Ref.: 6160

# DESCRIÇÃO

# DA

# PATENTE DE INVENÇÃO

**N.º** 96.645

REQUERENTE: UNIROYAL CHEMICAL LTD./UNIROYAL CHEMICAL LTEE, canadiana, com sede em 25 Erb Street, Elmira, Ontário N3B 3A3, Canadá e UNIROYAL CHEMICAL COMPANY INC., norte-americana, com sede em World Headquarters, Middlebury, Connecticut 06749, Estados Unidos da América

EPÍGRAFE: "Processo para a preparação de uracilos de éster cinâmico com actividade herbicida e de composições herbicidas que os contêm"

INVENTORES: Walter Gerhard Brouwer,
Ethel Ellen Felauer,
Allyn Roy Bell,

Reivindicação do direito de prioridade ao abrigo do artigo 4.º da Convenção de Paris de 20 de Março de 1883.

U.S.A., 2 de Fevereiro de 1990, sob o Nº.: 474,955

UNIROYAL CHEMICAL LTD./UNIROYAL CHEMICAL LTEE

"PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE URACILOS DE ÉSTER CINÂMICO COM ACTIVIDADE HERBICIDA E DE COMPOSIÇÕES HERBICIDAS QUE OS CONTÊM"

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

1. Domínio da invenção

A presente invenção diz respeito a novos derivados de éster cinâmico de 3-alquil-4-(trifluorometil)-uracilos que, inesperadamente, apresentam actividade herbicida selectiva desejada. Noutros aspectos, a presente invenção diz respeito a composições herbicidas que contêm esses compostos, bem como aos métodos para controlar o crescimento de plantas utilizando estes derivados de éster cinâmico. Ainda de acordo com um outro aspecto, a presente invenção diz respeito aos processos para a preparação destes compostos.

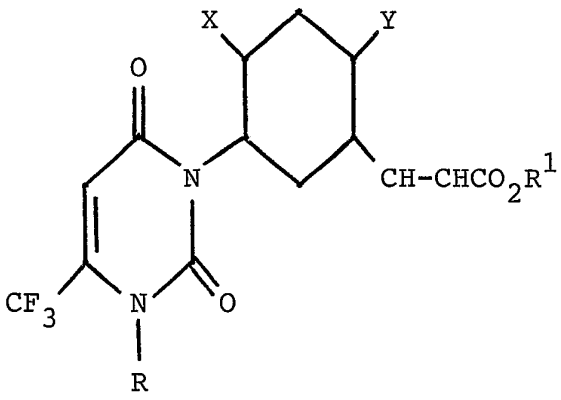
O controlo das ervas daninhas é essencial na cultura de importantes espécies agronómicas, tais como o milho, o amendoim e o algodão, bem como na cultura de muitas espécies hortículas. Além disso, a presença dessas ervas daninhas nas áreas não cultivadas pode apresentar o risco de incêndio ou pode provocar a acumulação indesejável de areia ou neve ou a irritação de pessoas com alergias. Nestas condições, o controlo das ervas daninhas será benéfico, particularmente se for um controlo selectivo dessas plantas sem simultaneamente prejudicar as culturas ou vegetação com interesse.

2. Descrição da técnica relacionada

Em Chemical Abstracts 107: 198078a (1987) descrevem-se alguns ésteres cinâmicos que são referidos como tendo actividade herbicida em pós-emergência contra uma série de dicotiledóneas. No entanto, o grupo éster cinâmico tem um radical isoindol na posição 5 do núcleo benzénico ao contrário do grupo uracilo contido nos compostos que são objecto da presente invenção.

SUMÁRIO DA INVENÇÃO

Num aspecto, a presente invenção refere-se a compostos de fórmula geral




(I)

na qual:

R representa um grupo alquilo $C_1$-$C_{12}$, de cadeia linear ou ramificada; ou alcenilo $C_3$-$C_{12}$;

$R_1$ representa um grupo alquilo $C_1$-$C_{12}$, de cadeia linear

ou ramificada, e pode formar um carbociclo;

X representa um átomo de hidrogénio ou de halogéneo; e

Y representa um átomo de hidrogénio ou de halogéneo.

