H	9H
	Avena loca	9H	9G	9H
	Trigo	9H	9G	9H
	Maíz	10E	9G	9G
15	Soja	9H	9H	9H
	Arroz	10E	10E	10E
	Sorgo	9H	9G	9H

20

25



1

TABLA XII (continuación)

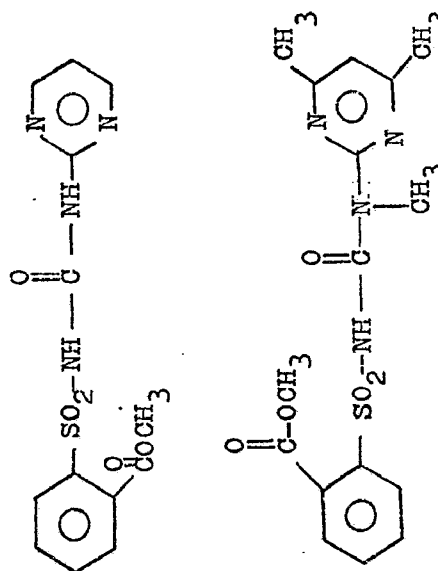
5

10

15

20

25



kg/Ha

2

0,4

Post-emergencia

Alubia arbustiva	6C, 9G	3C, 8G, 6Y
Algodón	3C, 9G	3C, 9G
Ipomea	5C, 8G	3C, 9G
Cadillo	5C, 9G	2C, 7G
Casia	3C, 6G	2C
Juncia	1C, 8G	7G
Garranchuelo	5C, 8G	7G
Cerreig	9C	9C
Avena loca	2G	6C
Trigo	5G	2C, 6G

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>2</u>	<u>0,4</u>
Maíz	1C, 8G	1C, 8G
Soja	2C, 8G	3C
5 Arroz	3C, 8G	3C, 8G
Sorgo	2C, 8G	2C, 8G
<u>Pre-emergencia</u>		
Ipomea	5C, 9G	0
Cadillo	9G	-
10 Casia	9G	0
Juncia	10E	0
Garranchuelo	2C, 8G	3G
Cerreig	2C, 9H	2G
Avena loca	8G	0
15 Trigo	8G	4H
Maíz	9G	3G
Soja	2C, 8H	0
Arroz	10E	8H
Sorgo	9G	4G

20

25

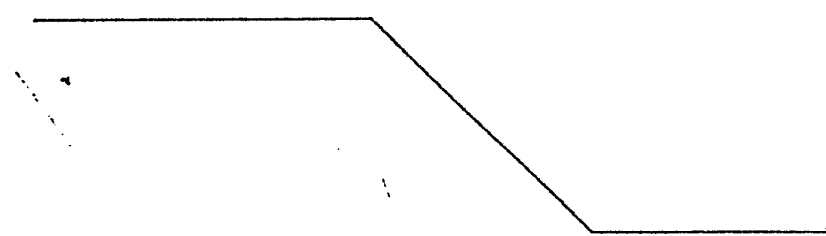
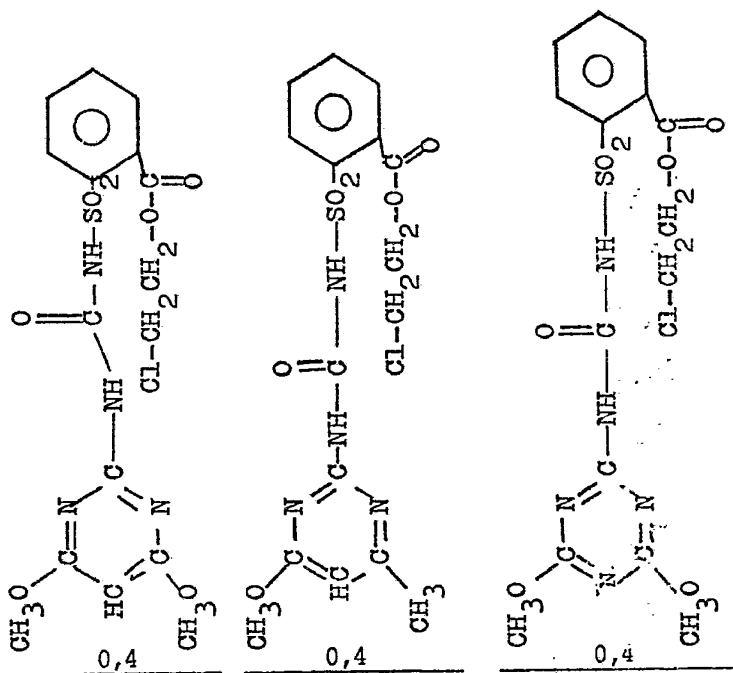


TABLA XII (continuación)

1

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

9C

9C

9C

Algodón

9C

9C

9C

Ipomea

10C

10C

10C

Cadillo

10C

10C

10C

Casia

9C

10C

10C

20

Juncia

9C

10C

10C

Garranchuelo

2C, 6G

3C, 7G

2C

Cerreig

10C

10C

2C, 9H

Avena loca

2C, 6G

2C, 8G

2C, 5G

Trigo

3C, 6G

3C, 7G

1C

25

Maíz

2U, 9G

10C

3C, 9G

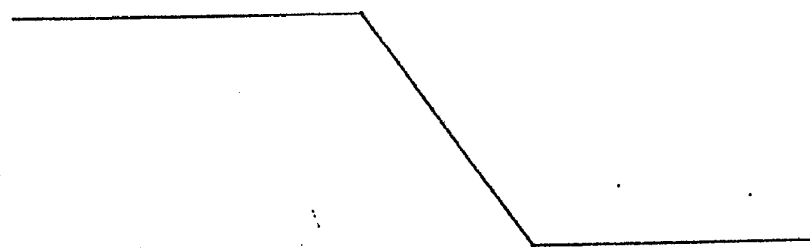
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	10C	5C,9G	3C,9G
Arroz	3C,8G	3C,8G	6G
5 Sorgo	10C	9C	2H,8G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9C	9C
Cadillo	9G	9G	9G
Casia	4C,8G	9C	5C,9G
10 Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	2C,5G	2C,6G	4G
Cerreig	9H	10H	2C,9G
Avena loca	9G	5C,9H	8G
Trigo	9G	9H	5G
15 Maíz	2U,9G	10H	9G
Soja	9H	9H	9H
Arroz	10E	10E	9H
Sorgo	9H	10H	9G

20

25



1

TABLA XII (continuación)

5

10

15

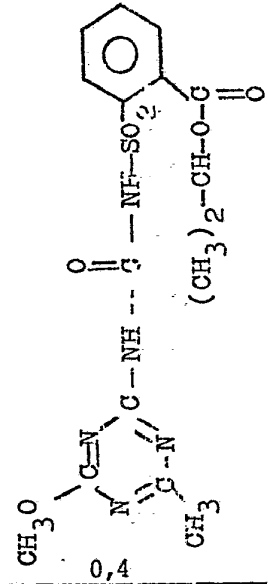
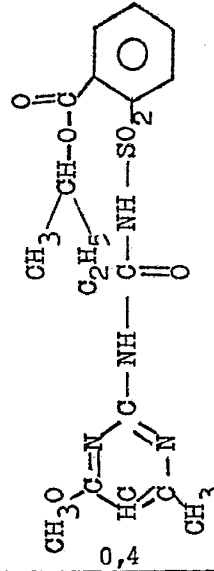
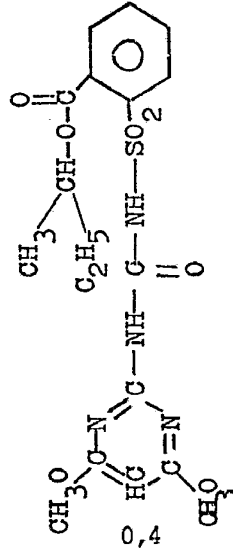
20

25

kg/Ha

Post-emergencia

Alubia arbustiva	9D,9G	9D,9G	9C
Algodón	6C,9G	7C,9G	9C
Ipomea	9C	10C	10C
Cadillo	6C,9G	9C	10C
Casia	5C,8G	5C,8G	10C
Juncia	7G	8G	10C
Garranchuelo	2A	0	5C,8G
Cerreig	9C	5C,9H	6C,9H
Avena loca	2C	8G	2C,6G
Trigo	1C	5C,8G	2C
Maíz	9H	5C,9H	10C



1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	9C	3C,9G	5C,9G
Arroz	4C,8G	5C,9G	5C,8G
5 Sorgo	2C,9G	3C,9G	5C,9G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9G	9G
Cadillo	9G	10E	9G
10 Casia	8G	9G	6C,9G
Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	0	6G	2C,6G
Cerreig	9H	9H	2C,9H
Avena loca	8G	2C,9H	9G
15 Trigo	2G	9G	5G
Maíz	2C,8G	2U,9H	9G
Soja	8H	9H	9H
Arroz	10E	10E	10E
Sorgo	9G	9H	2C,9G

20

25

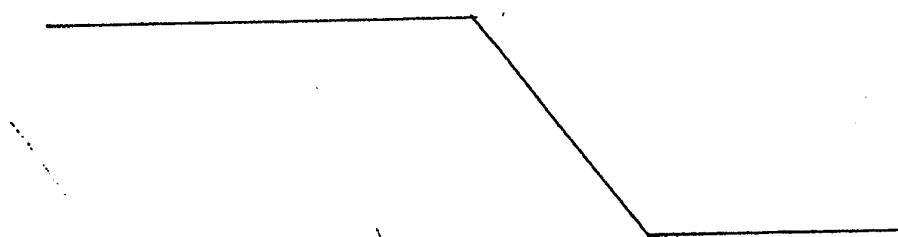
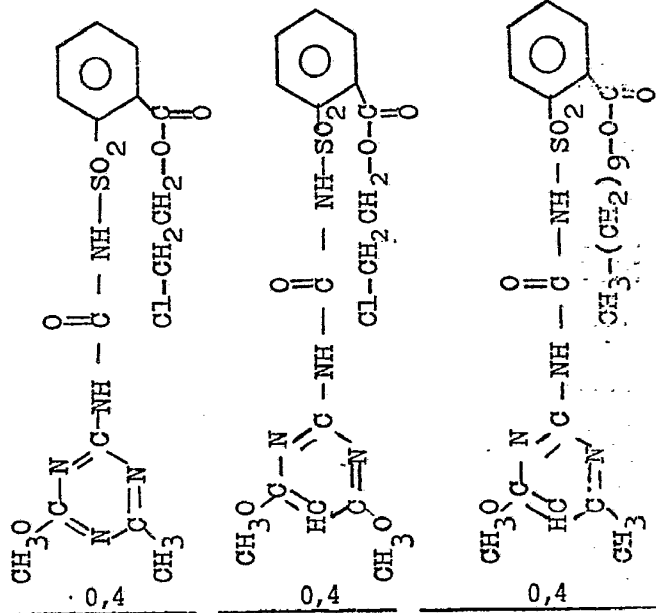


TABLA XII (continuación)

1

5

10



kg/Ha

15

Post-emergencia

20

25

Alubia arbustiva	9C	5C, 8G, 6Y	6C, 6G, 6Y
Algodón	9C	2C, 2H, 7G	2C, 2H, 7G
Ipomea	10C	1C	2C, 8G
Cadillo	10C	3C, 9G	4C, 9G
Casia	9C	5G	5G
Juncia	9C	2G	7G
Garranchuelo	2C, 5G	2G	0
Cerreig	2C, 8H	3C, 9H	3C, 9H
Avena loca	4G	1C	5G
Trigo	1C	1C	3C

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Maíz	9C	3U,9G	2C,9G
5 Soja	6C,9G	1H	2H,5G
Arroz	1C,7G	8G	2C,9G
Sorgo	2U,9G	9G	2U,9G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9C	5G	8G
10 Cadillo	9G	9G	9G
Casia	6C,9G	5G	7G
Juncia	9G	5G	7G
Garranchuelo	1C,3G	0	0
Cerreig	4C,9G	2C,8G	2C,9G
15 Avena loca	8H	6G	2C,8G
Trigo	1C,2G	2G	8G
Maíz	3C,9G	2C,7G	2C,8G
Soja	9H	3G	1C,3G
Arroz	9H	8G	9H
20 Sorgo	2C,9G	8G	2H,8G

25

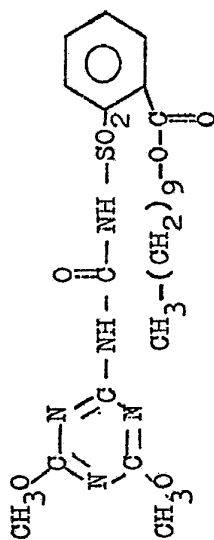


1

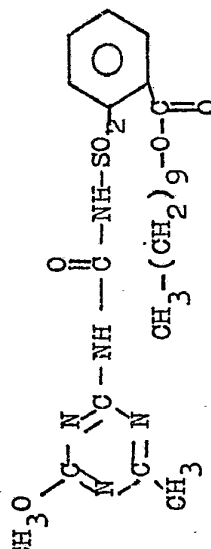
TABLA XII (continuación)

5

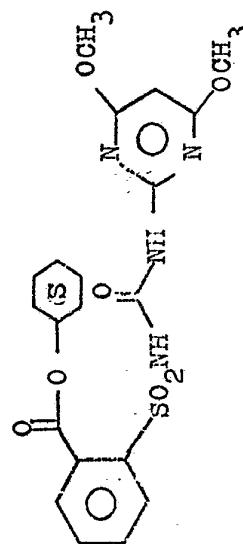
10



0,4



0,4



0,4

kg/Ha

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

6C, 8G, 6Y

8C, 5G, 6Y

5S, 8G, 6Y

Algodón

2C, 2H, 8G

2C, 2H, 8G

3C, 3H, 9G

Ipomea

1C, 8G

3C, 7G

3C

Cadillo

2C, 9G

5C, 9G

9C

Casia

5G

2C, 5G

1C

20

Juncia

3G

2G

1C, 5G

Garranchuelo

3G

0

1C, 5G

Cerreaig

1C

2H

5C, 9H

Avena loca

0

0

2C, 5G

Trigo

0

0

1C

25

Mafz

6H

7H

7H

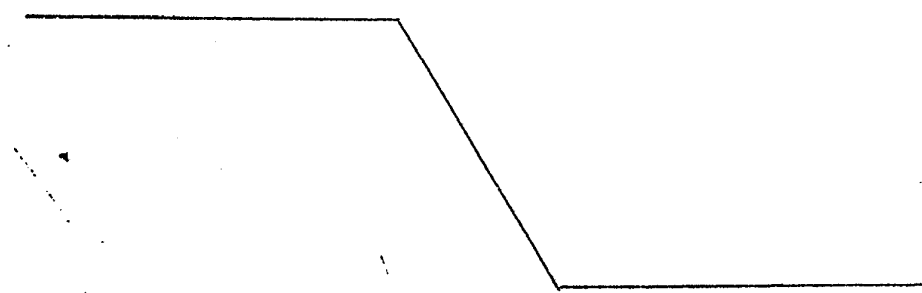
1

TABLA XII (continuación)

kg/Ha	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	7G	6H	2H,9G
Arroz	2G	6G	C
5 Sorgo	7H	2C,9G	8H
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	4G	0	8G
Cadillo	5C,9G	5C,9G	8G
Casia	2C,5G	3C,7G	3G
10 Juncia	0	2G	5G
Garranchuelo	0	2G	0
Cerreig	0	0	9H
Avena loca	0	0	5G
Trigo	0	0	3G
15 Maíz	2G	4G	1C,7G
Soja	1C	0	2C,4H
Arroz	0	0	9H
Sorgo	2H	3G	8G

20

25



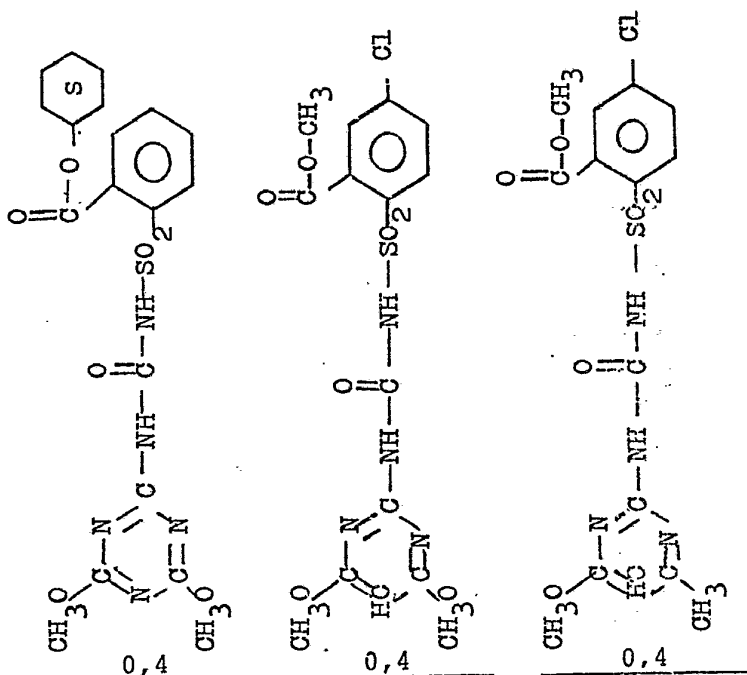
1

TABLA XII (continuación)

5

10

kg/Ha



Post-emergencia

15

20

25

Alubia arbustiva	6C, 8G, 6Y	9C	9C, 9G
Algodón	2H, 3C, 8G	9C	9C, 9G
Iponea	6C, 9G	10C	10C
Cadillo	3C, 9G	10C	10C
Casia	5C	9C	9C
Juncia	2G	10C	6C, 9G
Garranchuelo	0	2C, 6G	3G
Cerreig	3C, 8H	3C, 9H	6C, 9H
Avena loca	0	9G	3C, 9G
Trigo	0	1C, 2G	3C, 5G
Maíz	6H	6H	9H

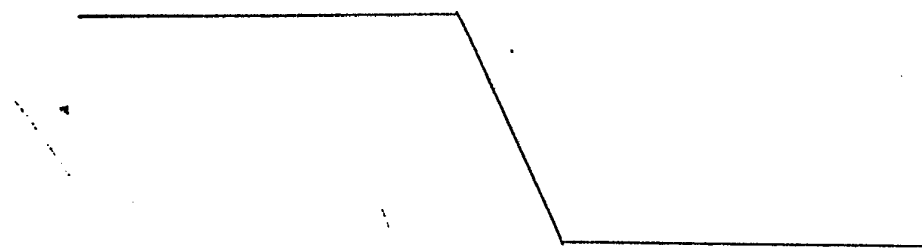
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	2H,8G	5C,9G	4C,9G
Arroz	2G	5C,9G	9C
5 Sorgo	3G	3C,9G	4C,9G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9G	9G
Cadillo	9C	9G	9H
Casia	2C	2C,9G	3C,9G
10 Juncia	0	10E	10E
Garranchuelo	0	5G	2C,5G
Cerreig	9H	9H	9H
Avena loca	2G	9G	9G
Trigo	2G	3G	8H
15 Maíz	1C,7G	9H	2U,9G
Soja	2C	9H	9H
Arroz	5G	10E	10E
Sorgo	8G	9H	9H

20

25



1

TABLA XII (continuación)

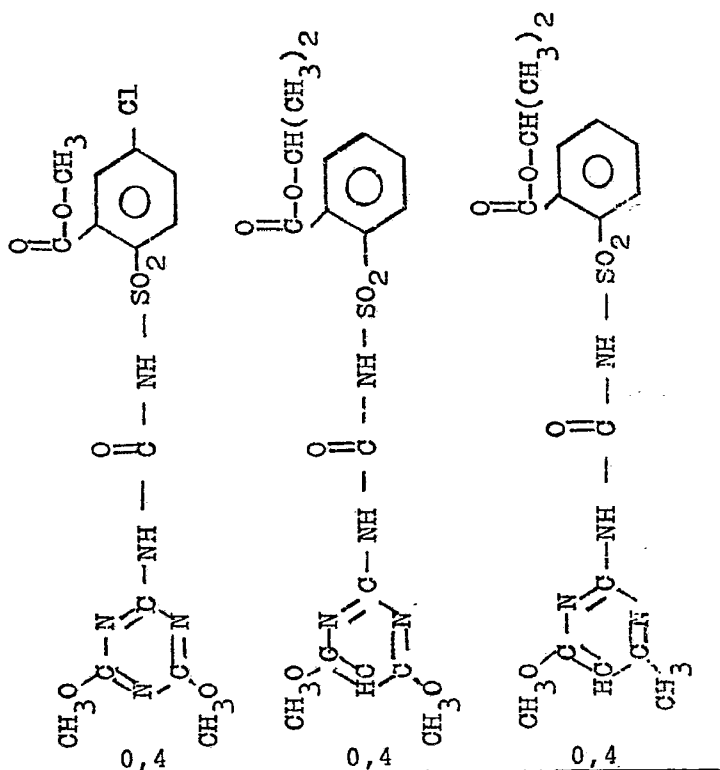
5

10

15

20

25



kg/Ha

Post-emergencia

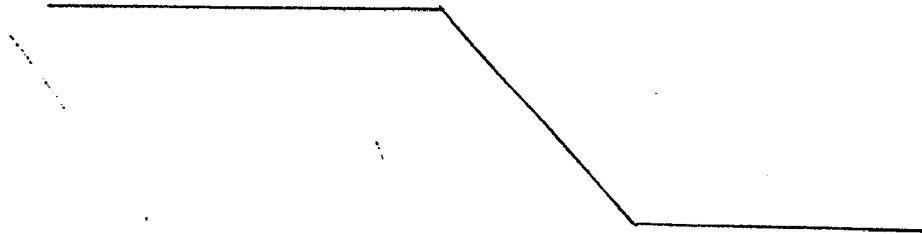
Alubia arbustiva	9C,9G	5H,8C	5C,9H
Algodón	7C,9G	9C	10C
Ipomea	10C	10C	9C
Cadillo	10C	10C	10C
Casia	6C,9G	9C	9C
Juncia	10C	9C	9C
Garranchuelo	1C	6C	3U,5G
Cerreig	3G	9C	10C
Avena loca	0	6C	3C,7G

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Trigo	0	3G,4G	3C,8G
Maíz	9H	5U,8G	9C
5 Soja	5C,9G	6H,8G	5H,9G
Arroz	2C,9G	7C	8C
Sorgo	8H	9C	10C
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9G	9H
10 Cadillo	9G	5H,9G	8H,9G
Casia	5C,9G	5H,8G	8H,9G
Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	1C	8G	8G
Cerreig	2C,8H	5H,9G	5H,9G
15 Avena loca	8G	7G	8G
Trigo	1C	7G	9G
Maíz	2C,9H	5H,9G	5H,9G
Soja	9H	6H,8G	8H,9G
Arroz	10E	10E	10E
20 Sorgo	9H	5H,9G	8H,9G

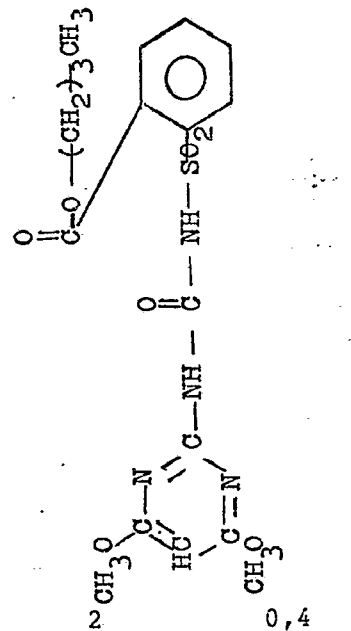
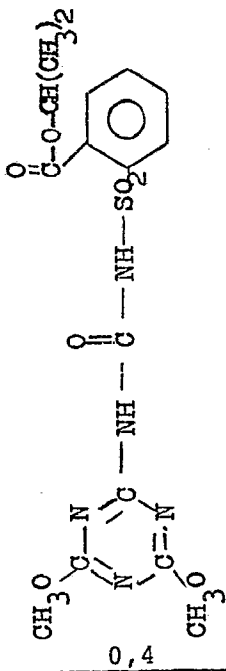
25



1

TABLA XII (continuación)

5



10

kg/Ha

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva	8H,9G	3C,9G,9D	3C,9G,9D
Algodón	9C	9C	4C,9G
Ipomea	10C	10C	9C
Cadillo	10C	9C	9C
Casia	9C	9C	3C,7G
20 Juncia	9C	9C	2C,6G
Garranchuelo	6G	4C,7G	2C,6G
Cerfeig	8C	10C	9C
Avena loca	2C	9C	2C,5G
Trigo	2C	9C	1C,4G
25 Maíz	5H,7G	9C	2U,8H

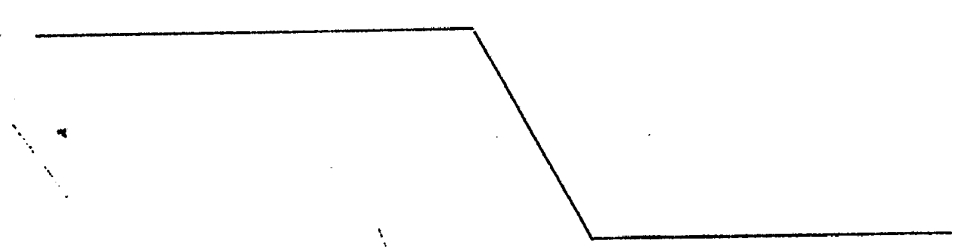
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>2</u>	<u>0,4</u>
Soja	5H,8G	6C,9G	6C,9G
Arroz	8C	9C	6C,8G
5 Sorgo	2H,7G	9C	3C,8G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	8H,9G	5C,9G	9G
Cadillo	8H,9G	9G	9G
Casia	8H,8G	9C	9G
10 Juncia	9E,9G	10E	10E
Garranchuelo	7G	7G	8G
Cerreig	5H,9G	9H	9H
Avena loca	8G	8G	7G
Trigo	7G	9G	9G
15 Maíz	7H,9G	9G	2C,9G
Soja	7H,8G	9H	7H
Arroz	7E,8G	10E	10E
Sorgo	7H,9G	9H	9H