Num outro aspecto, a presente invenção diz respeito a composições herbicidas que contêm:

(a) um composto de fórmula geral (I) referida antes como ingrediente activo e

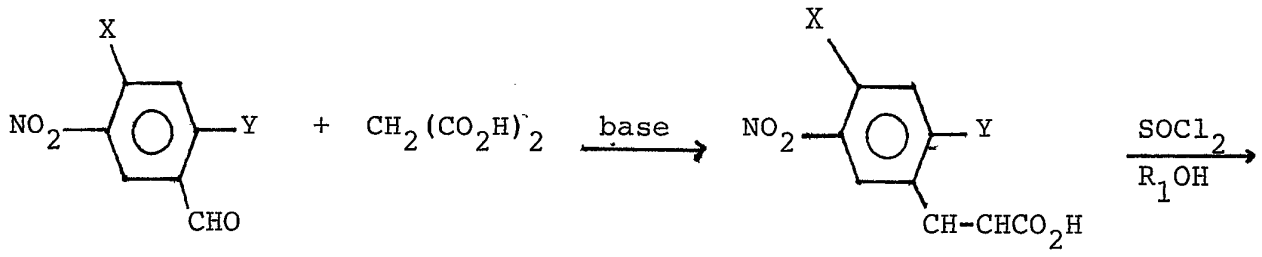
(b) um veículo apropriado.

Ainda de acordo com um outro aspecto, a presente invenção refere-se a um método para o controlo do crescimento de plantas indesejáveis, que compreende a aplicação de uma quantidade herbicida eficaz de um composto de fórmula geral (I) definida antes.

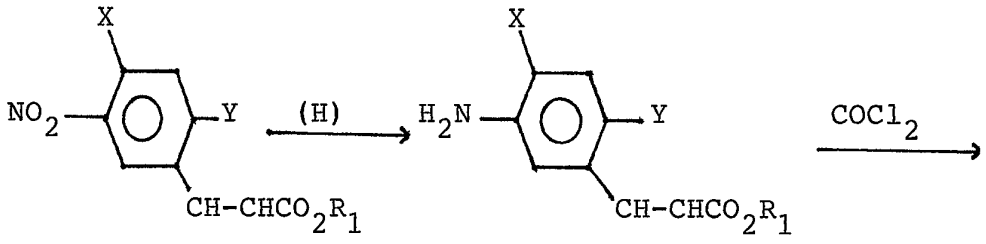
A presente invenção diz também respeito a um processo para a preparação dos compostos de fórmula geral (I) como se descreve em pormenor a seguir.

DESCRIÇÃO PORMENORIZADA DA INVENÇÃO

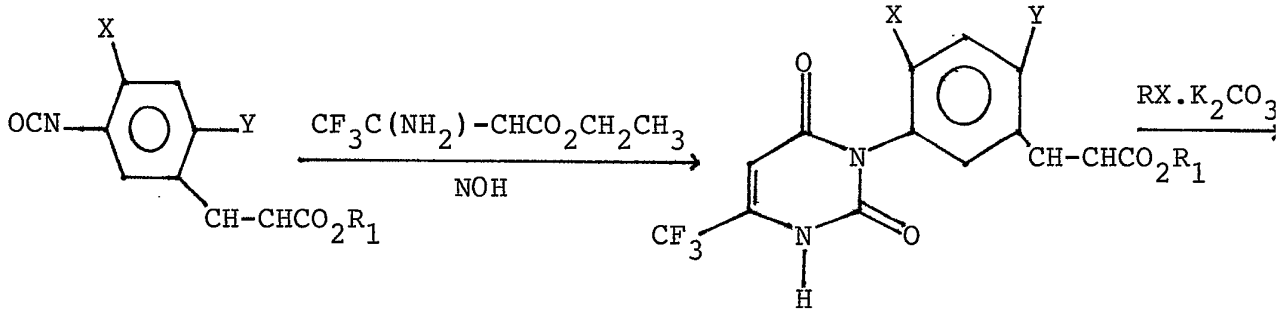
Os compostos de fórmula geral (I) podem ser preparados de acordo com o seguinte esquema:



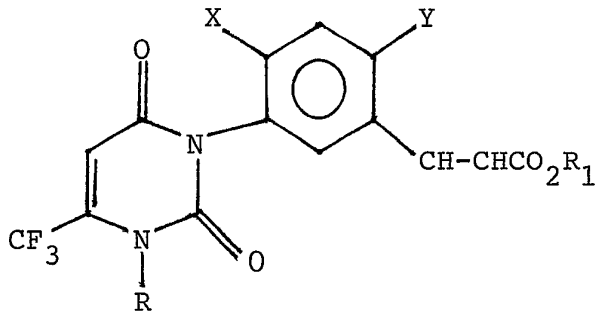
(II) (III)



(IV) (V)



(VI) (VII)



(I)

A formação do ácido cinâmico (III) no primeiro passo requer uma base forte, por exemplo piperidina ou morfolina no seio de um dissolvente básico orgânico, por exemplo piridina. A preparação do éster (IV) é efectuada mediante métodos convencionais conhecidos na técnica, por exemplo mediante formação de um cloreto ácido e subsequente tratamento com um álcool apropriado ou mediante refluxo em excesso de álcool com uma quantidade catalítica de ácido mineral. A redução do composto nitro (IV) é melhor efectuada com aparas de ferro no seio de um álcool aquoso, na presença de um pouco de ácido mineral. O isocianato (VI) pode ser obtido utilizando gás fosgénio e acetato de etilo como dissolvente. O uraciclo (VII) é preparado mediante reacção do isocianato com o sal de sódio de 3-amino-4,4,4-trifluoro-2-butenoato de etilo, a uma temperatura abaixo de zero. A alquilação deste uracilo com um halogeneto de alquilo apropriado (RX, na qual X representa um átomo de halogéneo) com uma base, por exemplo, carbonato de potássio, no seio de dimetilformamida como dissolvente, proporciona os compostos da presente invenção.

As composições de acordo com a presente invenção são constituídas por: (a) uma quantidade herbicida eficaz de um composto de fórmula geral (I) como ingrediente activo e (b) um veículo apropriado. Estas composições podem conter um ou mais dos novos compostos da presente invenção.

Para preparar as composições pode misturar-se o uracilo de éster cinâmico com um adjuvante para se obter composições sob a forma de sólidos de partículas finamente divididas, grânulos, grãos ("pelletes"), pós molháveis, líquidos fluíveis, pós solúveis, soluções e dispersões ou emulsões em dissolvente aquoso ou orgâ-

nico. Estas composições podem ser de diferentes tipos físicos e químicos e podem ser preparadas por um especialista na matéria. Por exemplo, os compostos activos sob o ponto de vista agrícola podem ser impregnados em veículos inorgânicos ou orgânicos finamente divididos ou granulares, tais como argila de atapulgite, areia, verniculite, carolos de milho, carvão activado ou outros veículos granulares conhecidos na técnica. Os grânulos impregnados podem, em seguida, ser espalhados no solo ou incorporados no solo.

Em alternativa, os compostos químicos podem ser formulados sob a forma de um pó molhável triturando-os até se obter um pó fino que se mistura com um veículo pulverizado inerte ao qual se adicionou um agente dispersante tensioactivo. Os veículos sólidos pulverizados típicos são os vários silicatos minerais (tais como mica, talco, pirofilite, argila e semelhantes) ou materiais orgânicos pulverizados (por exemplo, carolo de milho). Em seguida, o pó molhável pode ser disperso em água e pulverizado sobre a superfície do solo ou sobre as culturas ou ervas daninhas.

Do mesmo modo, pode preparar-se um concentrado emulsionável dissolvendo os compostos químicos num dissolvente, tal como a nafta, o tolueno ou outro hidrocarboneto aromático ou alifático ao qual se adicionou um agente dispersante tensioactivo. O concentrado emulsionável pode então ser disperso em água e aplicado por pulverização.