20

25

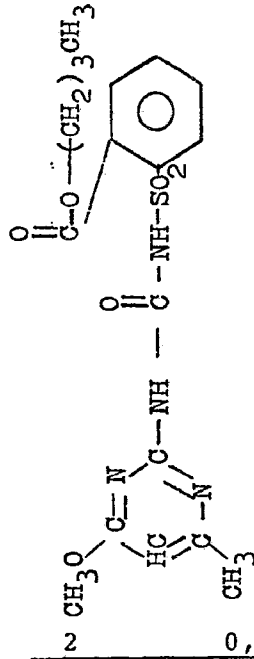


1

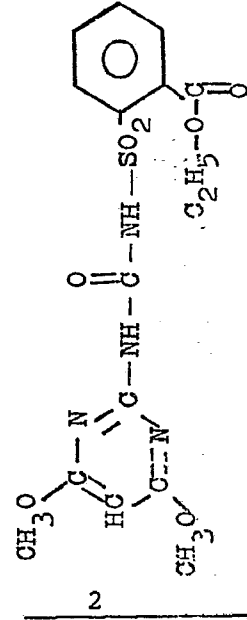
TABLA XII (continuación)

5

10



0,4



kg/Ha

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

3C,9G,10D

3C,9G,9D

9G,10D

Algodón

5C,9G

5C,9G

9C

Ipomea

10C

9C

10C

Cadillo

10C

9C

9C

Casia

9C

3C,7G

9C

20

Juncia

9C

2C,7G

9C

Garranchuelo

5C,8G

3G

9C

Cerreig

10C

10C

10C

Avena loca

4C,8G

8G

9C

Trigo

8C

4C,8G

9C

25

Maíz

9C

5C,9G

9C

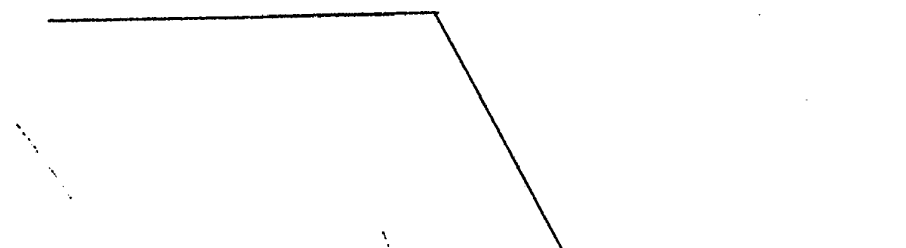
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>2</u>	<u>0,4</u>	<u>2</u>
Soja	9C	4C,8G	6C,9G
Arroz	8C	5C,8G	9C
5 Sorgo	9C	2C,8G	10C
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	5C,9H	9G	10E
Cadillo	9G	9G	9G
Casia	3C,9G	9G	9G
10 Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	3C,9G	7G	9H
Cerreig	9H	9H	9H
Avena loca	3C,9G	2C,8G	2C,9G
15 Trigo	9H	9H	9H
Maíz	9G	9G	10E
Soja	9H	9H	9H
Arroz	10E	10E	10E
Sorgo	9H	9H	10H

20

25

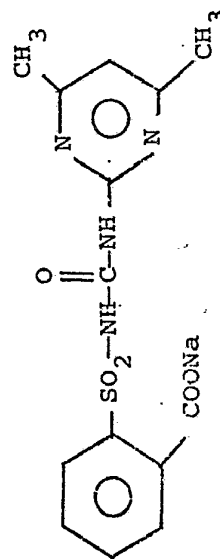
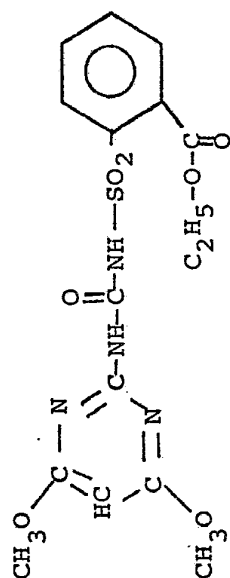


1

TABLA XII (continuación)

5

10



kg/Ha

0,4

2

2

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

3C, 9G, 9D

5H, 8G, 6F

1C

Algodón

9C

4C, 7G

Ipomea

10C

4G

0

Cadillo

9C

8C

0

Casia

9C

3C, 8G

0

20

Juncia

9C

8C

0

Garranchuelo

4C, 7G

5G

0

Cerreig

10C

8C

1H

Avena loca

9C

4C

0

Trigo

9C

4C

0

25

Maíz

9C

3H, 8G

0

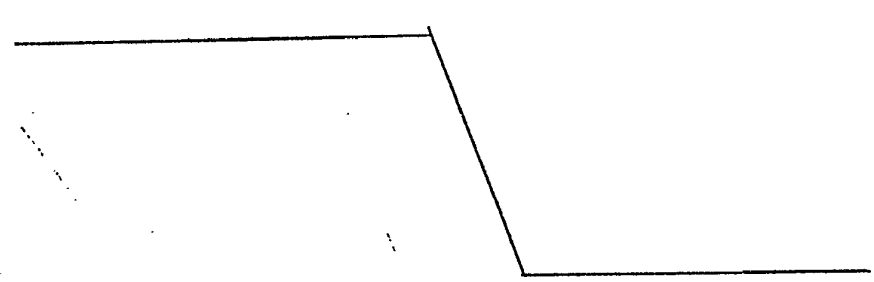
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>2</u>	<u>2</u>
Soja	6C,9G	6H,9G	1C
Arroz	9C	9C	3G
Sorgo	9C	3H,8G	1C,5G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	10E	7G	1C
Cadillo	9G	5H,8G	1C
Casia	9G	5H,8G	1C
Juncia	10E	10E	0
Garranchuelo	3C,9G	2G	0
Cerreig	9H	5H,8G	0
Avena loca	9G	5H,7G	0
Trigo	9H	5H,8G	0
Maíz	10E	5H,9G	3G
Soja	9H	5H,8G	1C
Arroz	10E	8H,9G	0
Sorgo	9H	5H,8G	0

20

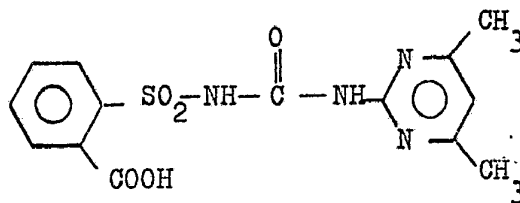
25



1

TABLA XII (continuación)

5



kg/Ha	10	2	2	0,4	
<u>Post-emergencia</u>					
10	Alubia arbustiva	2C,2H	1C	0	0
	Algodón			0	0
	Ipomea	0	0	0	0
	Cadillo	0	0	0	0
	Casia	0	1C	0	0
15	Juncia	0	0	0	0
	Garranchuelo	0	0	0	2G
	Cerreig	2G	0	0	1C, 2H
	Avena loca	0	0	0	0
	Trigo	0	0	0	0
20	Maíz	0	0	0	0
	Soja	1C	0	0	0
	Arroz	5G	0	0	0
	Sorgo	3G	0	0	0
<u>Pre-emergencia</u>					
25	Ipomea	7G	1C	0	0

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>10</u>	<u>2</u>	<u>2</u>	<u>0,4</u>
Cadillo	9G	0	0	0
Casia	1C,5G	1C	0	0
Juncia	9G	9G	0	0
Garranchuelo	1C	0	0	0
Cerreig	1C,3G	0	0	0
Avena loca	1C,5G	0	0	0
Trigo	2C,7G	3G	0	0
Maíz	8G	3G	0	0
Soja	4G	0	0	0
Arroz	2C,7G	0	0	0
Sorgo	5G	0	0	0

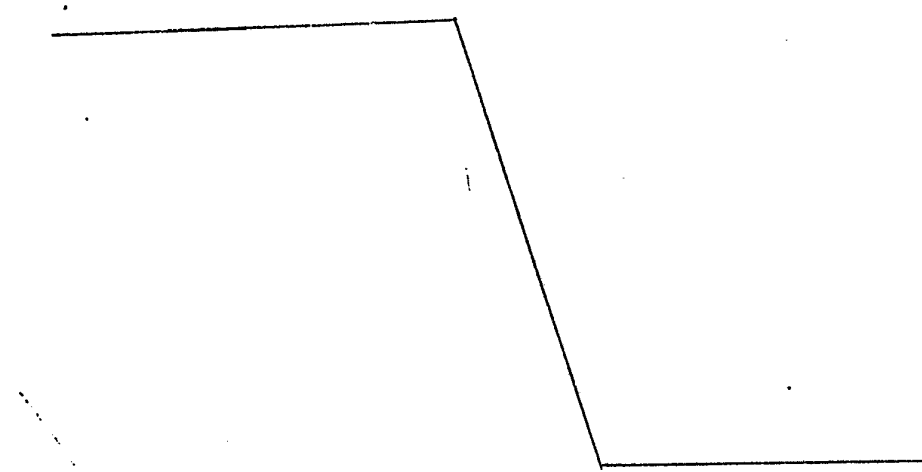
5

10

15

20

25

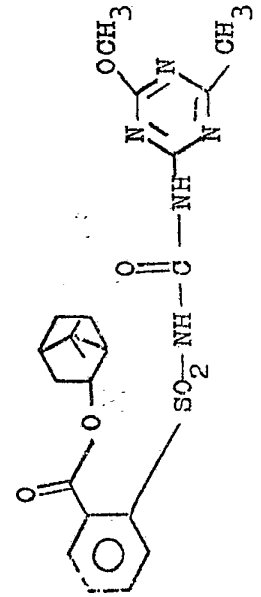
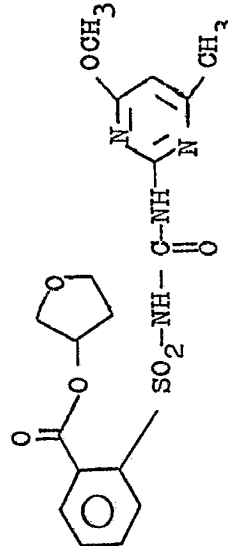
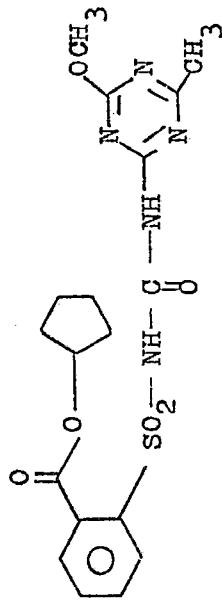


1

TABLA XII (continuación)

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

8C

9C

9C

Algodón

6C,9G

5C,9G

5C,9G

Ipomea

10C

9C

5C,9G

Cadillo

9C

5C,9G

6G

Casia

5C,7G

5C,9G

9C

20

Juncia

7G

3C,8G

4G

Garranchuelo

1C

2C,8G

3G

Cerreig

1C,7G

9C

2G

Avena loca

1C

7C

0

Trigo

1C

7C

2G

25

Maíz

3U,8G

5U,9C

8G

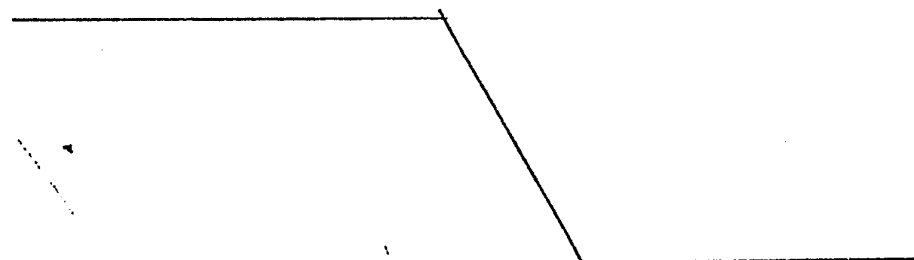
1

TABLA XIII (continuación)

kg/Ha	0,4	0,4	0,4
Soja	9C	9C	9C
Arroz	3C, 7G	5C, 8G	2C, 5G
5 Sorgo	8G	9C	1C, 9G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9G	8G
Cadillo	9G	9G	9G
Casia	8G	9G	9G
10 Juncia	9G	10E	2G
Garranchuelo	6G	4C, 9G	5G
Cerreig	9H	9H	5G
Avena loca	4G	2C, 8G	2G
Trigo	4G	9H	0
15 Maíz	2C, 7G	10E	2C, 7G
Soja	9H	9H	2C, 4H
Arroz	9G	10E	2C, 5G
Sorgo	1C, 9G	10E	8G

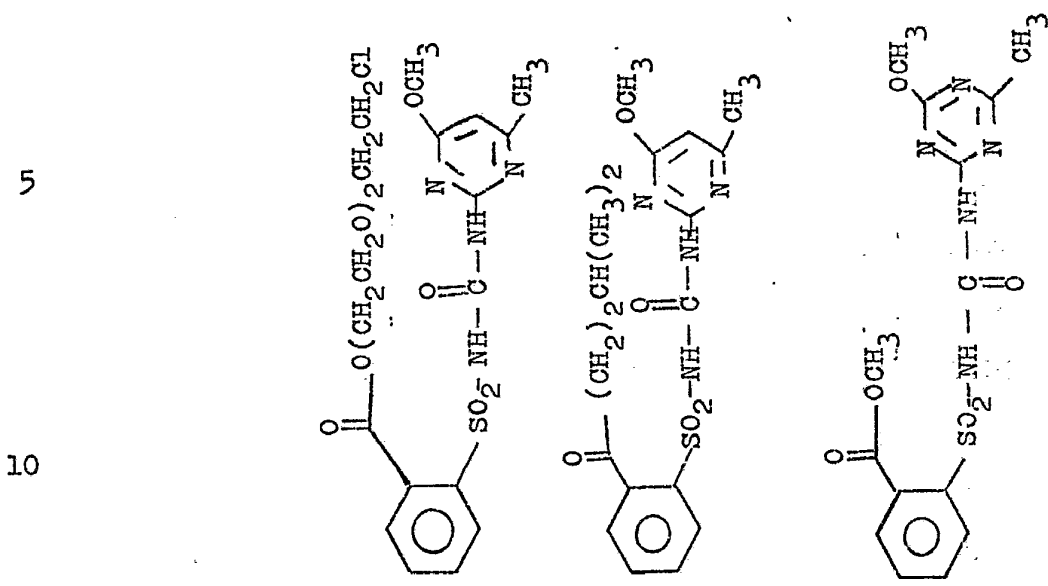
20

25



1

TABLA XII (continuación)



kg/Ha 0,4 0,4 0,4

Post-emergencia

15	Alubia arbustiva	9C	10D	9C
	Algodón	9C	3C, 9G	5C, 9G
	Ipomea	10C	10C	9C
	Cadillo	9C	5C, 9G	3H, 9G
	Casia	9C	3C, 8G	9C
20	Juncia	2C, 6G	2C, 9G	6C, 9G
	Garranchuelo	3C, 8G	5C, 8G	9C
	Cerreig	10C	9C	5C, 8H
	Avena loca	9C	5C, 7G	0
	Trigo	9C	3C, 8G	0
25	Maíz	5U, 8G	9H	9C

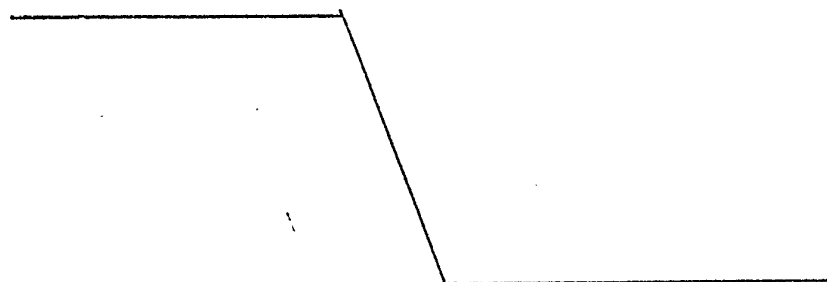
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	8C	2C,9G	5C,9G
Arroz	8C	5C,9G	9C
Sorgo	5C,9G	3U,9G	2C,9G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9G	9G
Cadillo	9G	9G	10E
Casia	9C	9G	9G
Juncia	10E	9G	10E
Garranchuelo	2C,9G	2C,9G	5G
Cerreig	9H	5C,9H	2C,8G
Avena loca	1C,8G	2C,8H	2G
Trigo	1C,9H	9G	0
Mafz	2C,9H	9G	-
Soja	9H	8H	9H
Arroz	10E	10E	9H
Sorgo	2C,9H	9H	9G

20

25



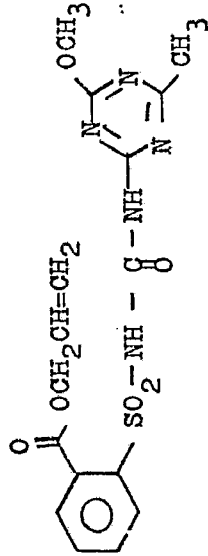
1

TABLA XII (continuación)

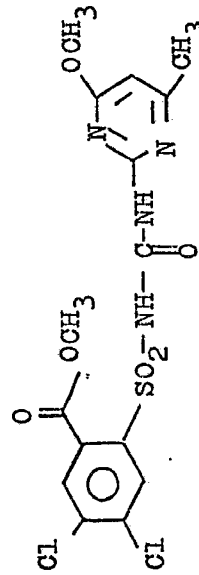
5

10

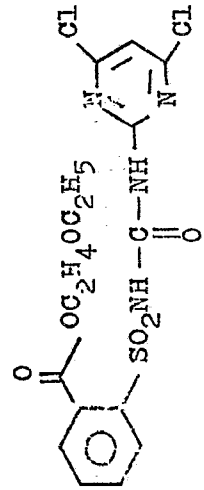
kg/Ha



0,4



0,4



0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

9C

4C, 9G, 6Y

3C, 5G, 6Y

Algodón

5C, 9G

2C, 3H

1C

Ipomea

10C

5C, 8G

0

Cadillo

10C

3C, 8G

5C

20

Casia

9C

2C

0

Juncia

6C, 9G

6G

0

Garranchuelo

2C, 6G

2G

2C

Cerreig

9C

7H

2C, 6G

Avena loca

9C

0

1C

25

Trigo

9C

0

2G

Maíz

9C

2G

1C, 7G

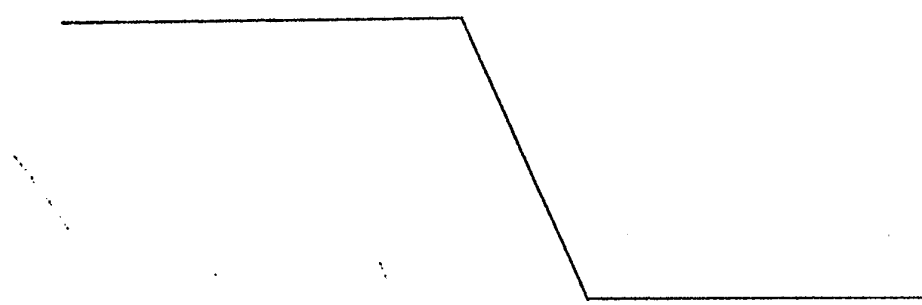
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	9C	5C,7G	1C,5G
Arroz	9C	2C	2C,4G
5 Sorgo	9C	5G	2C,7G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	8G	3G
Cadillo	9G	8G	
Casia	9G	0	0
10 Juncia	10E	10E	10F
Garranchuelo	9H	2G	2C
Cerreig	9H	9G	1C,8H
Avena loca	3C,9G	4G	0
Trigo	9H	5G	0
15 Maíz	10E	2C,7G	1C
Soja	9H	1C,5H	0
Arroz	10E	9H	8H
Sorgo	10H	2C,9G	8G

20

25

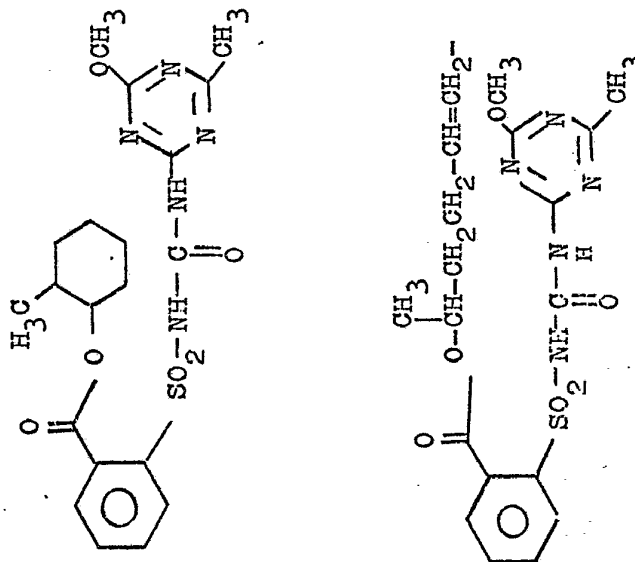


1

TABLA XII (continuación)

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

9C

9C

Algodón

9C

9C

Ipomea

10C

10C

Cadillo

9C

10C

Casia

9C

9C

20

Juncia

2C, 8G

7G

Garranchuelo

2C, 8G

9C

Cerreig

5C, 9H

6C, 9H

Avena loca

1C, 8G

2C, 7G

Trigo

1C, 7G

2C, 6G

25

Mafz

10C

9C

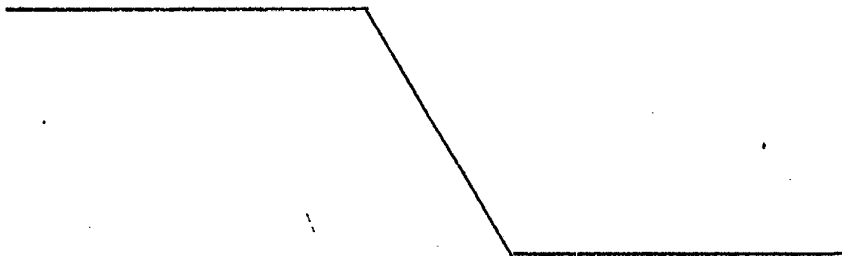
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	2C,8G	9C
Arroz	3C,8G	5C,8G
5 Sorgo	2C,8G	2C,8G
<u>Pre-emergencia</u>		
Ipomea	9G	9G
Cadillo	9G	9G
Casia	9G	9G
10 Juncia	8G	9G
Garranchuelo	2C,9G	1C,8G
Cerreig	9H	2C,9H
Avena loca	1C,7G	1C,8G
Trigo	1C,5G	7G
15 Maíz	1C,9G	2C,9G
Soja	9H	9H
Arroz	10E	10E
Sorgo	2C,9G	9H

20

25

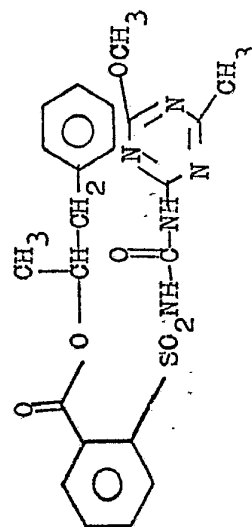
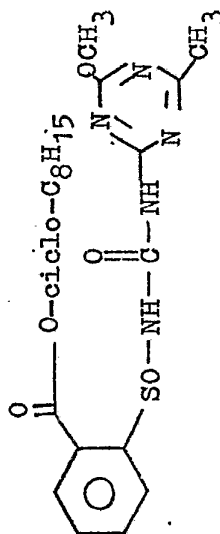


1

TABLA XII (continuación)

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

Post-emergencia

15

20

25

Alubia arbustiva	9C	9C
Algodón	9C	5C, 9G
Ipomea	10C	10C
Cadillo	9C	9C
Casia	9C	10C
Juncia	4G	7G
Garranchuelo	1C, 5G	9C
Cerreig	6C, 9H	9C
Avena loca	4G	3C, 7G
Trigo	2G	3C, 6G
Maíz	9C	9C
Soja	5C, 9G	-

1

TABLA XII (continuación)

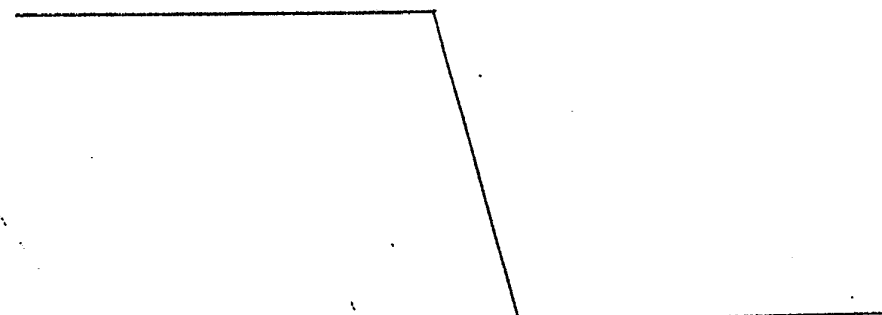
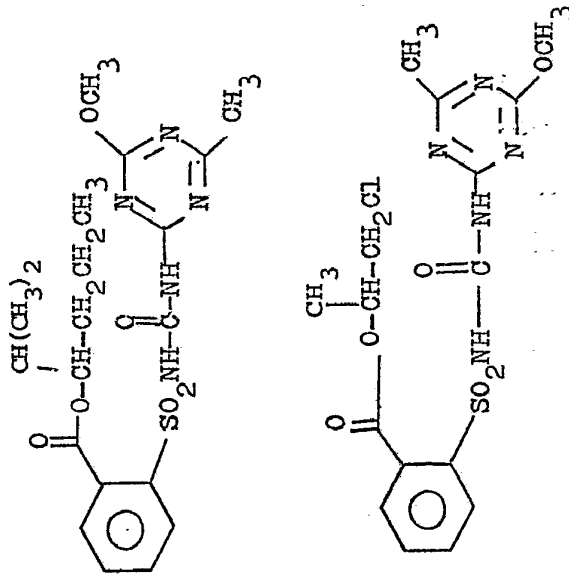
<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Arroz	5C,9G	-
5 Sorgo	1C,8G	5C,9G
<u>Pre-emergencia</u>		
Ipomea	3C,9G	9G
Cadillo	9G	9G
Casia	8G	10E
10 Juncia	7G	10E
Garranchuelo	5G	2C,9G
Cerreig	9H	9H
Avena loca	7G	9H
Trigo	5G	9H
15 Maíz	1U,9G	9H
Soja	9H	9H
Arroz	9H	10E
Sorgo	1C,9G	9H
20		
25		

TABLA XII (continuación)

1

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

9C

9C

Algodón

6C, 9G

4C, 9G

Ipomea

10C

10C

Cadillo

10C

9C

Casia

9C

5C, 9G

20

Juncia

1C, 8G

2C, 8G

Garranchuelo

3C

2C, 6G

Cerreig

9C

3C, 9H

Avena loca

1C, 2G

3G

Trigo

1C, 4G

2G

25

Maíz

9C

3U, 8G

1

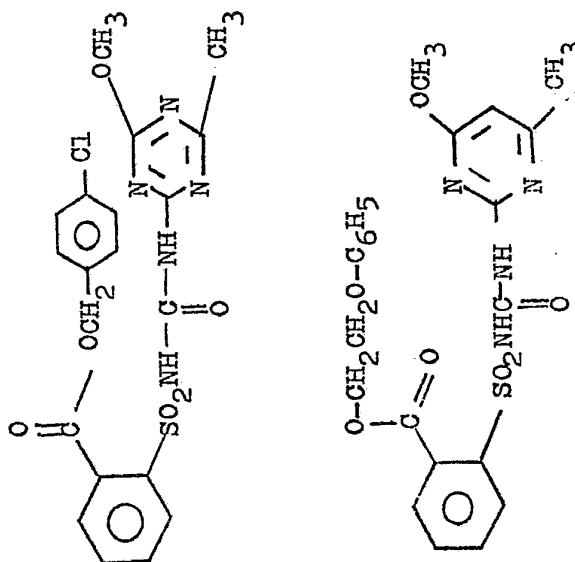
TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	9C	5C,9G
Arroz	-	3C,7G
5	Sorgo	5C,9G
	<u>Pre-emergencia</u>	
	Ipomea	9G
	Cadillo	8G
10	Casia	8G
	Juncia	5G
	Garranchuelo	0
	Cerreig	9H
	Avena loca	5G
15	Trigo	3G
	Maíz	8G
	Soja	9H
	Arroz	9H
	Sorgo	2C,9G
20		
25		

The graph shows a step-like decrease in a value. The vertical axis is labeled with 20 and 25. The horizontal axis is not explicitly labeled but represents the progression of the table rows. The line starts at a high level, remains constant until the 'Sorgo' row, then drops sharply to a lower level, and remains constant thereafter.