A concentração de ingrediente activo na composição pode variar largamente e está tipicamente compreendida entre cerca de

1% e cerca de 95% em peso. A concentração de ingrediente activo nas dispersões aplicadas ao solo ou à folhagem está tipicamente compreendida entre cerca de 0,002% e cerca de 80% em peso.

As composições que contêm o(s) ingrediente(s) activo(s) podem ser dispersas em água ou num líquido orgânico (tal como óleo) e aplicadas às plantas em causa. Podem adicionar-se à solução aplicada agentes tensioactivos para aumentar o seu intervalo de actividade qualitativa ou quantitativa. Os agentes tensioactivos apropriados são bem conhecidos pelos especialistas na matéria. Para exemplos de agentes tensioactivos apropriados consultar McCutcheon's Detergents and Emulsifiers, Ridgewood, N. J., Allured Publ. Co., 1980. De um modo semelhante, estas composições podem aplicar-se ao solo tanto sob a forma de um líquido como sob a forma de grânulos.

Para utilização como herbicidas em pré-emergência os compostos da presente invenção são aplicados tipicamente em proporções compreendidas entre cerca de 0,01 e cerca de 11 Kg/hectare (cerca de 0,01 a cerca de 10 libras/acre) ao solo que contém as ervas e a sementeira. Esta aplicação faz-se quer à superfície do solo quer a uma camada de solo com 2,5 a 7,5 cm (1 a 3 polegadas). Quando utilizados como herbicidas em pós-emergência, os compostos são tipicamente aplicados em proporções compreendidas entre cerca de 0,01 e cerca de 11 Kg/hectare (cerca de 0,01 a cerca de 10 libras/acre) às partes aéreas das ervas.

Em qualquer caso, a proporção de aplicação mais apropriada depende de factores tais como o tipo de solo, o pH, o teor de

matéria orgânica do solo, a quantidade e a intensidade de chuva antes e depois do tratamento, a temperatura do ar e do solo, a intensidade da luz e o tempo de iluminação diário. Todos estes factores podem influenciar a eficácia dos compostos químicos para uma dada utilização no controlo de ervas daninhas. Contudo, um especialista na matéria pode, mediante experiências de rotina, determinar facilmente as condições óptimas de utilização de qualquer composto em particular.

A utilização de herbicidas pode incluir o controlo da vegetação em locais industriais ou o controlo selectivo de ervas daninhas em campos de cultura.

Exemplos

Os exemplos seguintes são apresentados para ilustrar melhor a presente invenção e não devem ser considerados como limitando o âmbito da invenção em qualquer sentido.

Exemplo 1

Preparação de 3-[2-cloro-5-[3,6-di-hidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluorometil)-1(2H)-pirimidinil]-fenil]-2-propenoato de 1-metiletilo (composto nº 3)

PASSO 1: Ácido 3-(2-cloro-5-nitrofenil)-2-propenóico

Durante 1 hora aquece-se à temperatura de 100° C uma mistura de 100 g (0,54 mole) de 2-cloro-5-nitrobenzal

deído, 122 g (1,2 mole) de ácido malónico em 300 ml de piridina e 5 ml de piperidina, verificando-se uma considerável libertação de gases durante este tempo. Depois de se submeter a mistura reaccional a refluxo durante mais alguns minutos, arrefece-se. Recolhe-se o precipitado formado, lava-se com água e seca-se para se obter o produto com um rendimento de 80%; p.f. 226°-228° C.

PASSO 2: 3-(2-cloro-5-nitrofenil)-2-propenoato de 1-metiletilo

Durante 2 horas submete-se a refluxo 98 g do ácido preparado no Passo 1 com 300 ml de cloreto de tionilo, depois do que se elimina o excesso de cloreto de tionilo. Ao resíduo adicionam-se 300 ml de álcool isopropílico e submete-se a refluxo durante 3 horas. Mediante arrefecimento, obtem-se o produto sob a forma de um precipitado amarelo. Recolhe-se o produto num filtro, lava-se com solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio e depois com água e seca-se para se obter o produto com um rendimento de 89%; p.f. 74°-75° C.

PASSO 3: 3-(5-amino-2-clorofenil)-2-propenoato de 1-metiletilo

Com agitação aquece-se até à temperatura de 70° C uma mistura de 144 ml de etanol, 41 ml de água, 4,3 ml de ácido clorídrico e 63 g de ferro em pó (malha 166), após o que se adiciona, por porções, 98 g (0,36 mole) do éster obtido no Passo 2. A cada adição, verifica-se

uma libertação de calor. Após a adição, submete-se a mistura reaccional a refluxo durante 3 horas, depois do que se filtra ainda quente. Mediante arrefecimento, precipita o produto. Recolhe-se o produto num filtro, lava-se com etanol e seca-se,Obtém-se um rendimento de 78%; p.f. 98°-100° C.

PASSO 4: 2-(2-cloro-5-isocianatofenil)-2-propenoato de 1-metil-etilo

Adiciona-se, gota a gota, uma solução de 26 g do éster obtido no Passo 3 em 100 ml de acetato de etilo a 200 ml de uma solução agitada saturada de fosgénio em acetato de etilo. Mantém-se a agitação e borbulha-se continuamente fosgénio na solução. Depois de interromper a adição, destila-se um pouco do dissolvente à pressão atmosférica para facilitar a remoção do excesso de fosgénio e do resto do dissolvente num evaporador rotativo. Destila-se o resíduo obtido para se obter o isocionato; p.e. 133°-140° C a 0,15 mmHg; 75% de rendimento.

PASSO 5: Sal de sódio de 3-[2-cloro-5-[3,6-di-hidro-2,6-dioxo-4--(trifluorometil)-1(2H)-pirimidinil]-fenil]-2-propenoato de 1-metiletilo

Lava-se com ligroína 3,4 g (60%; 0,88 mole) de hidreto de sódio, cobre-se com 200 ml de tetra-hidrofurano seco e à temperatura de 0° C, com agitação, trata-se mediante adição, gota a gota, durante 30 minutos, de 14,6

g (0,08 mole) de 3-amino-4-trifluoro-2-butenoato de etilo em 100 ml de tetra-hidrofurano seco. Arrefece-se a mistura até à temperatura de -70° C com um banho de neve carbónica/acetona e trata-se com uma solução de 21,6 g (0,08 mole) de isocianato em 100 ml de tetra-hidrofurano seco durante 10 minutos. Terminada a adição, agita-se a mistura reaccional à temperatura de -70° C durante 2 horas, depois do que se deixa retomar a temperatura ambiente durante a noite. Remove-se a maior parte do tetra-hidrofurano e adiciona-se uma quantidade suficiente de cloreto de metileno para precipitar o sal de sódio do uracilo. Recolhe-se o sal de sódio num filtro, lava-se com cloreto de metileno e depois com ligroína (p.c. 30°-60° C) e seca-se; 94% de rendimento.

PASSO 6: 3-[2-cloro-5-[3,5-di-hidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluorometil)-1(2H)-pirimidinil]-fenil]-2-propenoato de 1-metiletilo

Tratam-se 8,4 g (0,02 mole) do sal de sódio obtido no Passo 5 em 25 ml de dimetilformamida, com 3 ml de iodeto de metilo e agita-se à temperatura ambiente durante a noite. Adiciona-se água e recolhe-se o precipitado formado num filtro e recristaliza-se em álcool isopropílico para se obter o produto; p.f. 200°-202° C, cujos espectros de RMN e IV são consistentes com a estrutura (I), na qual (X=H, Y=Cl, R=$CH_3$, $R_1$=$CH(CH_3)_2$).

Exemplo 2

Preparação de 3-[2-cloro-4-fluoro-5-[3,6-di-hidro-2,6-dioxo-3--metil-4-(trifluorometil)-1(2H)-pirimidinil]-fenil]-2-propenoato de 1-metiletilo (composto nº 5)

PASSO 1: Ácido 3-(2-cloro-4-fluorofenil)-2-propenóico

Procede-se como no Exemplo 1, Passo 1, para se obter o produto sob a forma de um sólido branco; p.f. 253°--255° C com 75% de rendimento.