TABLA XII (continuación)

1
5
10
15
20
25



kg/Ha

0,4

0,4

Post-emergencia

Alubia arbustiva	5C, 8G, 6Y	9C
Algodón	5C, 9G	9C
Ipomea	9C	9C
Cadillo	5C, 9G	10C
Casia	5C, 9G	5C, 9G
Juncia	0	8G
Garranchuelo	5C, 8G	4G
Cerreig	3C, 7H	9C
Avena loca	2C	1C, 2G
Trigo	0	1C, 2G
Maíz	8U, 9G,	5U, 9H

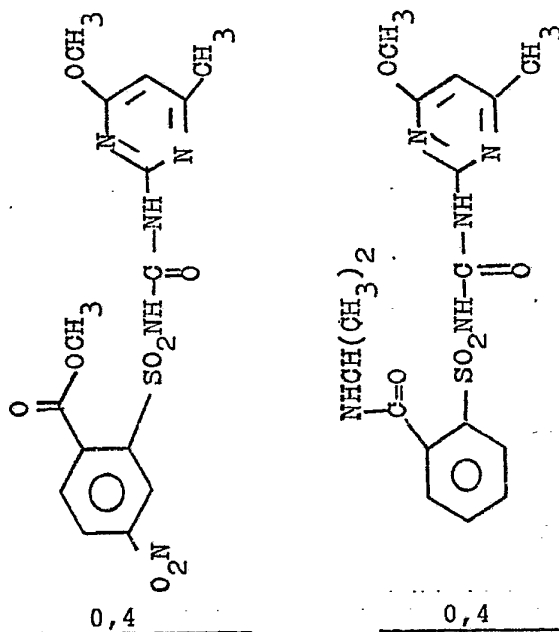
1

TABLA XII (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
	Soja	5C,8G	9C
	Arroz	3C,8G	3C,8G
5	Sorgo	2C,9G	8G
	<u>Pre-emergencia</u>		
	Ipomea	9G	9C
	Cadillo	8G	9G
	Casia	8G	3C,8G
10	Juncia	9G	10E
	Garranchuelo	2C,8H	2C,8G
	Cerreig	2C,9H	5C,9H
	Avena loca	4G	1C,8G
	Trigo	0	9H
15	Maíz	2C,8G	9G
	Soja	7H	9H
	Arroz	9H	10E
	Sorgo	1C,9G	5C,9H
20			
25			

TABLA XII (continuación)

1
5
10
15
20
25



kg/Ha

Post-emergencia

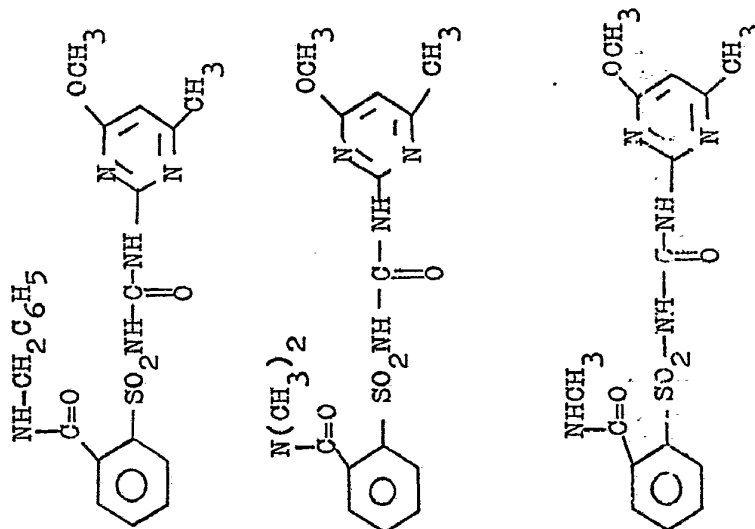
Alubia arbustiva	9C	6C, 9G
Algodón	2C, 2H, 5G	4C, 9G
Ipomea	9C	10C
Cadillo	9C	9C
Casia	9C	9C
Juncia	9G	9C
Garranchuelo	5C, 8H	10C
Cerreig	6C, 9H	9C
Avena loca	4C, 8G	9C
Trigo	2C, 8G	6C, 8G
Maíz	2C, 9H	5U, 9C

1 TABLA XII (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
	Soja	2C,8G	9C
	Arroz	3C,8G	5C,9G
5	Sorgo	2U,9G	9C
	<u>Pre-emergencia</u>		
	Ipomea	9G	9G
	Cadillo	9G	8G
	Casia	9G	9G
10	Juncia	1C,9G	10E
	Garranchuelo	2C,9G	9H
	Cerreig	6C,9H	9H
	Avena loca	2C,8G	2C,8G
	Trigo	9G	9H
15	Maíz	2C,8G	9H
	Soja	9H	9H
	Arroz	9H	10E
	Sorgo	4C,9H	9H
20			
25			

TABLA XII (continuación)

1
5
10
15
20
25



kg/Ha	0,4	0,4	0,4
<u>Post-emergencia</u>			
Alubia arbustiva	9C	10D,9G	9C
Algodón	9C	6C,9G	10C
Ipomea	10C	10C	10C
Cadillo	9C	5C,9G	9C
Casia	6C,9G	9C	9C
Juncia	6C,9G	7C,9G	10C
Garranchuelo	4C,8G	5C,8G	9C
Cerreig	9C	10C	9C
Avena loca	9C	9C	9C
Trigo	9C	9C	9C
Mafz	10C	9C	10C

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	9C	9C	9C
Arroz	6C, 8G	9C	5C, 9G
Sorgo	9C	9C	10C
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	9G	10E
Cadillo	8G	9G	9G
Casia	9G	9G	9G
Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	3C, 9G	2C, 9G	1C, 9G
Cerreig	9H	9H	1C, 9H
Avena loca	3C	2C, 9G	2C, 9H
Trigo	9H	9H	9H
Maíz	1C, 9G	9H	10E
Soja	9H	9H	9H
Arroz	10E	10E	10E
Sorgo	5C, 9H	9H	10E

5

10

15

20

25

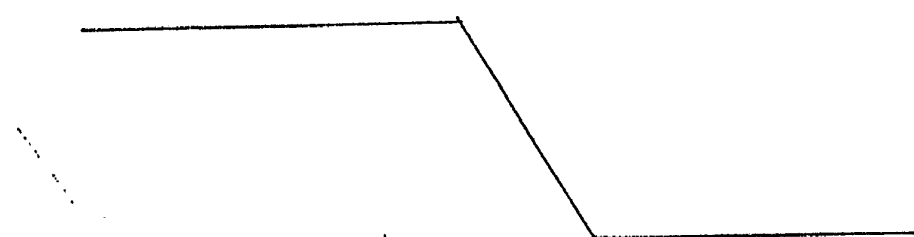
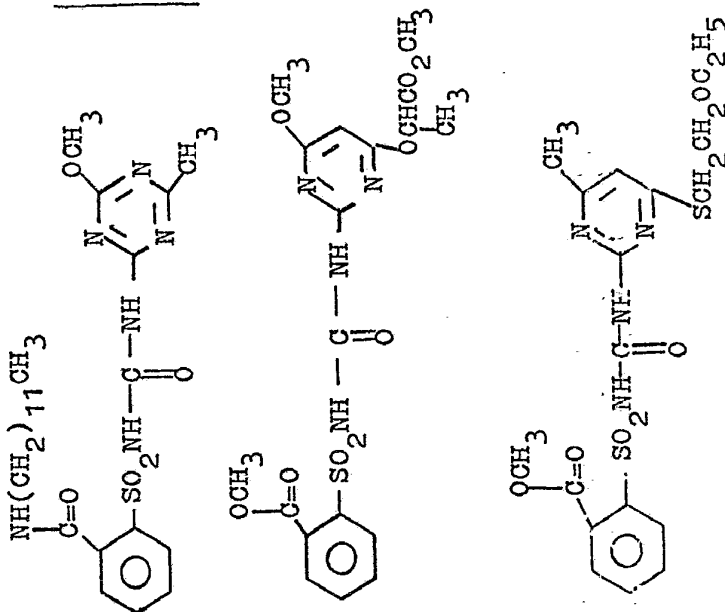


TABLA XII (continuación)

1

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

8C, 9G

9C

9C

Algodón

6C, 9G

6C, 9G

2C, 3H, 8G

Ipomea

9C

9C

2C, 8G

Cadillo

2H, 8G

5C, 9G

2C

Casia

5C, 9G

9C

1C, 6H

20

Juncia

9G

9C

8G

Garranchuelo

2C, 6G

9C

1C, 5G

Cerreig

4C, 9H

9C

5C, 9H

Avena loca

2C, 6G

9C

1C, 7G

Trigo

3C, 5G

9C

6G

25

Maíz

5U, 9G

9C

9H

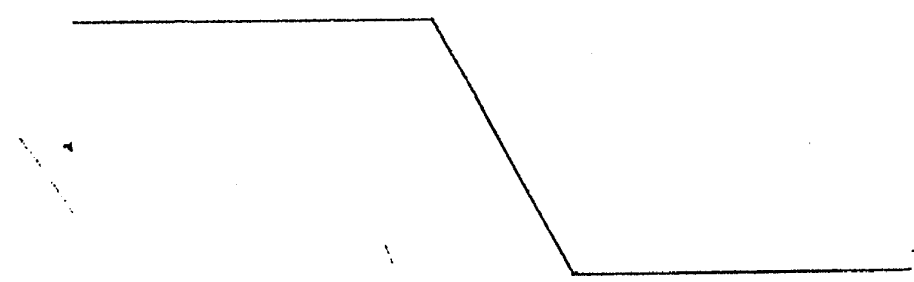
1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	9C	9C	1C,5H
Arroz	5C,9G	9C	8G
5 Sorgo	3C,9H	9C	9G
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9G	10E	9G
Cadillo	8G	10E	10E
Casia	8G	3C,9G	2C,8G
10 Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	2C,5H	5C,9G	2C,8G
Cerreig	9H	5C,9H	3C,9H
Avena loca	6G	5C,9H	1C,5G
15 Trigo	6G	10E	2C,9H
Maíz	8G	10H	9G
Soja	2C,5H	9H	9H
Arroz	9H	10E	10E
Sorgo	1C,9G	10H	9H

20

25

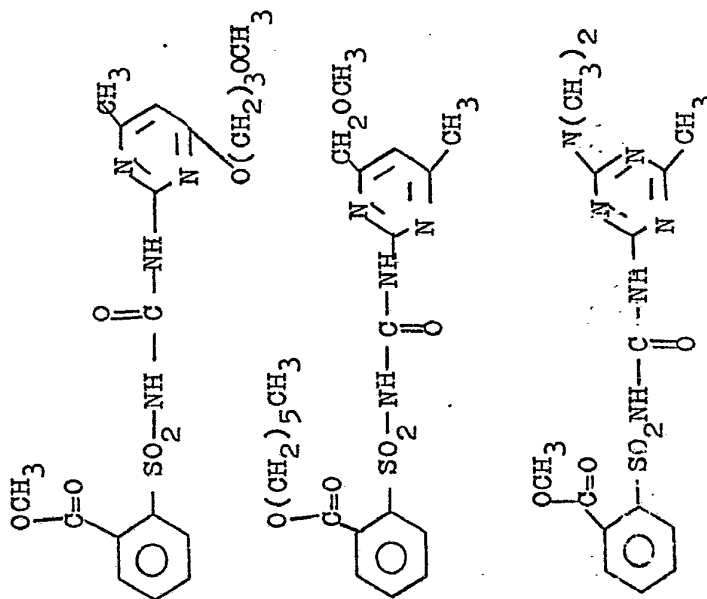


1

TABLA XII (continuación)

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Albía arbustiva

9C

4C, 7G, 6G

9C

Algodón

2C, 3H, 9G

2C

9C

Ipomea

5C, 9G

2C

10C

Cadillo

3C, 8G

2C, 5G

9C

Casia

9C

1C

9C

20

Juncia

9C

1C, 5G

8G

Garranchuelo

9C

0

3C, 9G

Cerreig

9C

3C

10C

Avena loca

6C, 9G

0

9C

Trigo

5C, 8G

0

9C

25

Maíz

9C

1C, 7H

9C

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	8C	2C	9C
Arroz	8C	2C,7G	10C
5 Sorgo	9C	1C,5G	10C
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	10E	0	9G
Cadillo	9G	0	9G
Casia	8G	0	8G
10 Juncia	10E	10E	10E
Garranchuelo	5C,9G	0	2C,9G
Cerreig	7C,9H	2G	2C,9H
Avena loca	4C,6G	0	2C,7G
Trigo	9H	0	9H
15 Maíz	9H	1C,4G	9G
Soja	9H	0	9H
Arroz	10E	8H	10E
Sorgo	9H	3G	9H

20

25

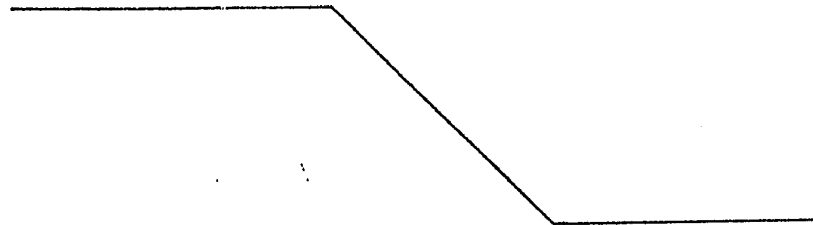
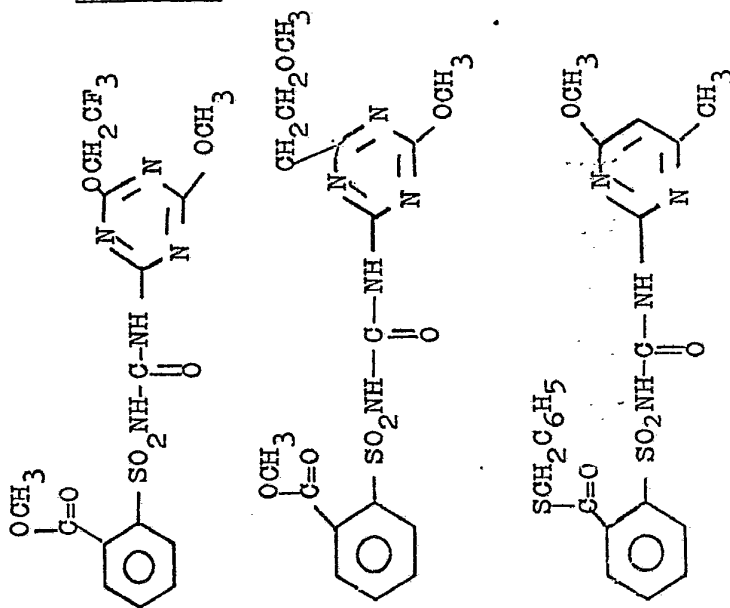


TABLA XII (continuación)

1

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

9C

9C

9C

Algodón

9C

9C

9C

Ipomea

10C

10C

10C

Cadillo

10C

2C, 8G

9C

Casia

10C

3C, 8G

9C

20

Juncia

5C, 9G

1C, 8G

2C, 9G

Garranchuelo

3G

9C

1C, 8G

Cerreig

6C, 9H

5C, 8H

9C

Avena loca

3C, 7G

1C, 5G

4C, 7G

Trigo

2C, 6G

1C

4C, 6G

25

Maíz

10C

9C

9C

1 TABLA XII (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
	Soja	6C,9G	9C	8C
5	Arroz	-	5C,9G	5C,9G
	Sorgo	2C,9G	3C,9G	3C,9G
	<u>Pre-emergencia</u>			
	Ipomea	9G	9G	9G
	Cadillo	9G	9G	8G
10	Casia	9G	2C,8G	9G
	Juncia	10E	1C,9G	10E
	Garranchuelo	2G	1C,5G	2C,9G
	Cerreig	2C,9H	2C,9H	4C,9H
	Avena loca	1C,7G	2C,8G	2C,7G
15	Trigo	6G	6G	9H
	Maíz	2U,9G	10H	9G
	Soja	9H	9H	9H
	Arroz	10E	10E	10E
	Sorgo	2C,9G	9H	9H

20

25

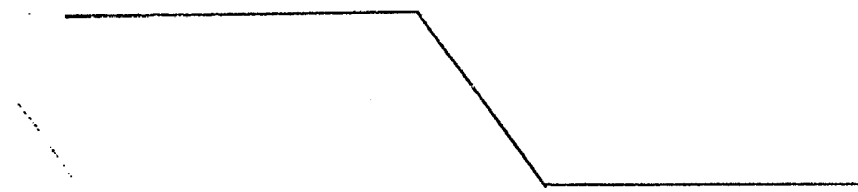
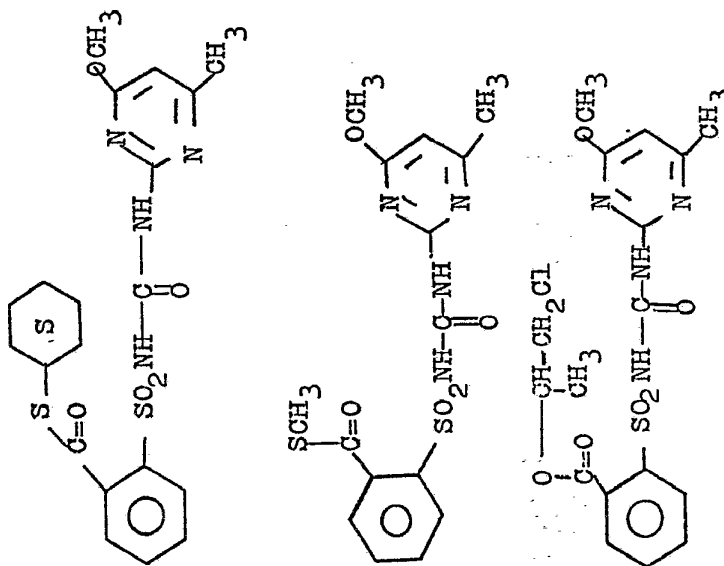


TABLA XII (continuación)

1

5

10



kg/Ha

0,4

0,4

0,4

Post-emergencia

15

Alubia arbustiva

9C

9C

6C,9G

Algodón

9C

9C

9C

Ipomea

10C

9C

10C

Cadillo

9C

9C

9C

Casia

9C

9C

10C

20

Juncia

10C

2C,8G

9C

Garranchuelo

5C,8G

2C,7G

9C

Cerfreig

9C

9C

10C

Avena loca

9C

3C,7H

8C

Trigo

5C,8G

1C,5H

8C

25

Maíz

7U,9C

9C

9C

1

TABLA XII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>	<u>0,4</u>
Soja	6C,9G	9C	5C,9G
5 Arroz	9C	5C,8G	6C,9G
Sorgo	9C	9C	9C
<u>Pre-emergencia</u>			
Ipomea	9H	9G	9G
Cadillo	9G	9G	9G
10 Casia	9G	9G	9G
Juncia	10E	2C,8G	10E
Garranchuelo	5C,9G	2C,9G	1C,9G
Cerreig	9H	2C,9H	6C,9H
Avena loca	4C,9G	2C,8G	5C,8G
15 Trigo	9H	1C,6G	9H
Maíz	9G	1U,9G	9H
Soja	9H	9H	9H
Arroz	10E	10E	10E
Sorgo	9H	9H	5C,9H
20 <u>Ensayo B</u>			

25

Dos bandejas para bulbos se llenan con tierra arcillosa de aluvión de Fallsington fertilizada y calcificada. Una bandeja se siembra con semillas de maíz, sorgo, pelosa azul de Kentucky y varias malas hierbas herbáceas. La otra bandeja se siembra con semillas de soja, tubérculos de jun-

1 cia púrpura (Cyperus rotundus) y semillas de varias malas
hierbas de hoja ancha. Se siembran las siguientes semillas
de malas hierbas herbáceas y de hoja ancha: garranchuelo
(Digitaria sanguinalis), cerreig (Echinochloa crusgalli),
5 avena loca (Avena fatua), cañota (Sorghum halepense), almorejo
gigante (Setaria faberii), grama (Paspalum dilatatum), bro-
mo (Bromus secalinus), mostaza (Brassica arvensis), cadillo
(Xanthium pennsylvanicum), bledo (Amaranthus retroflexus),
ipomea (Ipomoea hederacea), casia (Cassia tora), sida
10 (Sida spinosa), gordolobo (Abutilon theophrasti), y hierba
talpera (Datura stramonium). Una maceta más pequeña también
se llena de tierra preparada y se siembra con arroz y trigo.
Otra maceta pequeña se siembra con semillas de remolacha
azucarera. Los cuatro recipientes anteriores se someten a
15 un tratamiento de pre-emergencia con soluciones de los com-
puestos de esta invención en disolventes no fitotóxicos
(es decir, se rocían las soluciones de dichos compuestos so-
bre la superficie del terreno antes de germinar las semi-
llas). Se preparan duplicados de los recipientes sembrados
20 antes descritos sin tratamiento y se utilizan como controles.

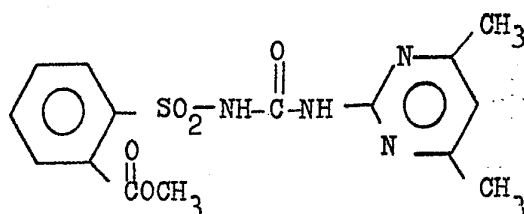
Veintiocho días después del tratamiento, se evalúan
las plantas tratadas y las de control y los datos registra-
dos se encuentran en la Tabla XIII.