PASSO 2: Ácido 3-(2-cloro-4-fluoro-5-nitrofenil)-2-propenóico

Dissolve-se 51 g (0,25 mole) do produto do Passo 1 em 250 ml de ácido sulfúrico concentrado e arrefece-se até à temperatura de -5° C. Junta-se, gota a gota, 14 ml (d=1,5) de ácido azótico fumante, a uma temperatura inferior a 0° C. Deixa-se a mistura nitrante retomar a temperatura ambiente e deixa-se em repouso durante a noite. Verte-se a mistura reaccional sobre 3 Kg de gelo, recolhe-se num filtro o precipitado branco obtido, lava-se com água e seca-se; p.f. 164°-171° C; 80% de rendimento.

PASSO 3: 3-(2-cloro-4-fluoro-5-nitrofenil)-2-propenoato de 1--metiletilo

Procede-se como no Exemplo 1, Passo 2, e isola-se o

produto com 66% de rendimento; p.f. $95^{o}$-$96^{o}$ C.

PASSO 4: 3-(5-amino-2-cloro-4-fluorofenil)-2-propenoato de 1-metiletilo

Procede-se como no Exemplo 1, Passo 3, para se obter o produto com um rendimento de 76%; p.f. $72^{o}$-$75^{o}$ C.

PASSO 5: 3-(2-cloro-4-fluoro-5-isocianatofenil)-2-propenoato de 1-metiletilo

Procede-se como no Exemplo 1, Passo 4, para se obter o produto com um rendimento de 54%; p.C. $135^{o}$-$143^{o}$ C a 0,3 mmHg.

PASSO 6: Sal de sódio de 3-[2-cloro-4-fluoro-5-[3,6-di-hidro-2,6-dioxo-3-metil-4-(trifluorometil)-1(2H)-pirimidinil]-fenil]-2-propenoato de 1-metiletilo

Procede-se de um modo semelhante ao Exemplo 1, Passo 5, e isola-se o sal de sódio.

PASSO 7: 3-[2-cloro-4-fluoro-5-[3,6-di-hidro-2,6-dioxo-3-metil-4-(trifluorometil)-1(2H)-pirimidinil]-fenil]-2-propenoato de 1-metiletilo

Misturam-se 6,0 g (0,014 mole) do sal de sódio obtido no Passo 6 em 25 ml de álcool isopropílico e 18 g (0,015 mole) de sulfato de dimetilo, agita-se a mis-

tura reaccional e aquece-se durante 2 horas à temperatura de 80° C, depois do que se deixa à temperatura ambiente durante a noite. Depois de se remover o material inorgânico por filtração, seguido de evaporação do dissolvente, obtém-se um precipitado amarelo com um rendimento de 33%; p.f. 137°-139° C.

Os espectros de RMN e IV, bem como a análise elementar dos produtos finais e intermédios são consistentes com os valores teóricos.

Exemplo 3

Preparam-se outros compostos de acordo com a presente invenção utilizando essencialmente os procedimentos descritos antes. As estruturas e os pontos de fusão destes compostos indicam-se no Quadro I a seguir

QUADRO I

| Composto | R | X | Y | $R_1$ | p.f. (°C) |
|---|---|---|---|---|---|
| 1 | H | H | Cl | $CH(CH_3)_2$ | 260°-264° |
| 2 | Na | H | Cl | $CH(CH_3)_2$ | 300° |
| 3 | $CH_3$ | H | Cl | $CH(CH_3)_2$ | 205°-207° |
| 4 | $CH_2CHCH_2$ | H | Cl | $CH(CH_3)_2$ | 134°-136° |
| 5 | $CH_3$ | F | Cl | $CH(CH_3)_2$ | 137°-139° |
| 6 | $CH_3$ | F | Cl | $CH(CH_3)CH_2CH_3$ | 131°-133° |
| 7 | $CH_3$ | F | Cl | $CH(CH_2CH_3)_2$ | 106°-107° |
| 8 | $CH_3$ | H | H | $CH(CH_3)_2$ | 128°-130° |

Exemplo 4

CONTROLO EM PRÉ-EMERGÊNCIA

Para ilustrar a eficácia dos novos compostos da presente invenção como herbicidas em pré-emergência, dissolvem-se 300 mg de cada um dos compostos indicados antes em 10 ml de acetona a que se adicionam 30 mg de um agente emulsionante, o monolaurato de sorbitano etoxilado. Dilui-se a solução até ao volume de 100 ml com água destilada. Diluem-se 10 ml da solução de concentração 3000 ppm até uma concentração de 250 ppm com água

destilada. Aplica-se o composto químico a uma proporção de 11,2 Kg/ha (10 lb/acre), deitando 46 ml da solução de 250 ppm na superfície do solo em vasos de plástico de 11,25 cm (4 1/2 polegadas) em que se semearam sementes das ervas daninhas indicadas a seguir: folha-de-veludo (Abutilon theophrasti Medic.), figueira-do-inferno (Datura stramonium L.) (JW), ipomeia púrpura (Ipomeia purpurea L. Roth) (TM), "Switchgrass" (Panicum virgatum L.) (SG), milhã-pé-de-galo (Echinolchloa crus-galli (L.) Beauv.) (BG), milhã-verde (Setaria viridis (L.) Beauv.) (GF). Duas semanas após o tratamento determina-se a percentagem de controlo das ervas daninhas em comparação com as testemunhas não tratadas. No Quadro II apresentam-se os resultados destes ensaios. Os dados apresentados neste Quadro indicam que os compostos da presente invenção têm uma eficiência herbicida de boa a excelente.

QUADRO II

Actividade em Pré-emergência

(% Controlo a 11,2 Kg/ha)

| Composto | VL | JW | TM | BG | SG | GF |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1 | 50 | 50 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 95 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 4 | 25 | 40 | 0 | 70 | 75 | 100 |
| 5 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 6 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 7 | 100 | 100 | 25 | 100 | 100 | 100 |
| 8 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 |

Exemplo 5

CONTROLO EM PÓS-EMERGÊNCIA

Para ensaiar a eficácia dos compostos de acordo com a presente invenção como herbicidas em pós-emergência, atomiza-se com o auxílio de um pulverizador DEVILBISS (marca comercial) uma solução com concentração de 3000 ppm (preparada de acordo com o processo descrito no Exemplo 4), molhando até gotejar. A parte restante do procedimento é igual ao descrito no Exemplo 4. Utilizam-se as mesmas ervas daninhas que se indicaram no Exemplo 4 e tratam-se 6 dias após a emergência. Avalia-se a percentagem de controlo de ervas daninhas duas semanas após o tratamento. No Quadro III apresentam-se os resultados destes ensaios.

QUADRO III

Actividade em Pós-emergência

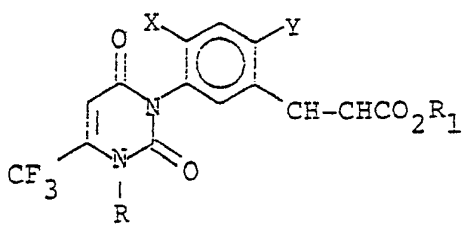
(% de controlo a 3000 ppm)

| Composto | VL | JW | TM | BG | SG | GF |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1 | 0 | 5 | 0 | 10 | 0 | 10 |
| 2 | 0 | 0 | 5 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 4 | 50 | 40 | 35 | 25 | 5 | 35 |
| 5 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 6 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 7 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| 8 | 95 | 10 | 90 | 100 | 25 | 60 |

Os resultados anteriores demonstram o controlo herbicida selectivo em pós-emergência apresentado pelos compostos de acordo com a presente invenção.