1

TABLA XIII

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5

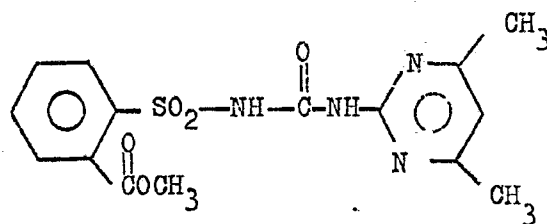


kg/Ha	1/128	1/64	1/32
Garranchuelo	9G, 9C	10C	10C
10 Cerreig	10C	10C	10C
Sorgo	10C	10C	10C
Avena loca	8G, 8C	10C	10C
Cañota	10C	10C	10C
Gramma	8G, 8C	10C	10C
15 Almorejo gigante	9G, 9C	10C	10C
Pelosa azul Ky.	10C	10E	10E
Bromo	10C	10C	10C
Remolacha azuca- rera	8G, 5H	10C	10C
20 Maíz	10C	10C	10C
Mostaza	10C	10C	10C
Cadillo	7G, 5C	7G	8G
Bledo	-	-	-
Juncia	10E	10E	10E
25 Algodón	7G	8G	8G, 5C

1

TABLA XIII (continuación)

kg/Ha	1/128	1/64	1/32
Ipomea	7G	7G	8G,6C
Casia	8G,8C	10C	10C
5 Sida	-	-	-
Gordolobo	10C	10C	10C
Hierba talpera	9G,9C	9G,9C	9G,9C
Soja	8G	8G,5C	10C
Arroz	10C	10C	10C
10 Trigo	10C	10C	10C

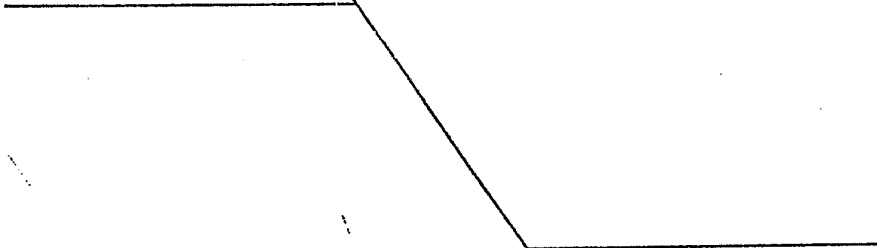


15

kg/Ha	1/16	1/4
Garranchuelo	10C	10C
Cerreig	10C	10C
Sorgo	10E	10E
20 Avena loca	7G,5C	8G,8C
Cañota	10C	10C
Grama	10C	10C
Almorejo gigante	10C	10C
Pelosa azul Ky.	10C	10C
25 Bromo	10C	10C

1

TABLA XIII (continuación)

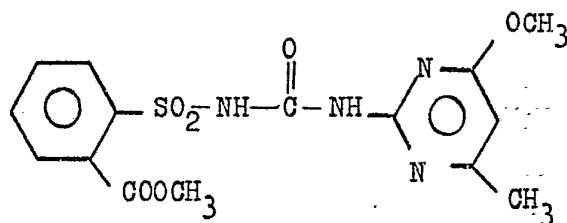
<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Remolacha azuca- rera	10C	10C
5 Maíz	10E	10E
Mostaza	10C	10C
Cadillo	8G, 5H	8G, 8H
Bledo	10E	10E
Juncia	10E	10E
10 Algodón	10E	10E
Ipomea	8G	8G, 8C
Casia	8G, 5C	8G, 8C
Sida	10C	10C
Gordolobo	10C	10C
15 Hierba talpera	8G	8G
Soja	8G, 8C	8G, 8C
Arroz	10E	10E
Trigo	9G, 9H	10H
20		
25		

1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5

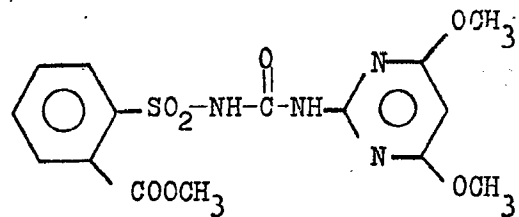


	kg/Ha	1/64	1/32	1/16
	Garranchuelo	8G, 3C	9G, 9C	10C
10	Cerreig	10C	10C	10C
	Sorgo	10C	10C	10C
	Avena loca	8G, 8C	10C	9G, 9C
	Cañota	10C	10C	10C
	Gramma	10C	10C	10C
15	Almorejo gigante	10C	10C	10C
	Pelosa azul Ky.	10C	10E	10E
	Bromo	10C	10C	10C
	Remolacha azuca- rera	10C	10C	10C
20	Maíz	10C	10C	10C
	Mostaza	10C	10C	10C
	Cadillo	8G	8G, 5C	8G, 7C
	Bledo	-	-	-
	Juncia	10E	10E	10E
25	Algodón	9G, 9C	10C	9G, 9C

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Ipomea	8G, 8C	10C	10C
Casia	10C	10C	10C
5 Sida	-	-	-
Gordolobo	10C	10C	10C
Hierba talpera	9G, 9C	10C	10C
Soja	10C	9G, 9C	8G, 5C;
Arroz	10E	10E	10E
10 Trigo	8G, 8C	10C	10C



15

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Garranchuelo	8G, 5C	8G, 5C	10C
Cerreig	10C	10C	10C
Sorgo	9G, 9C	10C	10C
20 Avena loca	5G	7G, 5C	6G, 5C
Cañota	9G, 9C	10C	10C
Gramma	5G	7G	8G, 8C
Almorejo gigante	8G	9G, 9C	10C
Pelosa azul Ky.	10C	10E	10E
25 Bromo	10C	10C	10C

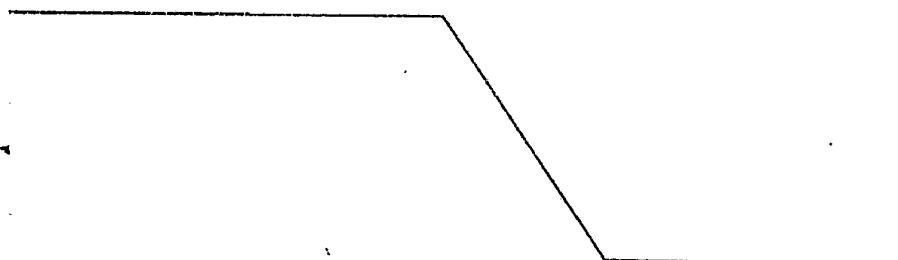
1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Remolacha azu <u>ca</u> rera	10C	10C	10C
5 Maíz	7G,3C	7G,5C	10C
Mostaza	10C	10C	10C
Cadillo	7G	8G,5C	8G,7C
Bledo	-	-	-
Juncia	10E	10E	10E
10 Algodón	7G	7G	7G
Ipomea	8G,8C	10C	9G,9C
Casia	10C	10C	10C
Sida	-	-	-
Gordolobo	10C	10C	10C
15 Hierba talpera	10C	8G,8C	10C
Soja	8G,5C	8G,5C	8G,5C
Arroz	10C	10C	10E
Trigo	10C	8G,8C	10C

20

25

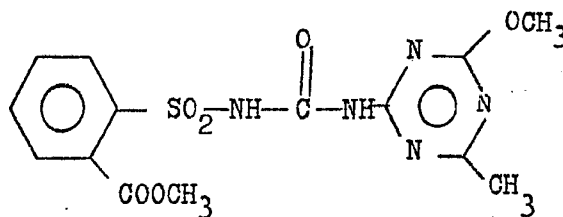


1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



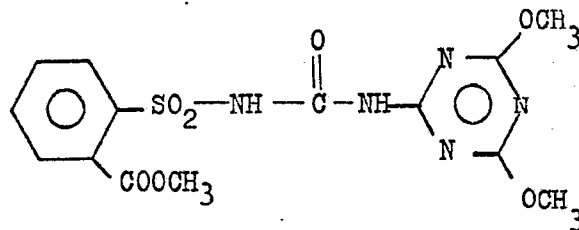
kg/Ha	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Garranchuelo	7G, 3C	9G, 9C	10C
10 Cerreig	9G, 9C	10C	10C
Sorgo	10C	10C	10C
Avena loca	4G	5G, 3C	10C
Cañota	7G, 7C	8G, 8C	10C
Gramma	0	4G, 3C	6G
15 Almorejo gigante	7G, 3C	8G, 5C	10C
Pèlosa azul Ky.	10C	10E	10E
Bromo	7G	8G, 8C	10C
Remolacha azuca- rera	10C	10C	10C
20 Maíz	7G, 5C	10C	10C
Mostaza	10C	10C	10C
Cadillo	8G, 9C	8G, 5C	8G, 5C
Bledo	-	-	-
Juncia	7G	7G	8G
25 Algodón	10C	8G, 5C	10C

1

TABLA XIII (continuación)

kg/Ha	1/64	1/32	1/16
Ipomea	8G, 8C	9G, 9C	10C
Casia	10C	10C	10C
5 Sida	-	-	-
Gordolobo	10C	10C	10C
Hierba talpera	8G, 5C	9G, 8C	9G, 9C
Soja	10C	8G, 5C	8G, 8C
Arroz	8G, 8C	10C	10C
10 Trigo	3G	4G	5G

15



kg/Ha	1/64	1/32	1/16
Garranchuelo	7G	8G, 5C	10C
Cerreig	3G	7G, 7C	9G, 9C
Sorgo	7G	9G, 8C	10C
20 Avena loca	0	10C	5G, 3C
Cañota	6G	7G, 7C	8G, 8C
Gramma	0	0	3G
Almorejo gigante	6G, 3C	5G, 3C	8G, 8C
25 Pelosa azul Ky.	7G, 3C	8G, 5C	10C

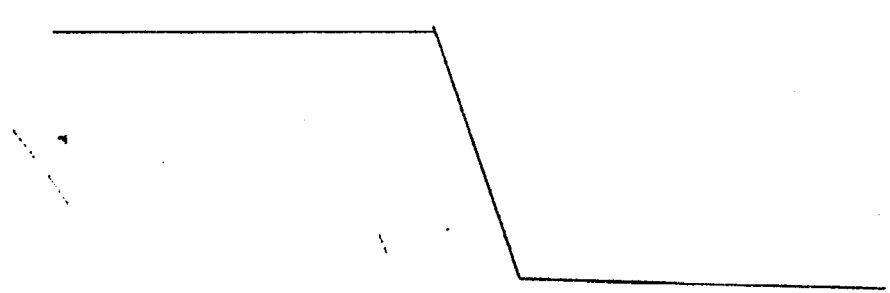
1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Bromo	3G	3G	6G,3C
Remolacha azu- carera	10C	10C	10C
5 Maíz	6G,5H	7G,5C	10C
Mostaza	10C	10C	10C
Cadillo	8G,3C	10C	8G,5C
Bledo	-	-	-
10 Juncia	7G	7G,3C	8G
Algodón	10C	8G	9G,5C
Ipomea	8G,8C	10C	10C
Casia	10C	10C	10C
Sida	-	-	-
15 Gordolobo	7G,8C	8G,9C	10C
Hierba talpera	9G,9C	10C	10C
Soja	8G,7C	9G,8C	8G,5C
Arroz	6G,5C	8G,8C	10C
Trigo	0	2G	4G,3C

20

25

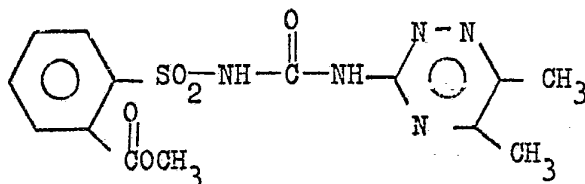


1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



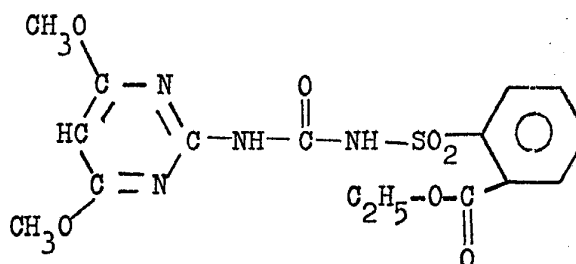
kg/Ha	1/16	1/4
Garranchuelo	0	5G
10 Cerreig	10C	10C
Sorgo	10C	10C
Avena loca	0	5G
Cañota	10C	10C
Gramma	5G	8G, 3C
15 Almorejo gigante	3G	6G
Pelosa azul Ky.	8G	10E
Bromo	10E	10E
Remolacha azucarera	7G	10C
Maíz	4G	8G, 8C
20 Mostaza	10E	10E
Cadillo	7G	8G
Bledo	10E	10E
Juncia	6G	10E
Algodón	4G	7G
25 Ipomea	4G	10E

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Casia	5G	7G, 2C
Sida	0	8G, 5C
5 Gordolobo	5G	7G
Hierba talpera	2G	6G
Soja	7G, 7H	8G, 8H
Arroz	10E	10E
10 Trigo	2G	8G, 5C

10



15

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	0	4G	7G
Cerreig	10C	10C	10C
20 Sorgo	10C	10C	10C
Avena loca	8G, 7C	8G, 8C	10C
Cañota	9G, 9C	10C	10C
Gramma	0	0	6G
Almorejo gigante	4G, 3H	5G, 5H	9G, 9C
25 Pelosa azul Ky.	10E	10E	10E

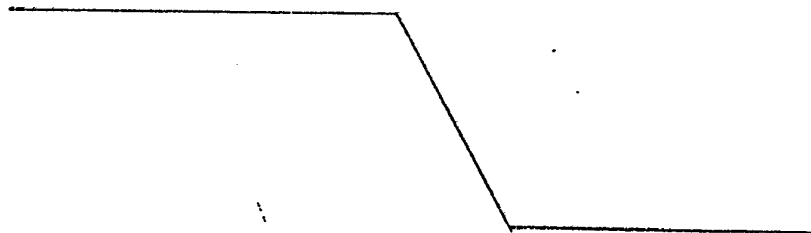
1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Bromo	8G,9C	10E	10E
Remolacha azu- carrera	10C	10C	10C
5 Maíz	8G,8C	10C	10C
Mostaza	10C	10C	10C
Cadillo	7G,2C	7G,5H	7G,5H
Bledo	10E	10E	10E
Juncia	10E	10E	10E
10 Algodón	7G	8G	8G
Ipomea	5G	7G	8G
Casia	7G	8G,3C	8G,8C
Sida	7G	7G	10C
Gordolobo	8G,7C	10C	10C
15 Hierba talpera	7G	7G	8G,5C
Soja	8G,3H	7G,5H	9G,9C
Arroz	10E	10E	10E
Trigo	4G,2C	6G,4C	7G,4C

20

25

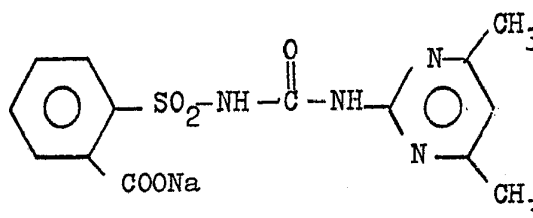


1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5

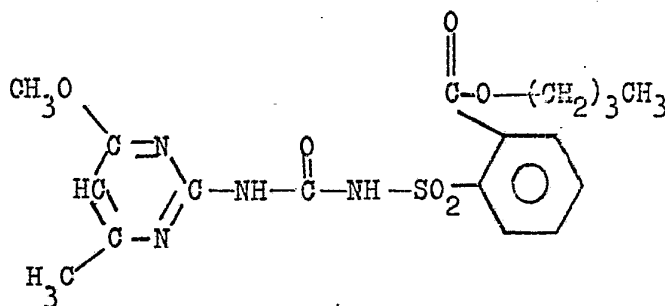


<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	0	0	0
10 Cerreig	0	0	0
Sorgo	0	0	0
Avena loca	0	0	0
Cañota	0	0	0
Gramma	0	0	0
15 Almorejo gigante	0	0	0
Pelosa azul Ky.	0	0	0
Bromo	0	0	6G
Remolacha azuca- rera	6G, 3H	10C	7G, 5H
20 Maíz	0	0	0
Mostaza	0	0	5G
Cadillo	0	0	0
Bledo	0	0	5G
Juncia	0	0	5G
25 Algodón	0	0	0

1

TABLA XIII (continuación)

kg/Ha	1/32	1/16	1/4
Ipomea	0	0	0
Casia	0	0	0
5 Sida	0	0	0
Gordolobo	0	0	0
Hierba talpera	0	0	0
Soja	0	0	0
Arroz	0	0	6G, 5C
10 Trigo	0	0	0



15

kg/Ha	1/32	1/16	1/4
Garranchuelo	0	0	4G
Cerreig	7G, 3C	8G, 3C	10C
20 Sorgo	6G, 3H	5G,	10C
Avena loca	0	0	6G, 3C
Cañota	0	0	5G, 5H
Gramma	4G	5G	10E
Almorejo gigante	3H	3H	10H
25 Pelosa azul Ky.	9G	10E	10E

1

TABLA XIII (continuación)

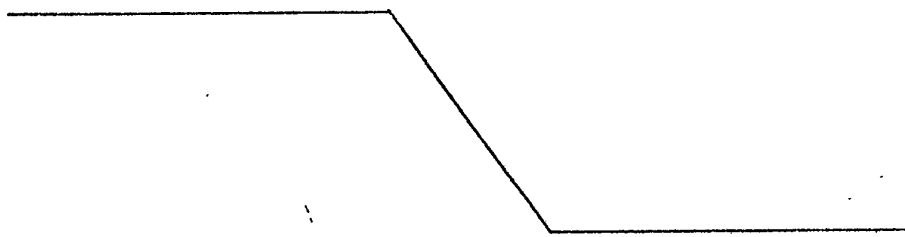
<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Bromo	0	2G	8G, 8C
Remolacha azuca- rera	4G	4G	7G, 7C
5 Maíz	0	4G	5G, 5H
Mostaza	9C	9G, 5C	10C
Cadillo	13H	2H	5G, 5H
Bledo	10E	10E	10E
Juncia	5G	5G	8G
10 Algodón	0	0	3G, 3H
Ipomea	3G	6G	4G
Casia	0	0	3G
Sida	-	-	5G, 5H
15 Gordolobo	7G, 7C	10C	10C
Hierba talpera	0	2G	4G
Soja	0	0	6G, 6H
Arroz	9G, 9C	7G, 5C	10E
Trigo	3G	4G	6G

10

15

20

25

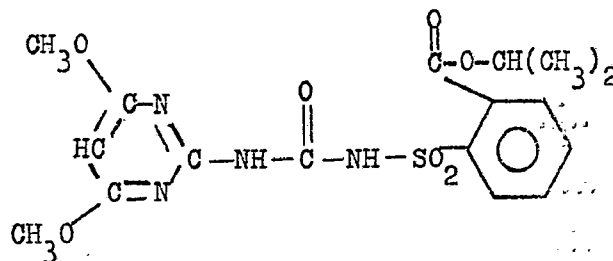


1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5

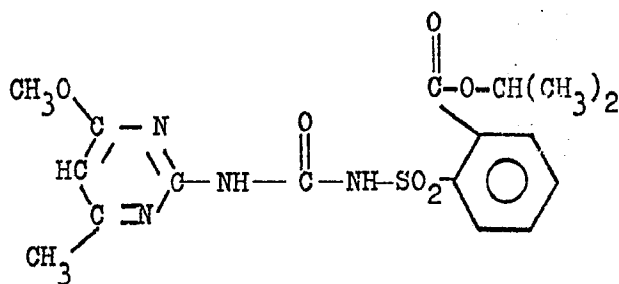


	<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
	Garranchuelo	0	0	6G
10	Cerreig	10C	10C	10C
	Sorgo	9G, 9C	10C	10C
	Avena loca	2G	6G	7G, 5C
	Cañota	8G, 8C	10C	10C
	Gramma	0	0	5G, 3H
15	Almorejo gigante	3H	4G, 3H	10C
	Pelosa azul Ky.	10C	10C	10C
	Bromo	5G	8G, 8C	10E
	Remolacha azuca- rera	10C	10C	10C
20	Maíz	6G, 3H	7G, 7H	10C
	Mostaza	10C	10C	10C
	Cadillo	7G, 5H	8G, 5H	8G, 5H
	Bledo	10E	10E	10E
	Juncia	10E	10E	10E
25	Algodón	6G	7G	9G

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Ipomea	8G	8G	10C
Casia	8G	8G,5H	10C
5 Sida	0	6G,5C	10C
Gordolobo	10C	10C	10C
Hierba talpera	8G,3C	8G,5C	8G,5C
Soja	7G,5H	7G,5H	9G,5H
Arroz	8G,8C	10C	10E
10 Trigo	2G	4G	6G

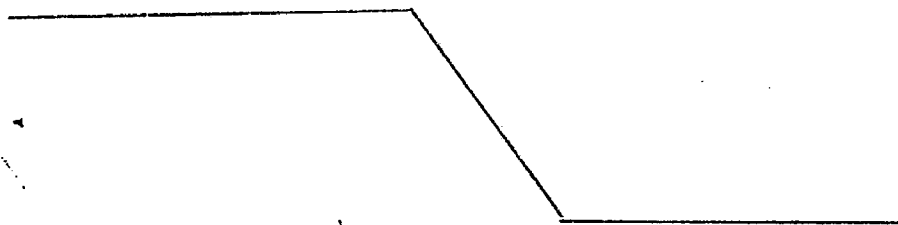


15

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	0	2G	7G
Cerreig	10C	10C	10E
20 Sorgo	10C	10E	10E
Avena loca	4G	7G,3C	10C
Cañota	10C	10C	10C
Gramma	5G	7G	10C
Almorejo gigante	6G,3H	9G,9C	10C
25 Pelosa azul Ky.	10C	10E	10E

1

TABLA XIII (continuación)

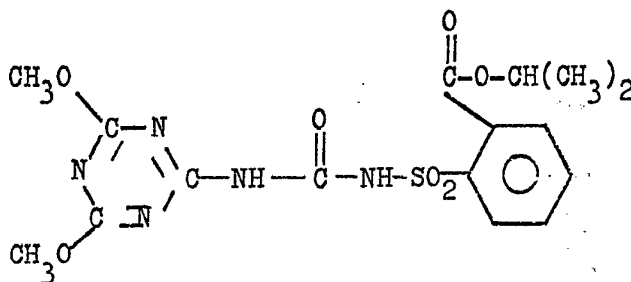
	<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
	Bromo	10E	10E	10E
5	Remolacha azu- rera	10C	10C	10C
	Maíz	10C	10C	10C
	Mostaza	10C	10C	10C
	Cadillo	8G, 5H	8G, 5H	8G, 8H
	Bledo	10E	10E	10E
10	Juncia	10E	10E	10E
	Algodón	6G, 3H	8G, 6C	8G, 6C
	Ipomea	9G	9G	10C
	Casia	8G, 8C	8G, 5C	8G, 9C
	Sida	10C	10C	10C
15	Gordolobo	10C	10C	10C
	Hierba talpera	8G, 5C	8G, 7C	8G, 8C
	Soja	8G, 5H	9G, 5H	9G, 5H
	Arroz	8G, 9C	10C	10E
	Trigo	6G	6G, 5C	10C
20				
25				

1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



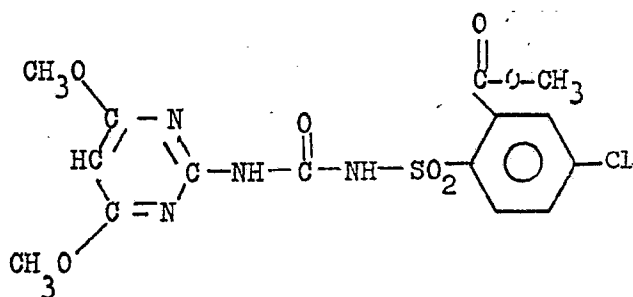
	<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
10	Garranchuelo	0	4G	8G
	Cerreig	0	6G, 3H	8C, 5H
	Sorgo	6G, 3H	7G, 3H	10C
	Avena loca	0	0	5G, 3C
	Cañota	2H	2H	6G, 5H
15	Gramma	0	0	4G
	Almorejo gigante	0	0	7G
	Pelosa azul Ky.	5G, 6C	7G, 8C	10E
	Bromo	0	6G, 3C	7G, 8C
20	Remolacha azuca- rera	10C	10C	10C
	Mafz	7G, 7H	10C	10C
	Mostaza	10C	10C	10C
	Cadillo	8G, 8H	8G, 8H	8G, 8H
	Bledo	10E	10E	10E
25	Juncia	10E	10E	10E

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Algodón	8G	8G	10C
Ipomea	10C	10C	10C
5 Casia	8G,9C	10C	10C
Sida	10C	10C	10C
Gordolobo	10C	10C	10C
Hierba talpera	8G,8C	10C	8G,9C
Soja	9G,5H	9G,5H	9G,5H
10 Arroz	5G,3C	5G,3C	7G,4C
Trigo	0	0	2G

15



20

25

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	3H	6G
Cerreig	6G,4C	10C
Sorgo	10C	10C
Avena loca	6G	8G,5C
Cañota	6G,3H	8G,8C
Gramma	0	4G
25 Almorejo gigante	3H	6G,2C

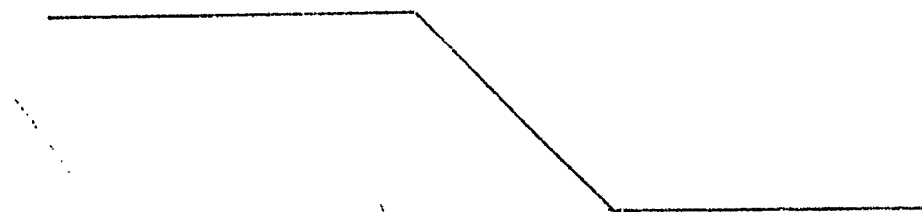
1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Pelosa azul Ky.	8G	10E
Bromo	10E	10E
5 Remolacha azucarera	8G,8C	10C
Maíz	5G,5H	9G,9C
Mostaza	10C	10C
Cadillo	8G,5H	8G,5H
Bledo	10C	10C
10 Juncia	10E	10E
Algodón	5G	5G
Ipomea	6G	8G,8C
Casia	4G	8G,8C
Sida	6G,5C	10C
15 Gordolobo	8G,8C	10C
Hierba talpera	5G,3H	10C
Soja	8G,8C	8G,8C
Arroz	10E	10E
Trigo	0	3G

20

25

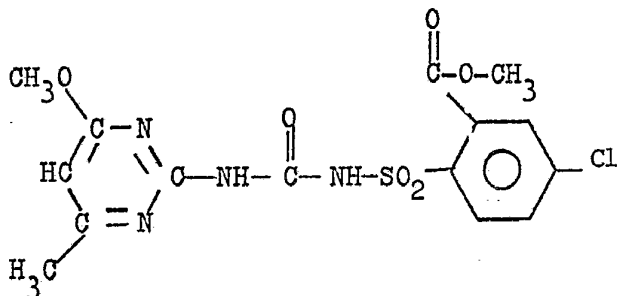


1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



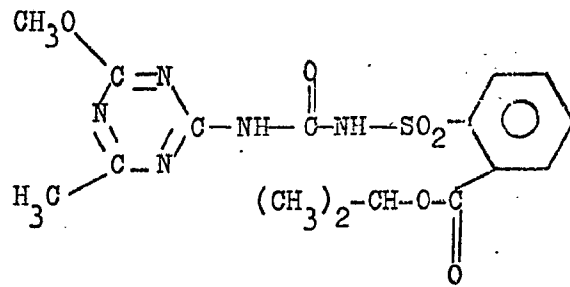
	<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
10	Garranchuelo	0	6G
	Cerreig	6G, 3H	10C
	Sorgo	10C	10C
	Avena loca	6G	10C
	Cañota	6G, 3H	10C
15	Gramma	0	5G
	Almorejo gigante	2H	5G, 2C
	Pelosa azul Ky.	9G	10E
	Gramma	10E	10E
	Remolacha azucarera	7G, 8C	10C
20	Maíz	6G, 5H	9G, 9C
	Mostaza	10C	10C
	Cadillo	6G, 2C	8G, 3C
	Bledo	10C	10C
	Juncia	10E	10E
25	Algodón	3G	8G

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Ipomea	4G	10C
Casia	3G	6G
5 Sida	10C	10C
Gordolobo	8G	10C
Hierba talpera	8G, 8C	10C
Soja	7G, 5H	9G, 9C
Arroz	8G, 8C	10E
10 Trigo	3G	5G, 2C

15



<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	6G	7G
Cerreig	8G, 4C	8G, 6H
20 Sorgo	9G, 8C	10C
Avena loca	6G, 2C	8G, 5C
Cañota	8G, 2C	10C
Gramma	3G	5G
Almorejo gigante	6G	8G, 4C
25 Pelosa azul Ky.	9G	10E

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Bromo	7G	10C
Remolacha azucarera	10C	10C
5 Maíz	9G,9C	10C
Mostaza	10C	10C
Cadillo	8G,8C	8G,8C
Bledo	10E	10E
Juncia	7G	9G
10 Algodón	9G,5H	9G,5H
Ipomea	9G,9C	9G,9C
Casia	8G,9C	10C
Sida	10C	10C
Gordolobo	10C	10C
15 Hierba talpera	5G	8G,7C
Soja	9G,9C	9G,9C
Arroz	6G,3C	8G,8C
Trigo	0	0

20

25

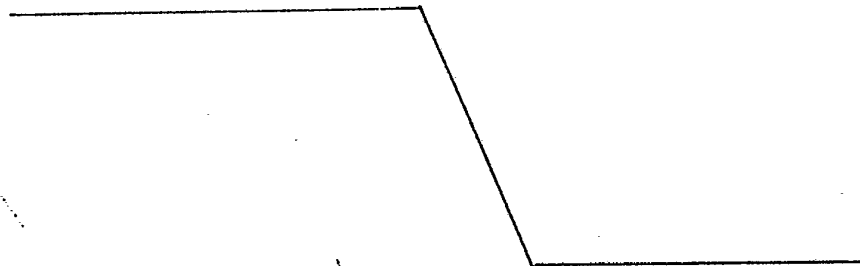
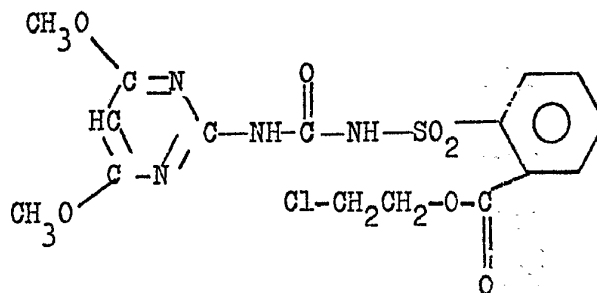


TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington



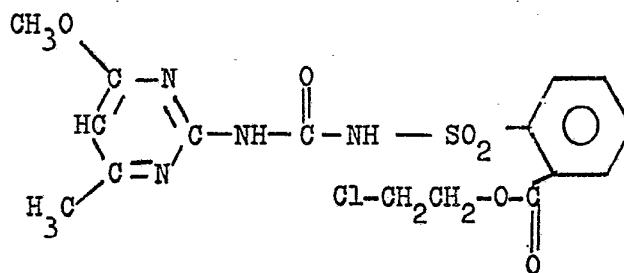
	kg/Ha	1/16	1/4
10	Garranchuelo	0	6G
	Cerreig	10C	10C
	Sorgo	10C	10C
	Avena loca	8G, 3C	8G, 3C
	Cañota	9G, 3C	10C
15	Gramma	4G	8G, 5C
	Almorejo gigante	10C	10C
	Pelosa azul Ky.	10E	10E
	Bromo	10C	10E
	Remolacha azucarera	9G, 9C	9G, 9C
20	Mafz	5G, 3H	7G, 7H
	Mostaza	10C	10C
	Cadillo	7G, 5H	8G, 5C
	Bledo	10E	10E
	Juncia	10E	10E
25	Algodón	3G	8G

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/4</u>
Ipomea	5G	10C
Casia	7G, 5C	8G, 7C
5 Sida	3H	7G, 5H
Gordolobo	10C	10C
Hierba talpera	5G	7G
Soja	8G, 8H	9G, 9H
Arroz	10C	10E
10 Trigo	5G	6G

15



<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	01	4G
20 Cerreig	10C	10C
Sorgo	10C	10C
Avena loca	8G, 2C	8G, 6C
Cañota	9G, 9C	10C
Gramma	5G	8G, 9C
25 Almorejo gigante	6G, 4H	10C

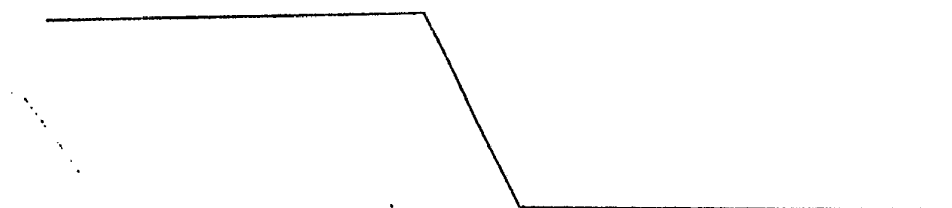
1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/4</u>
Pelosa azul Ky.	10E	10E
Bromo	10E	10E
5 Remolacha azucarera	9G,9C	9G,9C
Maíz	9G,9C	9G,9C
Mostaza	10C	10C
Cadillo	8G,5H	7G,5H
Bledo	10E	10E
10 Juncia	10E	10E
Algodón	6G,2H	8G,5H
Ipomea	10C	8G,5C
Casia	7G,3C	8G,7C
Sida	9G,9C	10C
15 Gordolobo	10C	10C
Hierba talpera	6G	8G,7C
Soja	8G,8H	8G,9H
Arroz	10E	10E
Trigo	7G	10C

20

25

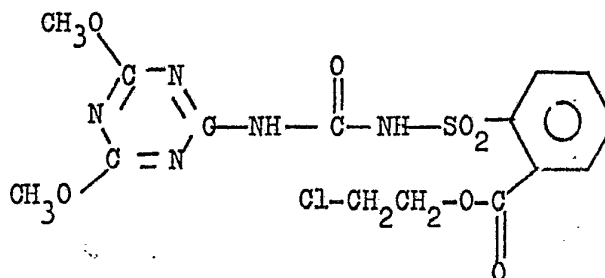


1

TABLA XIII (continuación)

Preemergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



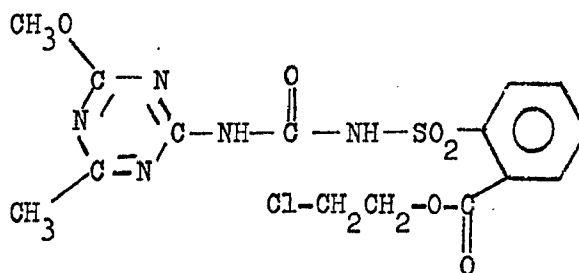
	kg/Ha	1/16	1/4
10	Garranchuelo	0	0
	Cerreig	4G	4G
	Sorgo	5G	7G
	Avena loca	3G	0
	Cañota	0	6G, 6E
15	Gramma	0	0
	Almorejo gigante	0	3H
	Pelosa azul Ky.	6G	8G
	Bromo	0	3G
	Remolacha azucarera	10C	10C
20	Maíz	4G, 2H	7G, 5H
	Mostaza	9G	10C
	Cadillo	8G, 5H	8G, 5C
	Bledo	10E	10E
	Juncia	8G	8G
25	Algodón	7G, 5H	8G, 5H

1

TABLA XIII (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Ipomea	8G	8G, 5C
Casia	7G, 3C	8G, 9C
5 Sida	5G, 6H	10C
Gordolobo	7G, 7C	10C
Hierba talpera	3G	5G
Soja	3G	6G, 5H
Arroz	6G, 3C	5G, 3C
10 Trigo	0	0

15



20

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	0	5G
Cerreig	0	7G, 4C
Sorgo	8G	10C
Avena loca	3G	6G
Cañota	0	6G
Gramma	0	0
25 Almôrejo gigante	0	6G
Pelosa azul Ky.	8G	10E

1 TABLA XIII (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
	Bromo	3G	6G
	Remolacha azucarera	9G,9C	10C
5	Maíz	5G,3H	7G,8H
	Mostaza	10C	10C
	Cadillo	8G,5H	8G,8C
	Bledo	10E	10E
	Juncia	7G	7G
10	Algodón	7G	8G
	Ipomea	8G	8G,5C
	Casia	7G,3C	8G,9C
	Sida	5G,5H	10C
	Gordolobo	10C	10C
15	Hierba talpera	3G	5G
	Soja	2G,2H	7G,7H
	Arroz	6G,3C	6G,3C
	Trigo	0	0

ENSAYO C

20 Unas macetas llenas de tierra arcillosa de Fallsington se siembran con soja, algodón, maíz, arroz, trigo, sorgo, alfalfa, gordolobo (Abutilon theophrasti), sesbania (Sesbania exaltata), casia (Cassia tora), ipomea (Ipomoea esp.), hierba talpera (Datura stramonium), cadillo (Xanthium pennsylvanicum), garranchuelo (Digitaria esp.), juncia

25

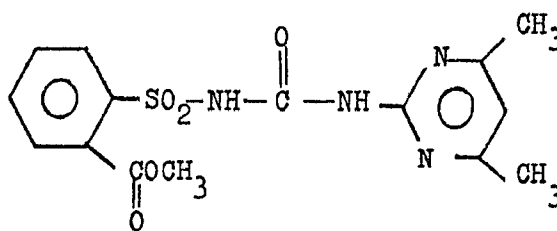
1 (Cyperus rotunda), cerreig (Echinochloa crusgalli), almorejo
gigante (Setaria faberii) y avena loca (Avena fatua). Aproximadamente dos semanas y media después de la siembra, las
5 plantitas jóvenes y la tierra alrededor de ellas se rocían desde arriba con el compuesto del Ejemplo 1 disuelto en un disolvente no fitotóxico. Otros grupos de las mismas malas hierbas y plantas cultivables se rocían con el mismo disolvente no fitotóxico para proporcionar las plantas de control.
10 Catorce días después del tratamiento, todas las plantas tratadas se comparan con los controles de disolvente no fitotóxico y se clasifica visualmente su respuesta al tratamiento, obteniéndose los datos presentados en la Tabla XIV. Se observará que el trigo tolera varios de los compuestos incluidos en esta tabla.

15

TABLA XIV

Tratamiento sobre la tierra superficial/follaje

20



25

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 8C	10G, 7C
Gordolobo	10C	10C
Sesbania	10G, 9C	10C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Casia	10G,6C	10G,7C
Algodón	10G,7C	10G,6C
5 Ipomea	10G,7C	10C
Hierba talpera	10G,9C	10G,9C
Cadillo	10G,8C	10G,8C
Maíz	10G,9C	10C
Garranchuelo	10G,4C	10G,8C
10 Arroz	10G,4C	10G,6C
Juncia	10G,6C	10G,7C
Cerreig	10G,8C	10G,9C
Trigo	10G,7C	10G,7C
Almorejo gigante	10G,7C	10G,8C
15 Avena loca	10G,8C	10G,9C
Sorgo	10G,9C	10G,8C

20

25

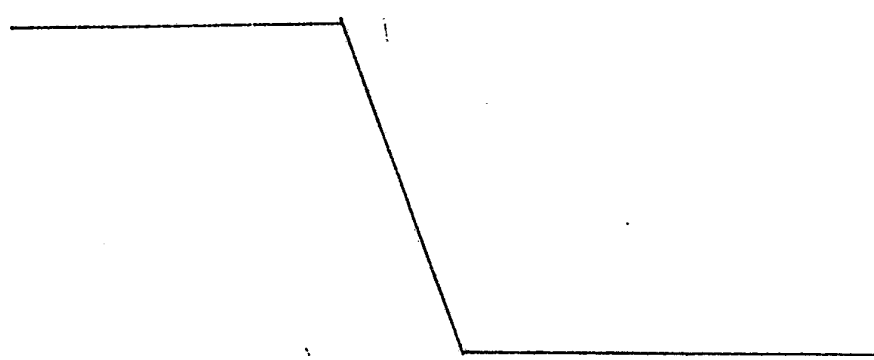
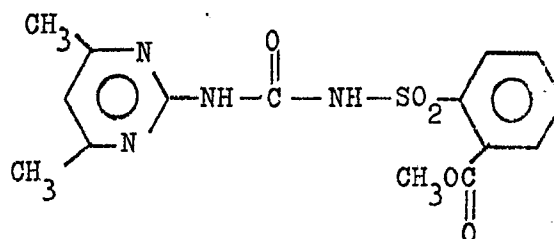


TABLA XIV (continuación)

Tratamiento sobre la tierra superficial/follaje



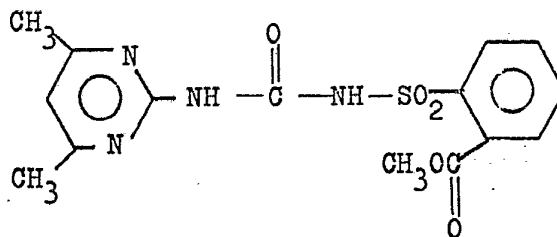
	kg/Ha	1/500	1/250	1/128
5				
10	Soja	10G, 8C	10G, 9C	10G, 9C
	Gordolobo	10C	10C	10C
	Sesbania	8G, 7C	10G, 8C	10G, 9C
	Casia	8G, 3C	10G, 8C	10G, 6C
	Algodón	10G, 7C	10C	10G, 9C
15	Ipomea	2G	6G	7G, 3C
	Alfalfa	5G	10G, 6C	10G, 5C
	Hierba talpera	3G	8G, 3C	10C
	Cadillo	10G	8G, 2C	10G, 8C
	Maíz	10G, 7C	8G, 3U	10G, 9C
20	Garranchuelo	5G	5G	6G
	Arroz	10G, 4C	8G, 2C	10G, 5C
	Juncia	10G, 3C	10G, 4C	10C
	Cerreig	10C	10G, 3C	10G, 8C
	Trigo	10G, 9C	8G	10G, 4C
25	Almorejo gigante	10G, 8C	8G	10G, 7C

1

TABLA XIV (continuación)

kg/Ha	1/500	1/250	1/128
Avena loca	8G, 3C	8G	10G, 5C
Sorgo	10G, 3C	10G, 4C	10G, 7C

5



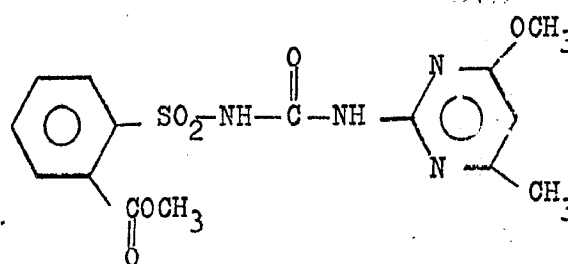
10

kg/Ha	1/64	1/32
Soja	10G, 8C	10G, 8C
Gordolobo	10G, 8C	10C
Sesbania	10G, 9C	10G, 9C
15 Casia	10G, 8C	10G, 8C
Algodón	10G, 8C	10G, 8C
Ipomea	10G, 9C	10G, 9C
Alfalfa	10G, 8C	10G, 8C
Hierba talpera	10G, 9C	10C
20 Cadillo	10G, 7C	10C
Maíz	10G, 9C	10G, 8C
Garçanchuelo	6G	10G, 4C
Arroz	10G, 6C	10G, 6C
Juncia	10G, 8C	10G, 9C
25 Cerreig	10G, 9C	10G, 9C

1

TABLA XIV (continuación)

kg/Ha	1/64	1/32
Trigo	10G,9C	10G,7C
Almorejo gigante	10G,9C	10G,9C
5 Avena loca	10G,7C	10G,7C
Sorgo	10G,8C	10G,8C



10

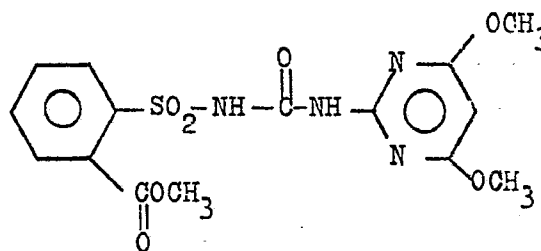
kg/Ha	1/64	1/32	1/16
Soja	10G,9C	10G,9C	10G,8C
Gordolobo	10C	10C	-
15 Sesbania	10G,9C	10G,9C	10G,9C
Casia	10G,9C	10G,8C	10G,9C
Algodón	10G,7C	10G,7C	10G,7C
Ipomea	10G,9C	10C	10C
Alfalfa	10G,9C	10C	10G,9C
20 Hierba talpera	10C	10C	10C
Cadillo	10G,9C	10G,9C	10C
Maíz	10G,8C	10G,7C	10G,9C
Garranchuelo	3G	7G,3C	10G,5C
Arroz	10G,3C	10G,4C	10G,6C
25 Juncia	10G,6C	10G,6C	10G,8C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Cerreig	10G, 9C	10G, 7C	10G, 9C
Trigo	10G, 8C	10G, 7C	10G, 9C
5 Almorejo gigante	10G, 7C	10G, 7C	10C
Avena loca	10G, 7C	10G, 9C	10G, 8C
Sorgo	10G, 7C	10G, 7C	10G, 9C

10



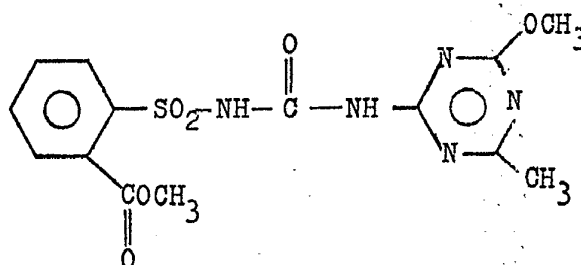
<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Soja	10G, 9C	10G, 9C	10G, 8C
15 Gordolobo	10C	10C	10C
Sesbania	10G, 9C	10G, 9C	10G, 9C
Casia	10G, 8C	10C	10G, 9C
Algodón	10G, 6C	10G, 6C	10G, 8C
Ipomea	10C	10C	10G, 9C
20 Alfalfa	10G, 9C	10G, 9C	10G, 9C
Hierba talpera	10C	10C	10C
Cadfillo	10C	10C	10C
Maíz	10G, 7C	10G, 8C	10G, 8C
Garranchuelo	4G	5G, 2C	3G, 2C
25 Arroz	10G, 4C	10G, 4C	10G, 4C

1

TABLA XIV (continuación)

kg/Ha	1/64	1/32	1/16
Juncia	10G,9C	10G,9C	10G,9C
Cerreig	10G,7C	10G,9C	10G,8C
5 Trigo	8G,3C	10G,7C	10G,8C
Almorejo gigante	10G,9C	10G,9C	10C
Avena loca	10G,6C	10G,5C	8G,4C
Sorgo	10G,8C	10G,9C	10G,9C

10



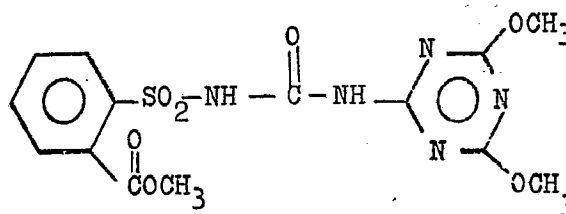
kg/Ha	1/64	1/32	1/16
15 Soja	10G,8C	10G,8C	10G,9C
Gordolobo	-	10C	10C
Sesbania	10G,9C	10G,9C	10G,9C
Casia	10G,7C	10G,9C	10G,8C
Algodón	10G,5C	10G,8C	10G,8C
20 Ipomea	10C	10C	10C
Alfalfa	10G,8C	10G,9C	10G,9C
Hierba talpera	10C	10C	10C
Cadillo	10G,8C	10C	10C
Maíz	9G,3C	10G,8C	10G,9C
25 Garranchuelo	0	3H,2H	5G,2C

1

TABLA XIV (continuación)

kg/Ha	1/64	1/32	1/16
Arroz	7G	10G, 2C	10G, 4C
Juncia	0	4G	2G
5 Cerreig	8G, 5H	10G, 6C	10G, 7C
Trigo	7G, 3H	5G	5G
Almorejo gigante	10G, 2C	10G, 7C	10G, 4C
Avena loca	6G	10G, 2C	10G, 3C
Sorgo	10G, 2C	10G, 5C	10G, 5C

10



15

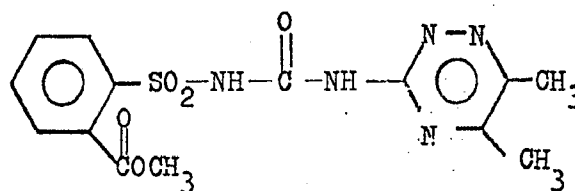
kg/Ha	1/64	1/32	1/16
Soja	10G, 8C	10G, 8C	10G, 8C
Gordolobo	-	-	10C
Sesbania	10G, 9C	10G, 9C	10G, 9C
Casia	10G, 8C	10G, 8C	10G, 8C
20 Algodón	10G, 5C	10G, 9C	10G, 8C
Ipomea	10G, 9C	10C	10C
Alfalfa	-	8G, 6C	10G, 6C
Hierba talpera	10G, 9C	10C	10C
Cadillo	10G, 2C	10G, 7C	10G, 9C
25 Maíz	8G, 4H	8G, 2C	9G, 4C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Garranchuelo	0	0	2G
Arroz	6G	10G, 2C	10G, 3C
5 Juncia	0	0	5G, 2C
Cerreig	6G, 2H	9G, 3H	10G, 5H
Trigo	3G, 2H	3G	3G
Almorejo gigante	3G	7G	10G, 3C
Avena loca	0	2G	3G, 2C
10 Sorgo	5G, 2H	10G, 4H	10G, 4H

15



20

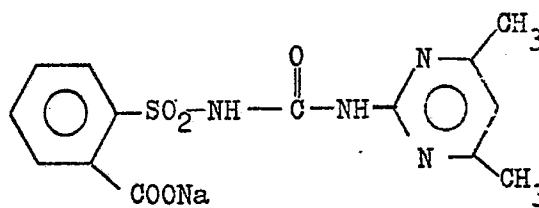
<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 8C	10G, 9C
Gordolobo	5G	10C
Sesbania	10C	10C
20 Casia	10G, 8C	10G, 8C
Algodón	5G, 2C	7G, 3H
Ipomea	4G	9G, 3C
Alfalfa	2C	10G, 6C
Hierba talpera	4G, 2C	6G, 2C
25 Cadillo	3G, 3C	9G, 6C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Maíz	6G, 3H	10G, 7C
Garranchuelo	0	2G
5 Arroz	10G, 8C	10G, 7C
Juncia	10G, 3C	10G, 3C
Cerreig	10G, 4C	10G, 5C
Trigo	8G	10G
Almorejo gigante	5G	8G
10 Avena loca	5G	8G
Sorgo	10G, 6C	10G, 6C

15



20

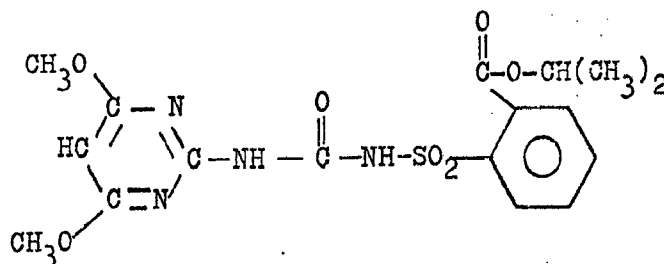
<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	0	0	5G, 2C
Gordolobo	0	0	5G
20 Sesbania	0	3G	7G
Casia	0	0	5G, 3C
Algodón	0	0	5G
Ipomea	0	0	5G
Alfalfa	0	0	3G
25 Hierba talpera	0	0	2G

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Cadillo	0	0	3G
Maíz	0	0	8G, 5H
5 Garranchuelo	0	0	0
Arroz	0	3G	8G
Juncia	0	3G	8G
Cerreig	0	0	4G
Trigo	0	0	4G
10 Almorejo gigante	0	0	2G
Avena loca	0	0	3G
Sorgo	0	4G	8G, 3H

15



20

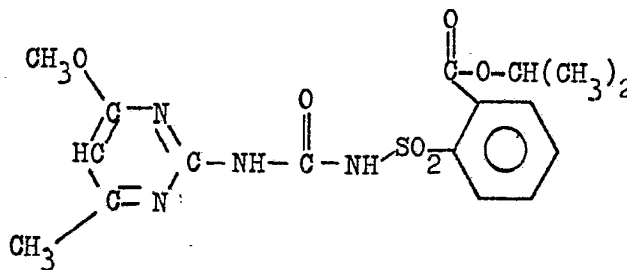
<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 8C	10G, 8C	10C
Gordolobo	10C	10C	10C
Sesbania	10G, 9C	10C	10C
Casia	10G, 8C	10G, 8C	10G, 9C
Algodón	10C	10C	10C
25 Ipomea	10C	10C	10C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Alfalfa	10C	10C	10C
Hierba talpera	10C	10C	10C
5 Cadillo	10C	10C	10C
Maíz	8G, 3H	10G, 3C	10G, 8C
Garranchuelo	5G	5G	9G, 3C
Arroz	10G, 6C	10G, 5C	10G, 6C
Juncia	10G, 8C	10G, 9C	10G, 8C
10 Cerreig	10G, 8C	10G, 9C	10G, 9C
Trigo	8G	10G	10G, 3H
Almorejo gigante	10G	10G	10G, 3C
Avena loca	10G	10G	10G, 3C
Sorgo	10G, 5C	10C	10G, 8C

15



20

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 8C	10G, 8C	10G, 8C
Gordolobo	10C	10C	-
Sesbania	10G, 9C	10C	10C
25 Casia	10G, 8C	10G, 8C	10G, 8C

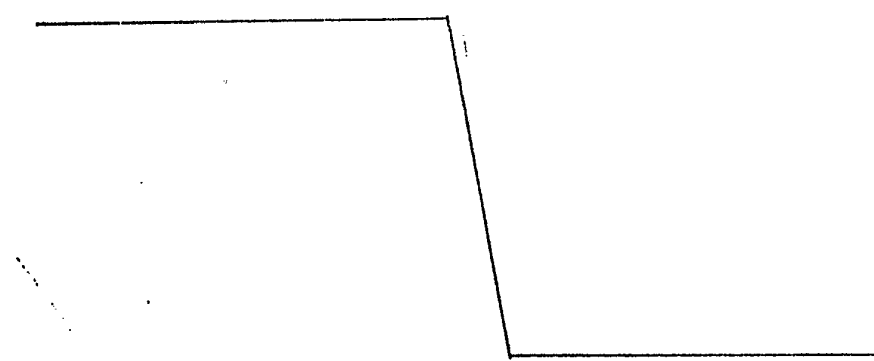
1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Algodón	10C	10C	10C
Ipomea	10C	10C	10C
5 Alfalfa	10C	10C	10C
Hierba talpera	10C	10C	10C
Cadillo	10G, 9C	10C	10C
Maíz	8G, 3C	7G, 3C	10G, 9C
Garranchuelo	8G	8G	10G, 3C
10 Arroz	10G, 5C	10G, 4C	10G, 6C
Juncia	10G, 8C	8G, 3C	10G, 8C
Cerreig	10G, 8C	10G, 6C	10G, 8C
Trigo	9G	10G, 3C	10G, 5C
Almorejo gigante	10G	10G	10G, 6C
15 Avena loca	10G	10G, 3C	10G, 5C
Sorgo	10G, 4C	10G, 3C	10G, 8C

20

25

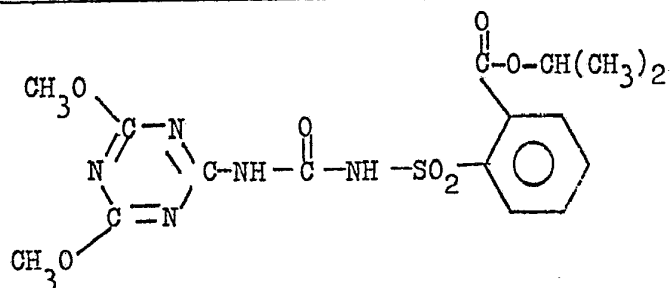


1

TABLA XIV (continuación)

Tratamiento sobre la tierra superficial/follaje

5



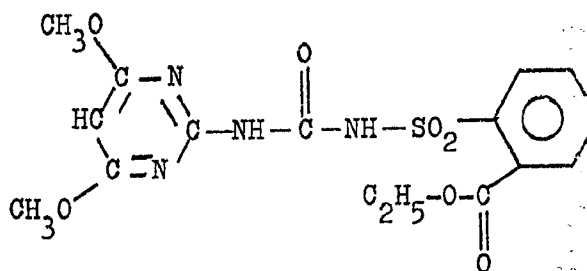
	kg/Ha	1/32	1/16	1/4
10	Soja	10G, 8C	10G, 9C	10G, 8C
	Gordolobo	10C	10C	10C
	Sesbania	10C	10C	10C
	Casia	10G, 9C	10G, 9C	10G, 9C
	Algodón	10G, 7C	10C	10C
15	Ipomea	10C	10C	10C
	Alfalfa	10G, 9C	10C	10C
	Hierba talpera	10C	10C	10C
	Cadillo	10C	-	10C
	Maíz	-	8G, 5H	10G, 4C
20	Garranchuelo	0	3G	7G
	Arroz	6G	8G	10G, 4C
	Junçia	10G, 8C	10G, 9C	10C
	Cerreig	7G, 3H	8G, 3H	8G, 3H
	Trigo	0	0	0
25	Almorejo gigante	2G	0	5G

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Avena loca	5G	5G	8G
Sorgo	8G, 3H	10G, 3H	10G, 3H

5



10

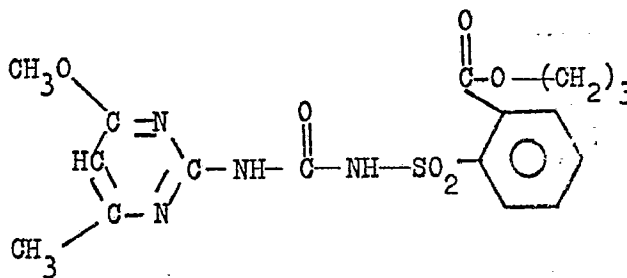
<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 8C	10C	10G, 9C
Gordolobo	10C	10C	10C
Sesbania	10C	10C	10G, 9C
15 Casia	10G, 9C	10G, 9C	10G, 9C
Algodón	10G, 9C	10C	10C
Ipomea	10C	10C	10C
Alfalfa	10C	10C	10C
Hierba talpera	10G, 9C	10C	10C
20 Cadillo	10C	10C	10C
Maíz	10G, 9C	10G, 9C	10C
Garranchuelo	5G	7G	10G, 3C
Arroz	10G, 7C	10G, 7C	10G, 7C
Juncia	10C	10C	10C
25 Cerreig	10G, 8C	10G, 7C	10G, 9C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Trigo	8G	10G, 3C	10G, 4C
Almorejo gigante	7G	10G	10G, 3C
5 Avena loca	10G, 6C	10G, 5C	10G, 7C
Sorgo	10C	10G, 8C	10C

10



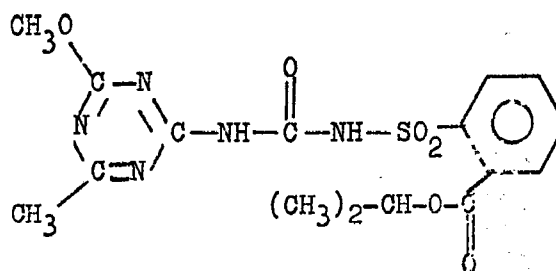
<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 3C	10G, 6C	10G, 6C
15 Gordolobo	10G, 7C	10C	10C
Sesbania	10G, 5C	10G, 7C	10G, 8C
Casia	10G	4G	8G, 3C
Algodón	10G, 4C	-	10G, 8C
Ipomea	10G, 3B	10G, 5B	10B
20 Alfalfa	10G, 6C	10G, 6C	10G, 9C
Hierba talpera	8G, 3C	8G, 3C	10G, 6C
Cadillo	10G, 4C	10G, 6C	10G, 6C
Maíz	5G, 2H	8G, 3H	10G, 3H
Garranchuelo	0	0	0
25 Arroz	8G	10G, 2C	10G, 4C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Juncia	3G	8G	9G
Cerreig	8G, 2C	10G, 3C	10G, 3C
5 Trigo	0	3G	5G
Almorejo gigante	7G	7G	10G, 3H
Avena loca	6G	7G	9G
Sorgo	5G	10G, 3H	10G, 3H

10



15

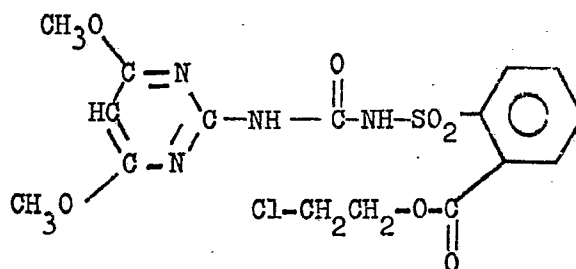
<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 9C	10G, 9C
Gordolobo	10C	-
Sesbania	10C	10C
Casia	10C	10G, 9C
20 Algodón	10C	10C
Ipomea	10C	10C
Alfalfa	10C	10C
Hierba talpera	10G, 6C	10G, 7C
Cadillo	10C	10C
25 Maíz	10G, 2C	10G, 8C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Garranchuelo	4G	7G
Arroz	7G	10G, 2C
5 Juncia	8G, 3C	10C
Cerreig	7G	10G, 3C
Trigo	0	3G
Almorejo gigante	0	7G
Avena loca	3G	8G
10 Sorgo	8G, 5H	8G, 2C

15



20

25

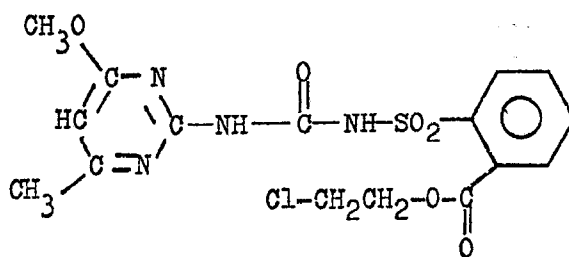
<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 9C	10G, 9C
Gordolobo	10C	-
20 Sesbania	10G, 9C	10C
Casia	10G, 8C	10C
Algodón	10G, 8C	10G, 9C
Ipomea	10C	10C
Alfalfa	10G, 9C	10C
25 Hierba talpera	8G, 3C	10G, 5C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Cadillo	10C	10C
Maíz	8G, 2C	9G, 2C
5 Garranchuelo	5G	8G, 2C
Arroz	10G, 4C	10G, 5C
Juncia	10G, 6C	10G, 6C
Cerreig	10G, 7C	10G, 8C
Trigo	6G	10G
10 Almorejo gigante	10G, 7C	10G, 9C
Avena loca	8G	10G, 3C
Sorgo	10G	10G

15



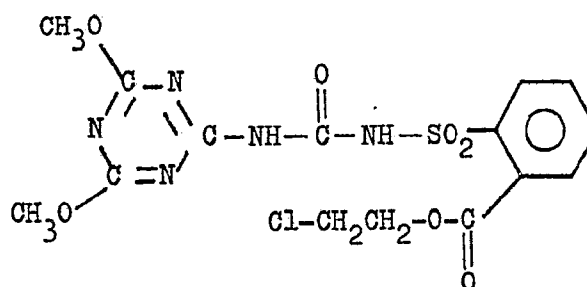
20

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 9C	10G, 9C
Gordolobo	-	-
Sesbania	10C	10C
Casia	10C	10C
Algodón	10C	10G, 8C
25 Ipomea	10G, 9C	10G, 9C

Tabla XIV (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
1	Alfalfa	10C	10C
	Hierba talpera	10G,7C	10G,8C
5	Cadillo	-	10C
	Maíz	10G,5C	10G,3C
	Garranchuelo	4G	7G
	Arroz	10G,4C	10G,5C
	Juncia	10G,8C	10G,5C
10	Cerreig	10G,8C	10G,8C
	Trigo	10G	10G,4C
	Almorejo gigante	10G,3C	10G,9C
	Avena loca	10G,2C	10G,2C
	Sorgo	10G	10G,2C

15



20

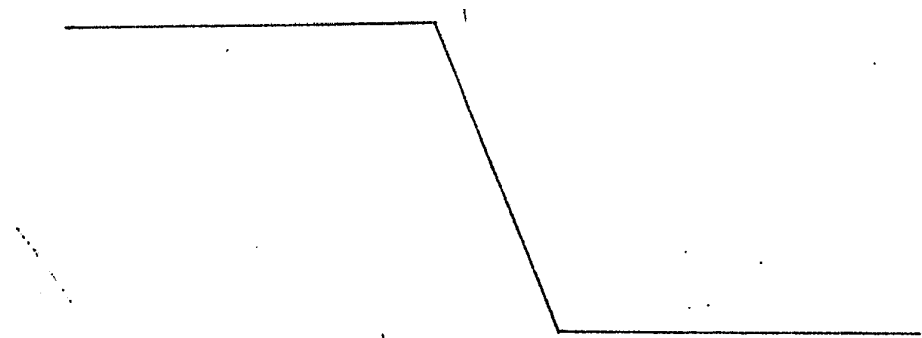
	<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
	Soja	10G,9C	10G,9C
	Gordolobo	-	10C
	Sesbania	10C	10C
25	Casia	10G,9C	10C

1 TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Algodón	10G,9C	10G,8C
Ipomea	10C	10C
5 Alfalfa	5G	10G,9C
Hierba talpera	8G,4C	10G,4C
Cadillo	10C	-
Maíz	5G	8G,2C
Garranchuelo	3G	4G
10 Arroz	4G	6G
Juncia	10G,4C	10G,4C
Cerreig	7G	8G
Trigo	0	0
Almorejo gigante	0	0
15 Avena loca	0	5G
Sorgo	6G	8G

20

25

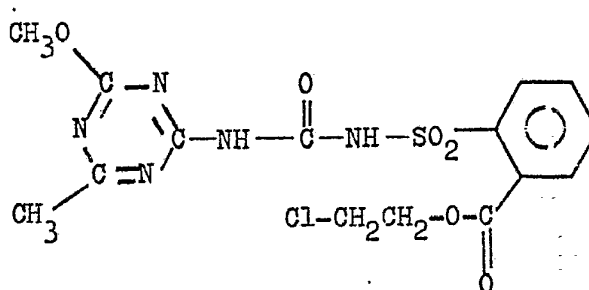


1

TABLA XIV (continuación)

Tratamiento sobre la tierra superficial/follaje

5



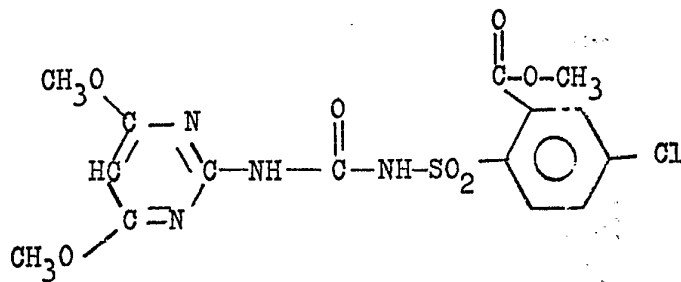
	<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
10	Soja	10G, 9C	10G, 9C
	Gordolobo	10C	-
	Sesbania	10C	10C
	Casia	10G, 9C	10C
	Algodón	10G, 8C	10G, 9C
15	Ipomea	10C	10C
	Alfalfa	10C	10C
	Hierba talpera	10G, 5C	10G, 8C
	Cadillo	10C	10C
	Maíz	10G, 3H	10G, 3C
20	Garranchuelo	0	3G
	Arroz	4G	7G
	Juncia	5G	9G, 4C
	Cerreig	6G	8G
	Trigo	0	0
25	Almorejo gigante	0	3G

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Avena loca	3G	5G
Sorgo	10G, 3H	10G

5



10

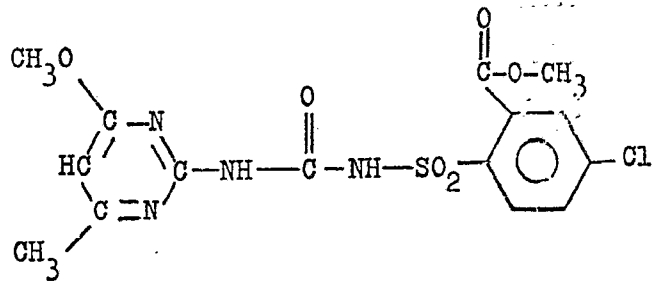
<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 7C	10G, 8C
Gordolobo	10C	10C
Sesbania	10C	10C
15 Casia	10G, 7C	10G, 7C
Algodón	10G, 7C	10G, 9C
Ipomea	10G, 9C	10C
Alfalfa	10G, 9C	10G, 9C
Hierba talpera	10G, 3C	10G, 6C
20 Cadillo	10C	10C
Maíz	4G	7G, 3H
Garranchuelo	0	4G
Arroz	10G, 3C	10G, 3C
Juncia	10G, 5C	10G, 8C
25 Cerreig	10G, 3H	10G, 4C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Trigo	2G	7G
Almorejo gigante	0	5G, 2C
5 Avena loca	5G	8G, 3H
Sorgo	10G	10G, 2C

10



<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Soja	10G, 7C	10G, 7C
15 Gordolobo	10C	10C
Sesbania	10G, 7C	10G, 9C
Casia	10G, 7C	10G, 7C
Algodón	10G, 6C	10G, 9C
Ipomea	10C	10C
20 Alfalfa	10G, 9C	10G, 9C
Hierba talpera	10G, 8C	10G, 8C
Cadillo	10C	10G, 9C
Maíz	10G, 5H	8G
Garranchuelo	0	5G
25 Arroz	8G, 2C	10G, 6C

1

TABLA XIV (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/4</u>
Juncia	7G, 2C	7G, 3C
Cerreig	8G, 3C	10G, 6C
5 Trigo	4G	8G
Almorejo gigante	2G	6G
Avena loca	10G	8G, 3C
Sorgo	10G	10G

ENSAYO D

10

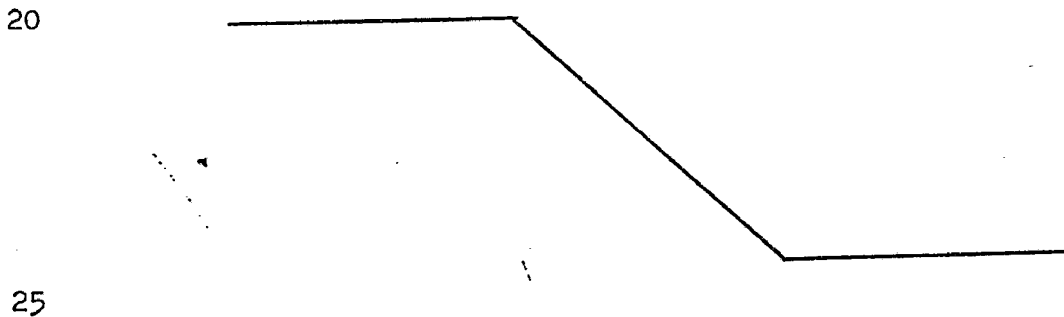
La gran actividad herbicida de uno de los compuestos de esta invención se pone en evidencia en los resultados obtenidos en este ensayo. El experimento se refiere a aplicaciones de pre-emergencia sobre la tierra. Los recipientes utilizados eran macetas de plástico de 25 cm de diámetro llenos de tierra arcillosa de aluvión de Fallsington. Una serie de macetas se sembró de malas hierbas cuyas semillas se mezclaron uniformemente con la capa superior de tierra de 1,2 cm de espesor. Las especies seleccionadas fueron: cañota (Sorghum halepense), cerreig (Echinochloa crusgalli), garranchuelo (Digitaria sanguinalis), almorejo gigante (Setaria faberii), gordolobo (Abutilon theophrasti), hierba talpera (Datura stramonium), mostaza (Brassica arvensis) y bledo (Amaranthus retroflexus). Otra serie de macetas se sembró con los siguientes cultivos, empleando de 1 a 4 especies por maceta: maíz (profundidad de siembra 3,7 cm), algo-

15

20

25

1 dón, soja, girasol, avena de Clinton, trigo, alubias Black
Valentine, arroz, sorgo, guisantes, lino y cacahuet (todos
ellos a 2,5 cm de profundidad), pepinos, coles, alfalfa,
5 cártamo, remolacha azucarera, tomates, espinacas, cebada
y pelosa azul de Kentucky (todos ellos a 1,2 cm de profun-
didad). Inmediatamente después de la siembra, se aplicó
a la superficie del terreno el producto químico a ensayar,
disuelto en un disolvente no fitotóxico. Una maceta de la
fase de malas hierbas y otra maceta de cada una de las espe-
10 cies cultivables se dejaron sin tratamiento con fines com-
parativos. Las macetas tratadas y no tratadas se regaron rá-
pidamente con unos 4 mm de lluvia simulada y después se man-
tuvieron en un invernadero durante varias semanas. Las cla-
sificaciones visuales de las respuestas de las malas hier-
15 bas y de los cultivos se realizaron 28 días después del tra-
tamiento, utilizando el sistema de clasificación descrito
antes para el procedimiento de ensayo A. Los datos se encuen-
tran en la Tabla XV.

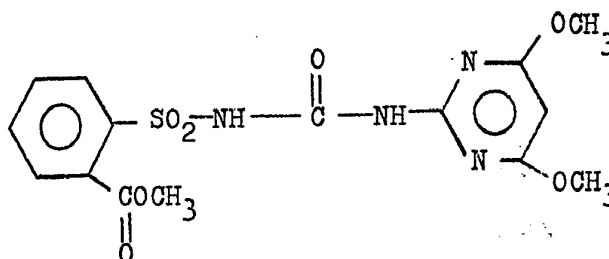


1

TABLA XV

Pre-emergencia sobre el terreno

5



	<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>	<u>1/8</u>
	Maíz	-	-	-	10C
10	Algodón	-	-	-	9G, 9C
	Soja	-	-	-	9G, 9H
	Cacahuet	-	-	-	10E
	Girasol	-	-	-	8G, 7C
	Avena	-	-	-	8G, 9C
15	Trigo	-	-	-	10C
	Sorgo	-	-	-	10C
	Remolacha azuca- rera	-	-	-	10C
	Guisantes	-	-	-	10C
20	Lino	-	-	-	10E
	Alfalfa	-	-	-	10C
	Alubias	-	-	-	7G, 8H
	Espinacas	-	-	-	10C
	Coles	-	-	-	10C
25	Tomates	-	-	-	8G, 8C
	Arroz	-	-	-	10E

1

TABLA XV (continuación)

kg/Ha	1/64	1/32	1/16	1/8
Cártamo	-	-	-	9G,9C
Pepinos	-	-	-	8G,7C
5 Pelosa azul Ky.	-	-	-	10C
Cebada	-	-	-	9G,8C
Tabaco	-	-	-	5G,2C
Hoja ancha	7G,5C	8G,8C	9G,8C	-
Herbáceas	6G	8G,6C	8G,8C	-

10

ENSAYO E

15

20

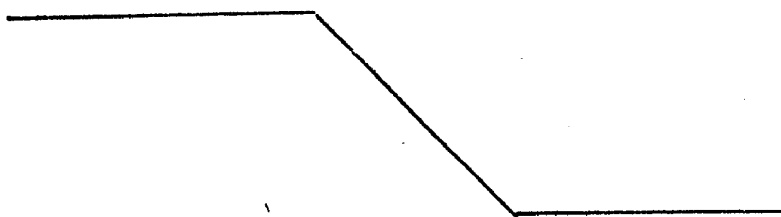
25

Este ensayo en invernadero pone de manifiesto la utilidad de ciertos compuestos de esta invención para el control de pre- y post-emergencia de las malas hierbas de hoja ancha y de la juncia en sembrados de trigo y cebada jóvenes. Los recipientes utilizados eran macetas de plástico de 25 cm de diámetro llenas de tierra arcillosa de Fallsington fertilizada y calcificada. Se realizaron dos siembras de las siguientes especies de malas hierbas, a intervalos de 10 días: mostaza (Brassica arvensis), cadillo (Xanthium esp.), ipomea (Ipomoea hederacea), casia (Cassia tora), gordolobo (Abutilon theophrasti), alfalfa (utilizada como especie indicadora), ciprés de verano (Kochia scoparia), sesbania (Sesbania exaltata), cardo ruso (Salsola kali), hierba talpera (Datura stramonium), y juncia (Cyperus rotundus). Además, se sembraron trigo y cebada en

1 macetas de plástico diferentes, de 15 cm de diámetro, lle-
nas de la misma tierra, solamente en el momento de la pri-
mera siembra. Todos los sembrados se trataron con los pro-
ductos químicos de ensayo disueltos en un disolvente no fi-
5 totóxico inmediatamente después de completada la segunda
operación de siembra. En este momento, la altura del trigo
era alrededor de 15-17,5 cm y la de la cebada de 12,5 a
15 cm, encontrándose ambos en la fase de crecimiento de la
segunda hoja. Las especies de malas hierbas de las primera
10 siembra eran de 2,5 a 12,5 cm de altura. Las proporciones
de aplicación seleccionadas fueron 0,004, 0,007, 0,015 y
0,030 kg/Ha para la fase de malas hierbas y 0,12, 0,25 y
0,50 kg/Ha para el trigo y la cebada. La respuesta de la
planta en la parte de post-emergencia de este ensayo fué
15 clasificada visualmente 21 días después del tratamiento y
la de la parte de pre-emergencia 28 días después del tra-
tamiento. El sistema de clasificación utilizado fué el des-
crito para el procedimiento de ensayo A. Los datos obteni-
dos se encuentran en la Tabla XVI.

20

25

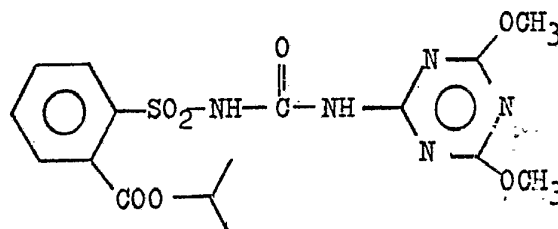


1

TABLA XVI

Pre-emergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



	<u>kg/Ha</u>	<u>1/256</u>	<u>1/128</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>
10	Mostaza	9G,9C	10C	10C	10C
	Cadillo	7G,7H	8G,8H	8G,8H	8G,9H
	Ipomea	8G,7C	8G,7C	8G,7C	8G,9C
	Casia	8G,5C	8G,5C	8G,5C	8G,8C
	Gordolobo	8G,3H	8G,3H	8G,5H	9G,5H
15	Alfalfa	5G	5G,2C	5G	8G,7C
	Sesbania	7G,3C	8G,9C	8G,9C	9G,9C
	Ciprés de verano	9G,9C	10C	10C	10C
	Cardo ruso	5C	7C	7C	9C
	Hierba talpera	7G,2C	8G,7C	8G,9C	8G,9C
20	Juncia	7G	8G	9G	10E

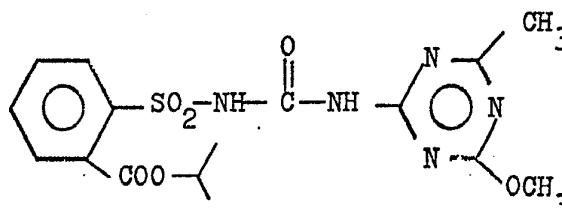
25

1

TABLA XVI (continuación)

Pre-emergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5

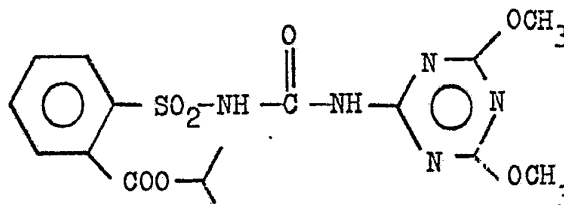


kg/Ha	1/256	1/128	1/64	1/32
Mostaza	10C	10C	10C	10C
10 Cadillo	8G, 8C	8G, 8H	8G, 8H	8G, 9H
Ipomea	8G, 6C	9G, 9C	10C	10C
Casia	8G, 5C	8G, 5C	8G, 9C	8G, 8C
Gordolobo	9G, 8C	9G, 9C	10C	10C
Alfalfa	7G	7G, 2C	9G, 8C	9G, 7C
15 Sesbania	7G, 3C	7G, 5C	8G, 8C	10C
Ciprés de verano	9G, 9C	10C	10C	10C
Cardo ruso	7C	8C	10C	10C
Hierba talpera	7G, 6C	7G, 5C	8G, 9C	8G, 7C
20 Juncia	6G, 3C	7G, 2C	8G	8G

25

TABLA XVI (continuación)

Post-emergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallington



	kg/Ha	1/256	1/128	1/64	1/32
	Mostaza				
10	Cadillo	10C	10C	10C	10C
	Ipomea	10C	10C	10C	10C
	Casia	9C	10C	10C	10C
	Gordolobo	-	10C	10C	-
	Alfalfa	5G	10C	10C	10C
15	Sesbania	10C	10C	10C	10C
	Ciprés de verano	-	-	10C	-
	Cardo ruso	8C	10C	10C	10C
	Hierba talpera	7G,5C	10G,5C	10G,7C	10G,6C
	Juncia	7G,3C	10G,8C	10G,5C	10G
20	kg/Ha	1/8	1/4	1/2	
	Trigo	2G	2G,2C	6G,3C	
	Cebada	0	6G,2C	8G,3C	

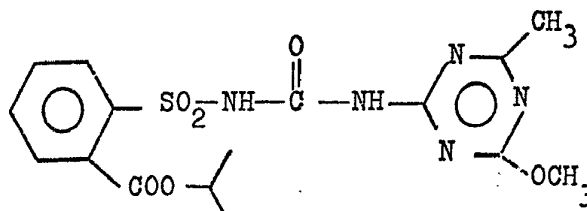
25

1

TABLA XVI (continuación)

Post-emergencia sobre tierra arcillosa de aluvión de Fallsington

5



	<u>kg/Ha</u>	<u>1/256</u>	<u>1/128</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>
	Mostaza				
10	Cadillo	10C	10C	10C	10C
	Ipomea	10C	10C	10C	10C
	Casia	10C	9C	10C	10C
	Gordolobo	-	10C	-	-
	Alfalfa	10C	10C	10C	10C
15	Sesbania	10C	10C	10C	10C
	Ciprés de verano	10C	-	10C	-
	Cardo ruso	10C	10C	10C	10C
	Hierba talpera	10G,4C	10G,8C	10G,8C	10G,9C
	Juncia	3G	5G,3C	10G,7C	10C
20	<u>kg/Ha</u>	<u>1/8</u>	<u>1/4</u>	<u>1/2</u>	
	Trigo	0	0	5G,3C	
	Cebada	5G	5G,2C	7G,3C	

ENSAYO F

25

Varios compuestos de esta invención son muy activos contra la juncia, como resulta evidente en el siguiente

1 ensayo.

Unos tubérculos de juncia púrpura (Cyperus rotundus) se sembraron a unos 2 cm de profundidad en tierra arcillosa de aluvión de Fallsington en macetas de plástico de 10 cm de diámetro. Se sembraron 5 tubérculos en cada maceta. Los compuestos de esta invención se pulverizaron disueltos en un disolvente no fitotóxico a una proporción de 560 litros/Ha, siguiendo cuatro métodos diferentes de tratamiento, es decir, pulverización de la superficie de la tierra, pulverización de los tubérculos y de la tierra, solución incorporada a la tierra y post-emergencia. Para la pulverización de la superficie de la tierra, los compuestos se pulverizaron sobre la superficie apisonada inmediatamente después de la siembra. Para la pulverización de los tubérculos y de la tierra, los compuestos se pulverizaron sobre los tubérculos expuestos y sobre la tierra situada debajo de ellos, antes de cubrir con tierra no tratada. En los tratamientos de incorporación a la tierra, los compuestos se mezclaron con la tierra utilizada para cubrir. En los tratamientos de post-emergencia, los compuestos se pulverizaron sobre el follaje de la juncia y sobre la superficie del terreno circundante después de que la juncia había emergido y había alcanzado una altura de unos 12 cm.

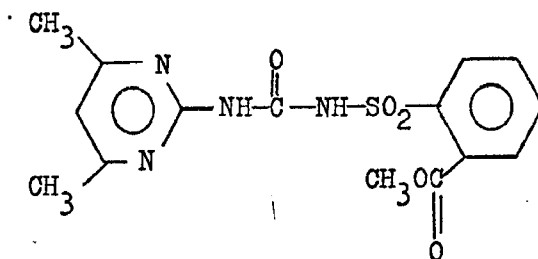
25 Inmediatamente después de realizar la pulverización

1 de la superficie, la pulverización de los tubérculos y
de la tierra y los tratamientos de incorporación a la
tierra, las macetas se nebulizaron con unos 0,3 cm de
5 agua durante un periodo de 90 minutos y después se intro-
dujeron en un invernadero. Las macetas que habían reci-
bido los tratamientos de post-emergencia se colocaron
directamente en el invernadero y se regaron cuidadosamen-
te de manera que el tratamiento no fuera eliminado del
follaje.

10 La siguiente Tabla XVII contiene los resultados obser-
vados 4 semanas después del tratamiento de la juncia con
los compuestos de esta invención.

TABLA XVII

Ensayos con juncia



20

Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

<u>kg/Ha</u>	<u>Superficie de la tierra</u>	<u>Tubér- culos</u>	<u>Incorporación a la tierra</u>	<u>Post-emergencia</u>
0,004	8E,9G	10E	10E	4G,7G
0,008	10E	10E	10E	9C
0,016	10E	10E	10E	9C
0,032	10E	10E	10E	10C
0,064	10E	10E	10E	10C

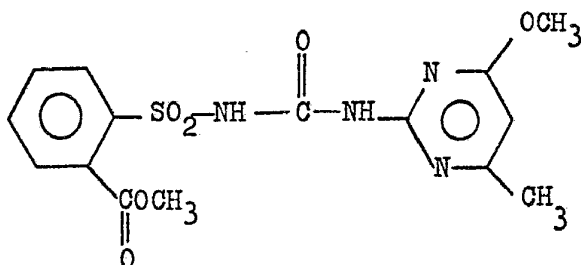
25

1

TABLA XVII (continuación)

Ensayos con juncia

5



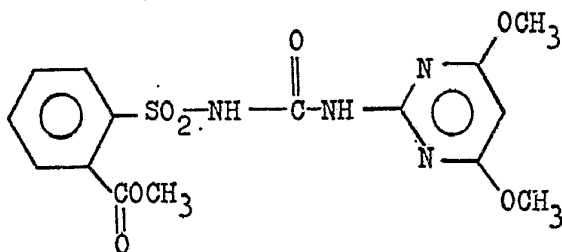
10

Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

<u>kg/Ha</u>	<u>Superficie de la tierra</u>	<u>Tubérculos</u>	<u>Incorporación a la tierra</u>	<u>Post-emergencia</u>
0,004	8E,9G	10E	10E	5C,7G
0,008	10E	10E	10E	9C
0,016	10E	10E	10E	9C
0,032	10E	10E	10E	10C
0,064	10E	10E	10E	10C

15

20



25

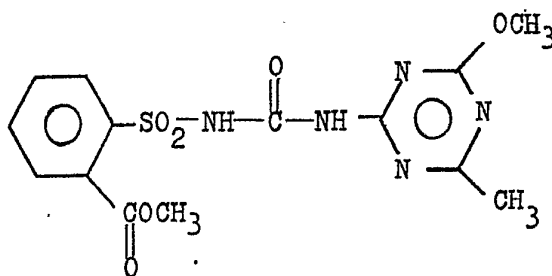
0,004	9E,9G	8E,9G	8E,9G	8C
0,008	10E	10E	10E	10C
0,016	10E	10E	10E	10C
0,032	10E	10E	10E	9C
0,064	10E	10E	10E	10C

1

TABLA XVII (continuación)

Ensayos con juncia

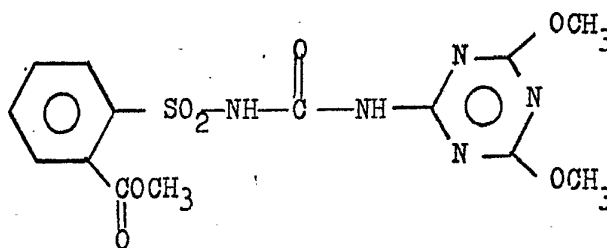
5



Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

	<u>kg/Ha</u>	<u>Superficie de la tierra</u>	<u>Tubérculos</u>	<u>Incorporación a la tierra</u>	<u>Post-emergencia</u>
10	0,004	4C,7G	5C,8G	5C,8G	0
	0,008	4C,7G	5C,8G	5C,8G	2G
	0,016	4C,7G	5C,9G	5C,8G	2G
	0,032	5C,8G	5C,9G	5C,9G	2C,5G
15	0,064	5C,8G	5C,9G	6C,9G	5C,7G

15



20

	0,004	3C,6G	3C,7G	3C,7G	0
	0,008	4C,8G	4C,8G	4C,8G	0
	0,016	-	4C,8G	4C,8G	2C,3G
	0,032	4C,8G	4C,8G	4C,8G	3G
25	0,064	5C,8G	-	4C,8G	3C,4G

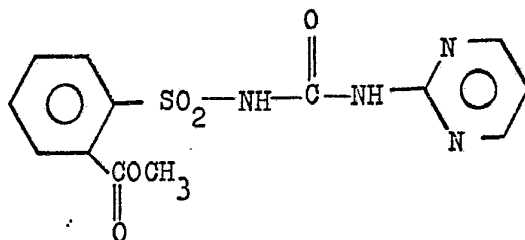
25

1

TABLA XVII (contin uación)

Ensayos con juncia

5

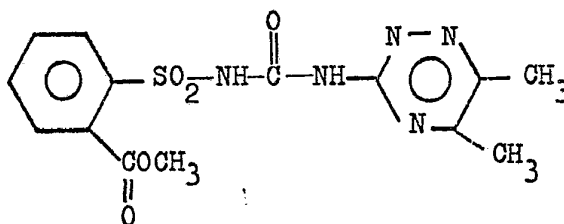


Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

10

<u>kg/Ha</u>	<u>Superfi- cie de la tierra</u>	<u>Tubérculos</u>	<u>Incorporación a la tierra</u>	<u>Post-emergencia</u>
0,032	0	2G	0	0
0,125	2E, 7G	4E, 8G	8E, 9G	9C
0,5	10E	10E	10E	10E

15



20

0,032	2G	2G	3G	0
0,125	10E	4E, 8G	8E, 8G	9C
0,5	10E	10E	10E	10C

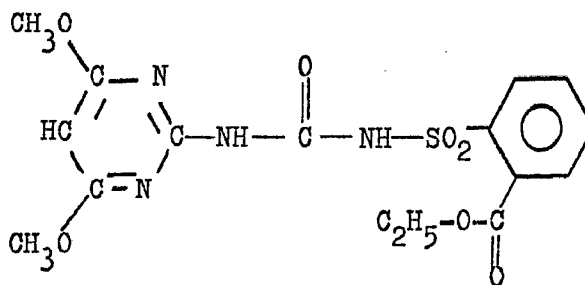
25

1

TABLA XVII (continuación)

Ensayos con juncia

5

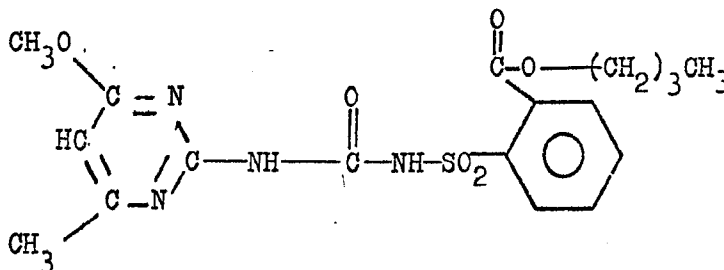


10

Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

kg/Ha	Superficie			
	de la tierra	Tubérculos	Incorporación a la tierra	Post-emergencia
0,008	10E	10E	10E	10C
0,032	10E	10E	10E	10C
0,125	10E	10E	10E	10C
0,25	10E	10E	10E	10C

15



20

0,008	2C, 4G	3C, 7G	3C, 8G	5C, 7G
0,032	3C, 6G	3C, 7G	3C, 7G	3C, 6G
0,125	2C, 8G	3C, 8G	5E, 9G	8C
0,5	2C, 8G	5E, 9G	5E, 9G	5C, 6G

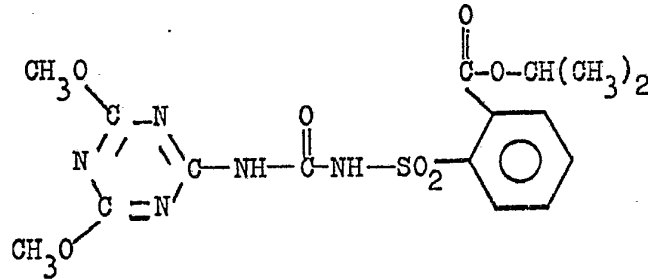
25

1

TABLA XVII (continuación)

Ensayos con juncia

5



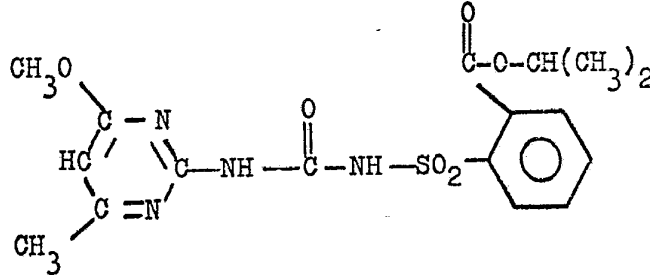
10

Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

kg/Ha	Superficie de la tierra			
	Tubérculos	Incorporación a la tierra	Post-emergencia	
0,004	8G	7G	8G	8C
0,008	8G	8G	8G	9C
0,016	8E,9G	6E,9G	8E,9G	9C
0,032	5E,9G	8E,9G	10E	10C

15

20



0,008	10E	10E	9E,9G	10C
0,032	10E	10E	10E	10C
0,125	10E	10E	10E	10C
0,25	10E	10E	10E	10C

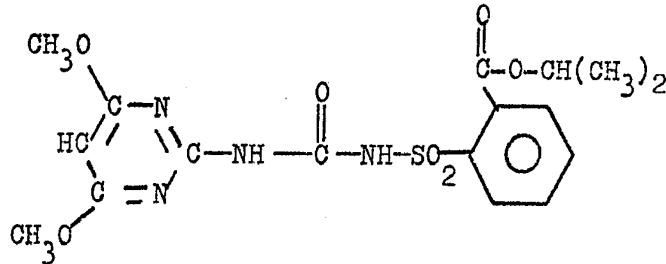
25

1

TABLA XVII (continuación)

Ensayos con juncia

5



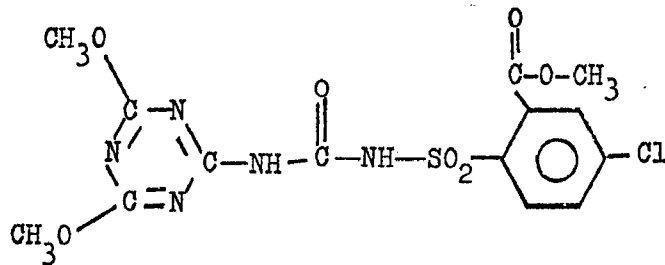
10

Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

kg/Ha	<u>Superficie</u>			
	<u>de la tierra</u>	<u>Tubérculos</u>	<u>Incorporación a la tierra</u>	<u>Post-emergencia</u>
0,008	10E	10E	10E	10C
0,032	10E	10E	10E	10C
0,125	10E	10E	10E	10C
0,25	10E	10E	10E	10C

15

20



0,008	3G	4G	5G	3G
0,032	7G	7G	7G	5C, 6G
0,125	9G	9G	9G	10C

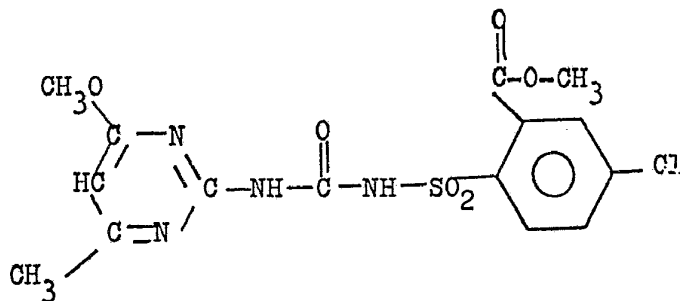
25

1

TABLA XVII (continuación)

Ensayos con juncia

5

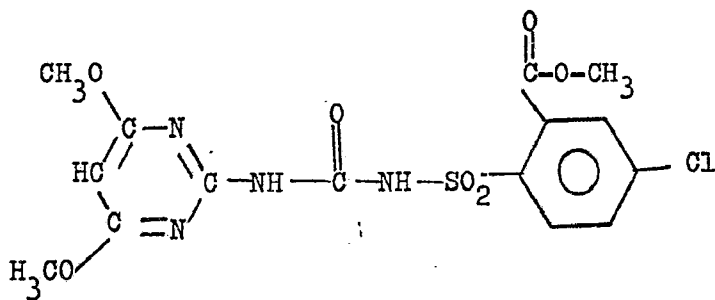


10

Clasificación de la respuesta al cabo de 4 semanas

kg/Ha	Superficie de la tierra			
	Tubérculos	Incorporación a la tierra	Post-emergencia	
0,008	2C,5G	7G	7G	2C,5G
0,032	9G	10E	8E,9G	9C
0,125	10E	10E	10E	9C

15



20

0,008	8E,9C	10E	10E	10C
0,032	10E	10E	10E	10C
0,125	10E	10E	10E	10C

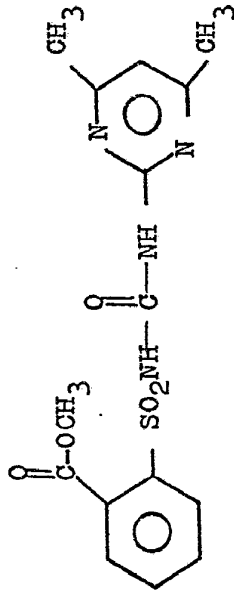
25

ENSAYO G

Unos tubérculos de juncia púrpura (Cyperus rotundus, L.) se sembraron a unos 2 cm de profundidad en tierra arcillosa de aluvión de Fallsington (alrededor de 1 % de materia orgánica de Delaware) y en tierra arcillosa de Flanagan (alrededor de 4 % de materia orgánica) de Illinois. Se sembraron 5 tubérculos en cada maceta de plástico de 10 cm de diámetro. Los tratamientos registrados en la Tabla XVII se aplicaron por tres métodos diferentes, a saber: pulverización de la superficie del terreno, pulverización de los tubérculos y la tierra e incorporación al terreno. En las pulverizaciones de la superficie, el material se pulverizó sobre la tierra aplastada después de la siembra pero antes de la emergencia de la juncia. En las pulverizaciones de los 10 tubérculos y la tierra, el material se pulverizó sobre los 15 tubérculos expuestos y sobre la tierra situada debajo de los mismos antes de cubrir los tubérculos con tierra sin tratar. En la incorporación a la tierra, el material se mezcló con la tierra utilizada para cubrir.

20 Inmediatamente después del tratamiento, las macetas tratadas se nebulizaron con unos 0,3 cm de agua a lo largo de un periodo de 90 minutos y se introdujeron en el invernadero. El alto grado de actividad de estos compuestos sobre la juncia se pone de manifiesto por las clasificaciones 25 obtenidas al cabo de 4 semanas y registradas en la Tabla XVIII.

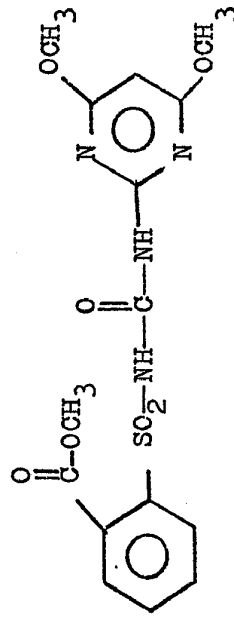
TABLA XVIII



Clasificación de la respuesta de la juncia al cabo de 4 semanas

kg/Ha	<u>Pulverización de la superficie</u>		<u>Pulverización de tubérculos/tierra</u>		<u>Incorporación a la tierra</u>	
	<u>Bajo OM</u>	<u>Alto OM</u>	<u>Bajo OM</u>	<u>Alto OM</u>	<u>Bajo OM</u>	<u>Alto OM</u>
0,008	10E	4C, 7G	10E	7E, 9G	10E	9E, 9G
0,016	10E	8E, 8G	10E	10E	10E	8E, 9G
0,032	10E	9E, 9G	10E	10E	10E	10E

TABLA XVIII (continuación)



kg/Ha	Pulverización de la superficie		Pulverización de tubérculos/tierra		Incorporación a la tierra	
	Bajo OM	Alto OM	Bajo OM	Alto OM	Bajo OM	Alto OM
0,008	5C, 8G	0	9E, 9G	5E, 7G	8E, 9C	2C, 3G
0,016	9E, 9G	2C, 4G	10E	10E	9E, 9C	3C, 3G
0,032	10E	10C	10E	9E, 10C	10C	7E, 3C, 8G

1

ENSAYO H

Dos bandejas de plástico de 10" (25 cm) de diámetro, forradas de polietileno, se llenan de tierra arcillosa de aluvión de Fallsington preparada. Una bandeja se siembra con semillas de trigo (Triticum aestivum), cebada (Hordeum vulgare), avena loca (Avena fatua), bromo veloso (Bromus tectorum), bromo (Bromus secalinus), aliso (Alopecurus myosuroides), pelosa azul anual (Poa annua), almorejo verde (Setaria viridis), grama del Norte (Agropyron repens), ray-gras italiano (Lolium multiflorum), y bromo rígido (Bromus rigidus). La otra bandeja se siembra con semillas de polígono trepador (Polygonum convolvulus), ciprés de verano (Kochia scoparia), polígono de Pensilvania (Polygonum pennsylvanicum), falsa manzanilla (Matricaria inodora), mostaza Jimhill (Sisymbrium altissium), mostaza silvestre (Brassica kaber), tanaceto (Descurainia pinnata), bleado (Amaranthus retroflexus) y cardo ruso (Salsola kali). Las dos bandejas anteriores se someten a un tratamiento de pre-emergencia. Al mismo tiempo, se someten a tratamiento de post-emergencia dos bandejas en las que están creciendo las especies citadas. La altura de la planta en el momento del tratamiento oscila entre 1 y 15 cm, según la especie.

5

10

15

20

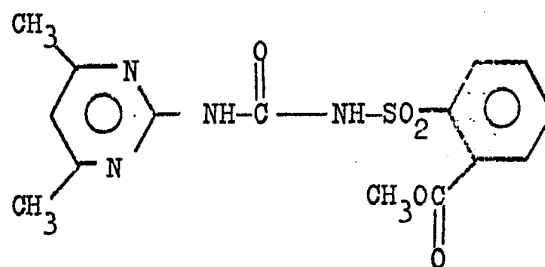
25

Los compuestos aplicados se diluyeron con un disolvente no fitotóxico y se pulverizaron sobre la parte superior de las bandejas. Con fines comparativos se incluyeron

1 un control no tratado y un control con disolvente solo.
 Todas las macetas se mantuvieron en el invernadero durante
 20 días, al cabo de los cuales se compararon las macetas
 tratadas con los controles y se clasificaron visualmente
 5 los efectos. Los datos registrados se encuentran en la
 Tabla XIX. También aquí es evidente la utilidad potencial
 de algunos compuestos ensayados para el control de las ma-
 las hierbas en el trigo y la cebada.

TABLA XIX

10



15

<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/8</u>
<u>Pre-emergencia</u>		
Trigo	9E, 9G	9E, 9G
Cebada	7H, 8G	8H, 8G
20 Avena loca	4H, 7G	7H, 8G
Bromo velloso	9E, 9G	10E
Bromo	7G, 8G	9E, 9G
Aliso	5H, 8G	8H, 9G
Pelosa azul anual	5C, 7G	7C, 8G
25 Almorejo verde	8C, 8G	8C, 9G

1

TABLA XIX (continuación)

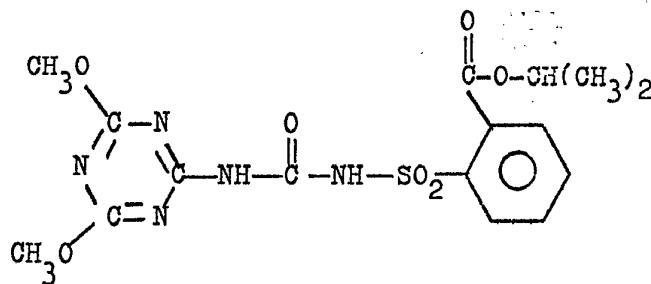
	<u>kg/Ha</u>	<u>1/16</u>	<u>1/8</u>
	Gramma del Norte	5H, 7G	7H, 8G
	Ray-gras italiano	6H, 7G	8H, 8G
5	Bromo rígido	8C, 9G	10C
	Polígono trepador	4C, 7G	5C, 8G
	Ciprés de verano	9C, 9G	9C, 9G
	Polígono de Pensilvania	7C, 8G	9C, 9G
	Falsa manzanilla	9C, 9G	9C, 9G
10	Mostaza Jimhill	10C	10C
	Mostaza silvestre	8C, 8G	9C, 9G
	Tanaceto	10C	10C
	Bledo	8C, 9G	10C
	Cardo ruso	7C, 7G	8C, 8G
15	<u>Post-emergencia</u>		
	Trigo	9C	10C
	Cebada	9C	10C
	Avena loca	9C	10C
	Bromo velloso	10C	10C
20	Bromo	10C	10C
	Aliso	10C	10C
	Peñosa azul anual	10C	10C
	Almorejo verde	10C	10C
	Gramma del Norte	10C	10C
25	Ray-gras italiano	10C	10C

1

TABLA XIX (continuación)

<u>Post-emergencia</u>	<u>1/16</u>	<u>1/8</u>
Bromo rígido	10C	10C
Polígono trepador	10C	10C
5 Ciprés de verano	10C	10C
Polígono de Pensilvania	10C	10C
Falsa manzanilla	10C	10C
Mostaza Jimhill	10C	10C
Mostaza silvestre	10C	10C
10 Tanaceto	10C	10C
Bledo	10C	10C
Cardo ruso	10C	10C

15



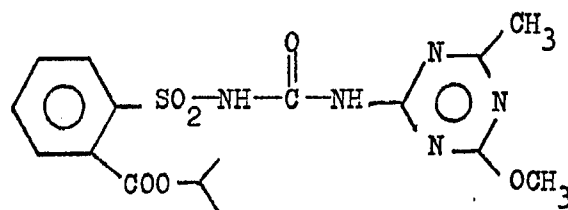
20

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
<u>Pre-emergencia</u>			
Trigo	0	0	0
Cebada	0	0	0
Avena loca	0	0	0
Bromo velloso	0	0	1G
25 Bromo	0	0	1G

		TABLA XIX (continuación)		
	kg/Ha	1/64	1/32	1/16
	Aliso	0	0	2G
	Pelosa azul anual	0	0	1G
5	Almorejo verde	0	0	1G
	Gramma del Norte	0	0	0
	Ray-gras italiano	0	0	0
	Bromo rígido	0	0	0
	Polígono trepador	3C,5G	7C,8G	7C,8G
10	Ciprés de verano	5C,7G	7C,8G	9C
	Polígono de Pensilvania	4C,7G	10C	10C
	Falsa manzanilla	9G	9G	9G
	Mostaza Jimhill	10C	10C	10C
	Mostaza silvestre	10C	10C	10C
15	Tanaceto	7C,9G	10C	10C
	Bledo	7G	5C,8G	10C
	Cardo ruso	3G	4G	7C,5G
	<u>Post-emergencia</u>			
	Trigo	0	0	1C
20	Cebada	0	0	0
	Avena loca	0	0	1C
	Bromo velloso	0	0	0
	Bromo	0	0	0
	Aliso	0	0	0
25	Pelosa azul anual	0	0	2G

1 TABLA XIX (continuación)

<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
Almorejo verde	1C	1C	2C, 3G
Gramma del Norte	0	0	0
5 Ray-gras italiano	0	0	0
Bromo rígido	0	0	0
Polígono trepador	9C	10C	10C
Ciprés de verano	10C	10C	10C
Polígono de Pensilvania	9C	9C	10C
10 Falsa manzanilla	10C	10C	10C
Mostaza Jimhill	10C	10C	10C
Mostaza silvestre	10C	10C	10C
Tanaceto	10C	10C	10C
Bledo	9C	10C	10C
15 Cardo ruso	9C	10C	10C



<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
<u>Pre-emergencia</u>			
Trigo	0	0	0
Cebada	0	1G	1G
25 Avena loca	0	2G	3G

1

TABLA XIX (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
	Bromo velloso	1G	3G	5G
	Bromo	1C, 2G	1C, 3G	2C, 4G
5	Aliso	2G	3G	4G
	Pelosa azul anual	2G	3G	5G
	Almorejo verde	0	0	1G
	Gramma del Norte	0	0	2G
	Ray-gras italiano	0	2G	3G
10	Bromo rígido	0	0	0
	Polígono trepador	9C	9C	10C
	Ciprés de verano	9C	10C	10C
	Polígono de Pensilvania	9C	10C	10C
	Falsa manzanilla	9G	9G	10C
15	Mostaza Jimhill	10C	10C	10C
	Mostaza silvestre	10C	10C	10C
	Tanaceto	10C	10C	10C
	Bledo	8C	9C	10C
	Cardo ruso	3C, 5G	7C, 7G	8C, 8G
20	<u>Post-emergencia</u>			
	Trigo	0	0	1C
	Cebada	0	0	0
	Avena loca	0	0	2C
	Bromo velloso	0	0	2G
25	Bromo	0	0	1C, 2G

1 TABLA XIX (continuación)

	<u>kg/Ha</u>	<u>1/64</u>	<u>1/32</u>	<u>1/16</u>
	Aliso	0	0	2G
	Pelosa azul anual	0	0	3G
5	Almorejo verde	0	1C	3C
	Gramma del Norte	0	0	1G
	Ray-gras italiano	0	0	2G
	Bromo rígido	0	0	0
	Polígono trepador	10C	10C	10C
10	Ciprés de verano	10C	10C	10C
	Polígono de Pensilvania	10C	10C	10C
	Falsa manzanilla	10C	10C	10C
	Mostaza Jimhill	10C	10C	10C
	Mostaza silvestre	10C	10C	10C
15	Tanaceto	10C	10C	10C
	Bledo	10C	10C	10C
	Cardo ruso	10C	10C	10C

ENSAYO I

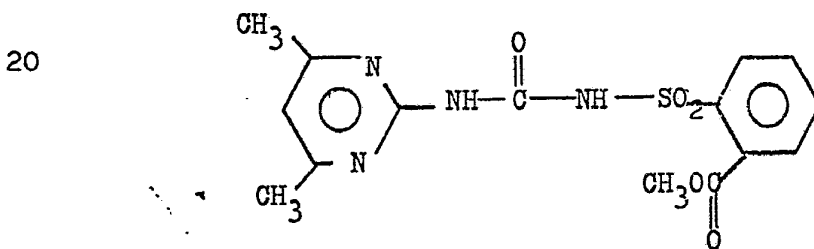
20 Unas macetas de plástico de 5" (12,7 cm) de diámetro se llenan con una mezcla 50/50 de tierra arcillosa de aluvi6n de Fallsington y arena y se siembran las siguientes semillas (una especie de planta por maceta): ven-
 25 ceto6sigo (Morrenia odorata), llant6n (Plantago esp.), bardana (Arctium minus), corre6iela (Convolvulus arvensis),
 diente de le6n (Taraxacum officinale), hierba mora

1 (Solanum carolinense), grama de España (Cynodon dactylon),
grama del Norte (Agropyron repens), grama (Paspalum dilatatum)
y cañota (Sorghum halepense). Las macetas se colocan en el
5 invernadero y las plantas se dejan crecer durante varias
semanas.

El compuesto evaluado se diluye con un disolvente no
fitotóxico y se pulveriza sobre el follaje de la planta.
Se incluyen con fines comparativos controles sin tratar y
tratados con disolvente. Una y ocho semanas después del tra-
10 tamiento se realiza la clasificación visual de los efectos
del compuesto sobre el crecimiento de la planta. Estas cla-
sificaciones están presentadas en la Tabla XX. Los datos in-
dicar la elevada actividad del compuesto de ensayo para el
control de las malas hierbas perennes establecidas de hoja
15 ancha y herbáceas.

TABLA XX

Ensayo de malas hierbas perennes de hoja ancha y herbáceas



25

1

TABLA XX (continuación)

Clasificaciones de la respuesta de las plantas				
Especie	1 semana		8 semanas	
	1,8 kg/Ha	1/4 kg/Ha	1/8 kg/Ha	1/4 kg/Ha
5 Vencetósigo	0	0	10C	10C
Llantén	0	0	10C	10C
Bardana	0	0	4C	10C
Corregüela	0	2C	7C	8C
Diente de león	0	0	10C	10C
10 Hierba mora	0	1C	5C	10C
Gramma de España	5C	6C	5C, 7G	6C, 8G
Gramma del Norte	6C	7C	10C	10C
Gramma	6C	6C	8C, 8G	10C
Cañota	8C	9C	10C	10C

15

ENSAYO J

20

La gran actividad herbicida de uno de los compuestos de esta invención fué confirmada en un ensayo en campo. El material se aplicó como tratamiento de pre-emergencia a una tierra arcillosa de aluvión. Tres días después del tratamiento, la zona se regó con 2,5 cm de agua. Cuatro semanas más tarde, se estimó el porcentaje de control para cada especie, como indica la Tabla XXI.

25



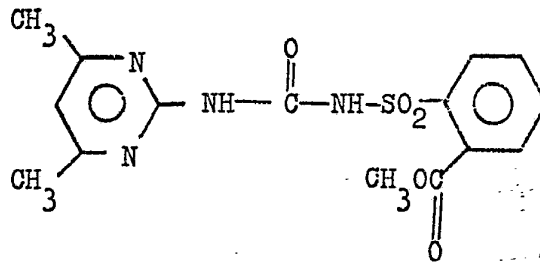
1

TABLA XXI

Tratamientos de pre-emergencia sobre cultivos y malas hierbas.

% de control

5



10

kg/ingrediente activo/Ha

15

20

25

	<u>Sin tra</u> <u>tamiento</u>	<u>0,031</u>	<u>0,063</u>	<u>0,125</u>	<u>0,25</u>
Garranchuelo	0	100	100	100	100
Almorejo	0	100	100	100	100
Juncia	0	98	100	100	100
Bledo	0	100	100	100	100
Ambrosía	0	100	100	100	100
Gordolobo	0	98	98	100	100
Cenizo	0	100	100	100	100
Verdolaga	0	100	100	100	100
Polígono de Pensil- vania	0	100	100	100	100
Cerreig	0	100	100	100	100
Ray-gras	0	100	100	100	100
Avena loca	0	98	100	100	100

1

TABLA XXI (continuación)

		kg/ingrediente activo/Ha				
		Sin trata miento	0,031	0,063	0,125	0,25
5	Espinacas	0	100	100	100	100
	Lino	0	90	100	100	100
	Endivias	0	100	100	100	100
	Coles	0	100	100	100	100
	Remolacha roja	0	100	100	100	100
10	Zanahorias	0	100	100	100	100
	Alubia de Lima	0	50	60	70	90
	Alubia de riñón	0	80	90	95	100
	Tomates	0	100	100	100	100
	Cacahuet	0	70	80	90	90
15	Patatas	0	90	90	100	100
	Pepinos	0	100	100	100	100
	Calabaza	0	100	100	100	100
	Remolacha azuca- rera	0	100	100	100	100
	Soja	0	90	95	98	98
20	Alfalfa	0	100	100	100	100
	Trébol	0	100	100	100	100
	Lespedeza	0	100	100	100	100
	Algodón	0	80	90	90	95
	Avena	0	100	100	100	100
25	Quimbombó	0	90	90	100	100

1

TABLA XXI (continuación)

		<u>kg/ingrediente activo/Ha</u>				
		<u>Sin trata-</u>	<u>0,031</u>	<u>0,063</u>	<u>0,125</u>	<u>0,25</u>
		<u>miento</u>				
5	Arroz	0	100	100	100	100
	Trigo	0	90	100	100	100
	Sorgo	0	100	100	100	100
	Maíz	0	100	100	100	100
	Girasol	0	70	90	95	100
10	Cártamo	0	100	100	100	100

ENSAYO K

10

15

20

La respuesta de diversas especies de malas hierbas nocivas a las aplicaciones de post-emergencia del mismo compuesto utilizado en el Ensayo J fué estudiada en otro ensayo en campo. En el momento del tratamiento, un mes después de la siega, la vegetación mixta tenía aproximadamente 15 cm de altura. El producto químico se aplicó en agua conteniendo 0,2 % del agente tensoactivo Surfactant WK^(R), a un volumen global de 500 litros/Ha. Cada tratamiento fué repetido tres veces. Cuatro días después del tratamiento se registraron aproximadamente 5 cm de lluvia y otros 37 cm adicionales cayeron antes de haber realizado la clasificación del control de las malas hierbas, 16 semanas después del tratamiento. Las cifras obtenidas se encuentran en la Tabla XXII.

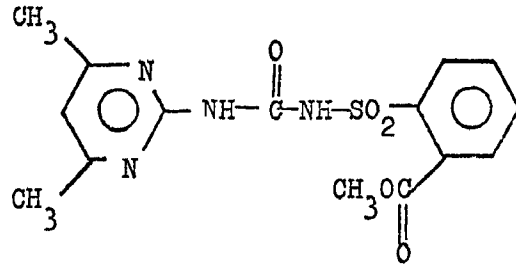
25

1

TABLA XXII

Ensayo de control de un amplio espectro de malas hierbas -
porcentaje medio de control

5



10

kg/Ha	Sin trata- miento	0,5	1,0	2,0
Global	0	81	90	94
Herbáceas	0	81	84	93
Hoja ancha	0	91	96	98
Púrpura	0	73	80	92
Retama	0	71	73	86
Varilla de oro	0	100	100	100
Zarzamora	0	97	100	100
Hiedra venenosa	0	67	85	95

15

Malas hierbas por pie² en el control sin tratar:

20

Púrpura	7
Retama	0,7
Varilla de oro	1,0
Zarzamora	0,5
Hiedra venenosa	1,0

25

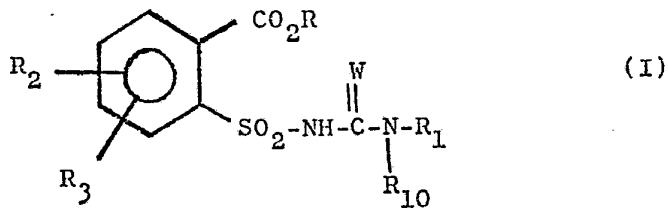
1

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

REIVINDICACIONES

5

1. Un procedimiento para la preparación de aril-sulfonamidas de fórmula:



10

donde R_{10} es hidrógeno o metilo y

15

R es alquilo C_1-C_{12} ; alqueno C_3-C_{10} ; alquilo C_2-C_6 sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados entre 0-3 átomos de F, Cl o Br y 0-2 grupos metoxi; alqueno C_3-C_6 sustituido con 1-3 átomos de F, Cl o Br; cicloalquilo C_5-C_8 ; cicloalqueno C_5-C_8 ; cicloalquilo C_5-C_6 sustituido con 1 a 4 de cualquiera de los sustituyentes metilo, metoxi,

20

alquilo C_2-C_4 , F, Cl o Br; cicloalquilalquilo C_4-C_{10} ; cicloalquilalquilo C_4-C_8 con 1-2 grupos CH_3 ; $-CH_2CH_2OR_7$; $-CH_2CH_2CH_2OR_7$; $-CH(CH_3)CH_2OR_7$, donde R_7 es $-CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, fenilo, $-CH_2CH_2Cl$ o $-CH_2CCl$; $-(CH_2CH_2O)_nR_8$,

25

1

$-(\text{CH}(\text{CH}_2\text{O})\text{CH}_2)_n-\text{R}_8$, donde R_8 es CH_3 , $-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$,
 CH_3

fenilo, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ o $-\text{CH}_2\text{CCl}_3$ y n' es 2 o 3;

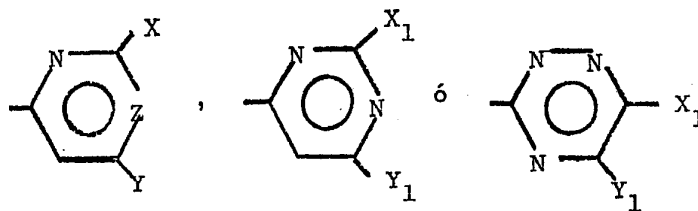
R_2 es H, Cl, Br, F, alquilo C_1-C_3 , $-\text{NO}_2$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{SCH}_3$,
 5 CF_3 , SO_2CH_3 , $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ o CN; Y

R_3 es H, Cl, Br o CH_3 ;

W es oxígeno o azufre y

R_1 es

10



donde

15

X es H, Cl, CH_3 , OCH_3 , OCH_2CH_3 u $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$;


Z es CH ó N;

Y es H; Cl; alquilo C_1-C_4 ; alquilo C_1-C_4 sustituido
 con $-\text{OCH}_3$, $-\text{OC}_2\text{H}_5$, 1 a 3 átomos de F, Cl o Br, CN,
 20 CO_2CH_3 o $\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$; alqueno C_3-C_4 ; $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CR}_{13}$, don-

donde R_{13} es H, $-\text{CH}_3$ o $-\text{CH}_2\text{Cl}$; $-\text{ACH}_2\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{L}$; $-\text{ACHC}\overset{\text{O}}{\parallel}-\text{L}$;
 CH_3

$-\text{ACH}_2\overset{\text{O}}{\parallel}\text{CH}_2-\text{L}$, donde L es $-\text{NH}_2$, $-\text{NCH}_3$, $-\text{NH}(\text{alquilo})$
 OCH_3

25

1 C₁-C₄), -N(alquilo C₁-C₄)₂ o alcoxi C₁-C₆; -SCN;
-N₃; -NR₁₆R₁₇, donde R₁₆ es H o CH₃ y R₁₇ es H;
-OCH₃; alquilo C₁-C₄; alquilo C₁-C₄ sustituido con
5 -CN, -CO₂CH₃, -CO₂C₂H₅ o alquilo C₂-C₃ sustituido
con -OCH₃ o -OC₂H₅; o alqueno C₃-C₄; o bien
R₁₆ y R₁₇ pueden estar unidos formando un grupo
-CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂OCH₂CH₂-; -O-R₁₄, donde
R₁₄ es alquilo C₁-C₄; alquilo C₂-C₄ sustituido
con 1-3 átomos de F, Cl o Br; alquilo C₁-C₄ sus-
10 tituido con ciano; alqueno C₃-C₄; -CH₂C≡CR₁₃,
donde R₁₃ es el definido anteriormente; -CH₂- ;
-SR₁₅, donde R₁₅ es alquilo C₁-C₄; alquilo C₁-C₂
sustituido con CN; alilo; propargilo; -A-(CH₂)_n-A₁-
(alquilo C₁-C₃), donde n', A y A₁ son los definidos
15 anteriormente; con la condición de que

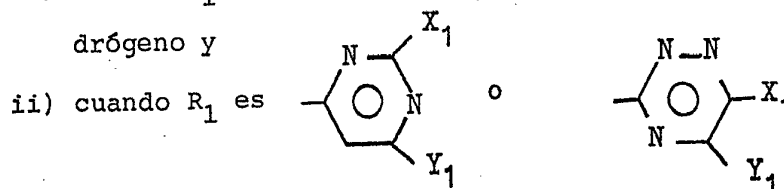
- i) cuando Y contiene 4 o más átomos de carbono,
entonces R contiene menos de 5 átomos de car-
bono,
- ii) cuando X es Cl, entonces Y es Cl y
- 20 iii) cuando X e Y son ambos H, entonces R contiene
menos de 5 átomos de carbono;

Y₁ es H, -OCH₃ o -CH₃; Y

X₁ es H, Cl, -OCH₃, -OCH₂C₂H₅ o -CH₃; con la condición
de que

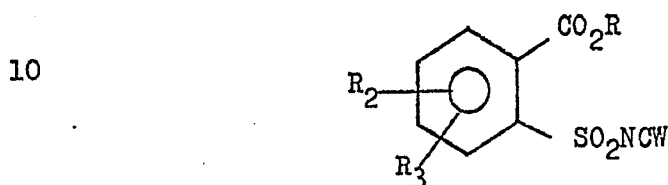
25

1 i) cuando X_1 es hidrógeno, Y_1 es distinto de hidrógeno y



5 entonces R_4 y R_5 son ambos H y R contiene menos de 6 átomos de carbono;

cuyo procedimiento consiste en hacer reaccionar un compuesto de fórmula:



con un compuesto de fórmula:

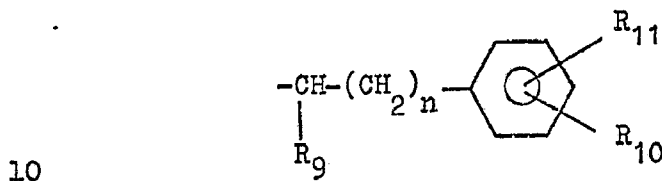


2. Un procedimiento según la reivindicación 1, donde R_{10} es H, W es O y el átomo de carbono de R del grupo CO_2R está también unido por lo menos a un átomo de hidrógeno.

20 3. Un procedimiento según la Reivindicación 2, donde R_2 es H, Cl, Br, F, alquilo C_1-C_3 , $-NO_2$, $-OCH_3$, $-SCH_3$, $-SO_2CH_3$, $-CF_3$, $-N(CH_3)_2$, $-NH_2$ o $-CN$ y R_3 es H y está en posición para respecto al grupo sulfonilo.

25 4. Un procedimiento según la Reivindicación 3, donde R es alquilo C_1-C_6 ; alquilo C_2-C_4 sustituido con

1 a 4 sustituyentes seleccionados entre 0-3 átomos de F o Cl, 0-2 grupos metoxi o 0-1 grupos ciano; alqueno C₂-C₆; alqueno C₃-C₄ sustituido con 1-3 átomos de Cl; -CH₂CN; cicloalquilo C₅-C₆; cicloalqueno C₅-C₆; cicloalquilo C₅-C₆ sustituido con uno cualquiera de 1 a 4 grupos metilo, metoxi, -C₂H₅ y Cl; cicloalquilalquilo C₄-C₇; o



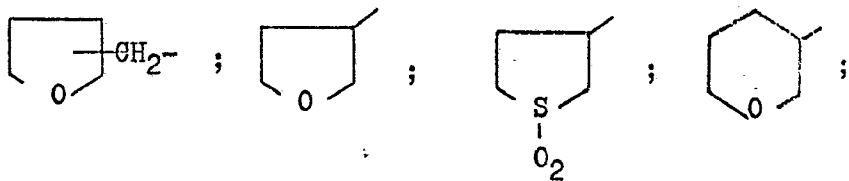
donde

R₉ es H o metilo,

n es 0 o 1 y

R₁₀ y R₁₁ son independientemente H, -CH₃, Cl, -OCH₃,

15



20



5. Un procedimiento según la Reivindicación 3,

donde R es H, M, -CH₂CH₂OR₇, -CH(CH₃)CH₂OR₇, -CH₂CH₂CH₂OR₇,

25

1
- (CH₂CH₂O)₂-R₈ o $\begin{array}{c} \text{-(CHCH}_2\text{O)}_2\text{-R}_8 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$, donde R₈ es alquilo C₁-C₃
o -CH₂CH₂Cl.

5
6. Un procedimiento según la Reivindicación 3,
donde:

X es CH₃, -OCH₃ o -OC₂H₅;

Y es H; alquilo C₁-C₄; alquilo C₁-C₂ sustituido con -OCH₃,
-OC₂H₅, -CN, -CO₂CH₃, -CO₂C₂H₅ o 1 a 3 átomos de F o Cl;

10 alqueno C₃-C₄; -OCH₂CO₂ (alquilo C₁-C₄); -OCHCO₂ (alquilo
 $\begin{array}{c} | \\ \text{CH}_3 \end{array}$

C₁-C₄); -OCH₂CH₂CO₂ (alquilo C₁-C₄); -NR₁₆R₁₇, donde
R₁₆ es H o CH₃ y

R₁₇ es alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ sustituido con -CN;

15 alquilo C₂-C₃ sustituido con -OCH₃ o -OC₂H₅; o alqueni-
lo C₃-C₄;

-OCH₂CH₂O- (alquilo C₁-C₃); -OCH₂CH₂CH₂O- (alquilo C₁-C₃);

-OR₁₄, donde R₁₄ es alquilo C₁-C₄; alquilo C₂-C₃ sustitui-
do con 1-3 átomos de F o Cl; alquilo C₁-C₃ sustituido con

20 CN o alqueno C₃-C₄; -SCH₃ o -SC₂H₅; y

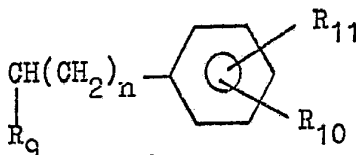
X₁ e Y₁ son los definidos anteriormente.

7. Un procedimiento según la Reivindicación 6,
donde R₂ es H, Cl o CH₃.

25 8. Un procedimiento según la Reivindicación 7,
donde

1 R es alquilo C₁-C₄; alqueno C₃-C₄; alquilo C₂-C₃ sustituido con -OCH₃, Cl, o CN; CH₂CN; alqueno C₃ sustituido con 1-3 átomos de Cl; cicloalquilo C₅-C₆; ciclohexenilo; ciclohexilo sustituido con 1-3 grupos metilo; o

5



donde

10

R_9 es H o CH_3 ,

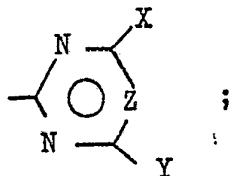
n es 0 o 1 y

R_{10} y R_{11} son independientemente H, CH_3 , OCH_3 o Cl.

9. Un procedimiento según la Reivindicación 7,

donde R_1 es .

15



20

Y es H, alquilo C₁-C₃, -CH₂OCH₃, -CH₂OCH₂CH₃, -OCH₂CO₂(alquilo C₁-C₂), -OCH(CH₃)-CO₂(alquilo C₁-C₂), -O(alquilo C₁-C₃) o -O(alque-

25

1 nilo C₃-C₄) o -NR₁₆R₁₇, donde
R₁₆ es H o CH₃ y
R₁₇ es alquilo C₁-C₃.

10. Un procedimiento según la Reivindicación 7,

5 donde

R es H, M, -CH₂CH₂OR₇ o -CHCH₂OC₂H₅, donde
|
CH₃

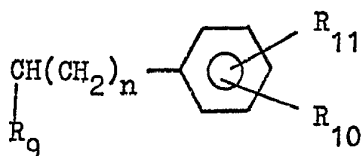
R₇ es -C₂H₅, -CH(CH₃)₂, fenilo o -CH₂CH₂Cl.

11. Un procedimiento según la Reivindicación 9,

10 donde

R es alquilo C₁-C₄; alqueno C₃-C₄; alquilo C₂-C₃ sustituido con -OCH₃, Cl o CN; -CH₂CN; alqueno C₃ sustituido con 1-3 átomos de Cl; cicloalquilo C₅-C₆; ciclohexenilo; ciclohexilo sustituido con 1-3 grupos metilo o

15



donde

R₉ es H o CH₃;

20

n es 0 o 1 y

R₁₀ y R₁₁ son independientemente H, CH₃, OCH₃ o Cl.

12. Un procedimiento según la Reivindicación 9,,

donde

25 R es H, M, -CH₂CH₂OR₇, -CHCH₂OC₂H₅, o -CH₂CH₂CH₂OC₂H₅, donde
|
CH₃

1 R_7 es $-C_2H_5$, $-CH(CH_3)_2$, fenilo o $-CH_2CH_2Cl$.

13. Un procedimiento según la Reivindicación 11,
donde R_2 y R_3 son ambos hidrógeno.

14. Un procedimiento según la Reivindicación 12,
5 donde R_2 y R_3 son ambos hidrógeno.

15. Un procedimiento según la Reivindicación 13,
donde

R es alquilo C_1-C_4 , alquilo C_2-C_3 sustituido con Cl., alque-
nilo C_3-C_4 , $-CH_2CH_2OCH_3$ o $-CHCH_2OCH_3$.

10



16. Un procedimiento según la Reivindicación 14, donde

R es $-CH_2CH_2OCH_2CH_3$, $-CHCH_2OCH_2CH_3$ o $-CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_3$.



15

17. Un procedimiento según la Reivindicación 13, donde
Y es alquilo C_1-C_3 , $-OCH_3$, $-OC_2H_5$, $-OCH_2CO_2CH_3$,

$-OCH_2CO_2CH_2CH_3$, $-OCHCO_2CH_3$, $-OCHCO_2C_2H_5$ o $-CH_2OCH_3$.



20

18. Un procedimiento según la Reivindicación 14, donde

Y es alquilo C_1-C_3 , $-OCH_3$, $-OC_2H_5$, $-OCH_2CO_2CH_3$, $-OCH_2CO_2CH_2CH_3$,

$-OCHCO_2CH_3$, $-OCHCO_2C_2H_5$ o $-CH_2OCH_3$.



19. Un procedimiento según la Reivindicación 17, donde

25

1 26. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[(4,6-dimetoxi-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-metoxicarbonilbenceno-
sulfonamida.

5 27. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[(4,6-dimetoxi-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(isopropoxicarbonil)-
bencenosulfonamida.

10 28. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[(4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(isopropoxicarbonil)-
bencenosulfonamida.

15 29. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[(4,6-dimetoxi-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)-
bencenosulfonamida.

20 30. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[(4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)-
bencenosulfonamida.

25 31. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[(4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-propoxicarbonilbenceno
sulfonamida.

32. Un procedimiento según la Reivindicación 1,

1 donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metoxi-6-metil-
pirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-cloroetoxicarbonil)-
bencenosulfonamida.

5 33. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-fenil-1-metiletoksi-
carbonil)bencenosulfonamida.

10 34. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-[2-(2-cloroetoxi)-
etoxicarbonil]bencenosulfonamida.

15 35. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-etoxietoxicarbonil)-
bencenosulfonamida.

20 36. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metoxi-6-metil-
1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-aliloxicarbonilbenceno-
sulfonamida.

20 37. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metil-6-(1-
metoxicarboniletoksi)pirimidin-2-il)aminocarbonil]-2-
metoxicarbonilbencenosulfonamida.

25 38. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metil-6-(1-

1 metoxicarboniletoxi)-1,3,5-triazin-2-il]aminocarbonil]-2-
metoxicarbonilbencenosulfonamida.

39. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4-metoxi-6-metil-
5 1,3,5-triazin-2-il)aminocarbonil]-2-(2-metilpropoxicarbo-
nil)bencenosulfonamida.

40. Un procedimiento según la Reivindicación 1,
donde el compuesto de fórmula (I) es N-[4,6-dimetoxipiri-
midin-2-il)aminocarbonil]-2-(aliloxicarbonil)bencenosul-
10 fonamida.

41. Se reivindica por último como objeto sobre
el que ha de recaer la Patente de Invención que se soli-
cita: "UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE ARILSUL-
FONAMIDAS".

15 Todo conforme queda descrito y reivindica en la
presente memoria descriptiva que consta de trescientas
seis páginas mecanografiadas.

Madrid, 29 de Mayo de 1979

20 BERNARDO UNGRIA
p.p.

25