# R E I V I N D I C A Ç Õ E S

1.- Processo para a preparação de compostos de fórmula geral



(I)

na qual

R representa um grupo alquilo $C_1$-$C_{12}$, de cadeia li-

near ou ramificada, ou um grupo alcenilo $C_3$-$C_{12}$;

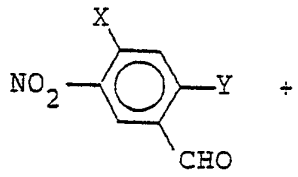
$R_1$ representa um grupo alquilo $C_1$-$C_{12}$, de cadeia linear ou ramificada, e pode formar um grupo carbocíclico;

X representa um átomo de hidrogénio ou de halogéneo; e

Y representa um átomo de hidrogénio ou de halogéneo,

caracterizado pelo facto de:

a) se fazer reagir um composto de fórmula geral

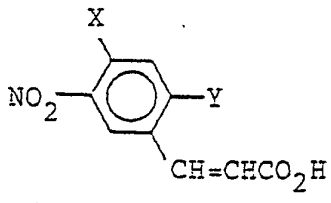



(II)

na qual

X e Y têm os significados definidos antes;

com $CH_2(CO_2H)_2$ na presença de uma base forte, para se obter um ácido cinâmico de fórmula geral




(III)

na qual

X e Y têm os significados definidos antes;

b) se fazer reagir o composto obtido em a), primeiro

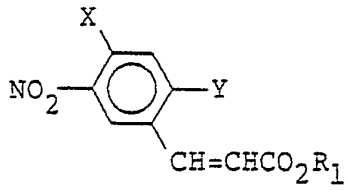
com cloreto de tionilo e subsequentemente com um álcool de fórmula geral

$$R_1OH$$

na qual

$R_1$ tem o significado definido antes;

para se obter um éster de fórmula geral

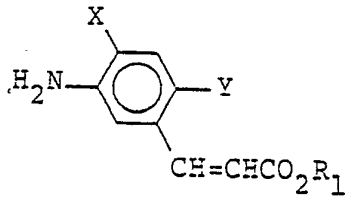


(IV)

na qual

$R_1$, X e Y têm os significados definidos antes;

c) se reduzir o composto obtido em b), com aparas de ferro, no seio de uma mistura aquosa de um álcool, na presença de um ácido inorgânico, para se obter um composto de fórmula geral

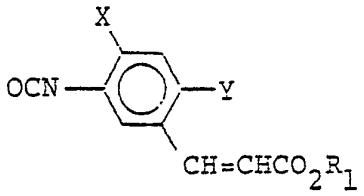


(V)

na qual

$R_1$, X e Y têm os significados definidos antes;

d) se fazer reagir o composto obtido em c) com fosgénio gasoso, no seio de acetato de etilo, para se obter um isocianato de fórmula geral

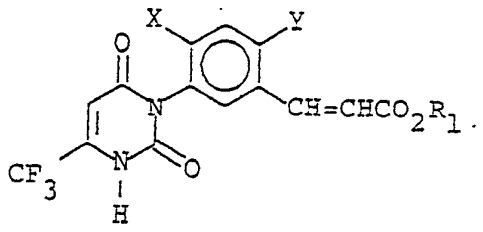


(VI)

na qual

$R_1$, X e Y têm os significados definidos antes;

e) se fazer reagir o composto obtido em d) com um sal de sódio de 3-amino-4,4,4-trifluoro-2-butenoato de etilo, a uma temperatura inferior a 0°C, para se obter um uracilo de fórmula geral



(VII)

na qual

$R_1$, X e Y têm os significados definidos antes; e

f) se alquilar o composto obtido em e), mediante reacção com um composto de fórmula geral

RX

na qual

R tem o significado definido antes; e

X representa um átomo de halógeneo,

e com uma base, no seio de dimetilformamida.

2.- Processo de acordo com a reivindicação 1, para a preparação de compostos de fórmula geral I na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de hidrogénio; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_3)_2$, caracterizado pelo facto de se utilizarem compostos iniciais correspondentemente substituídos.

3.- Processo de acordo com a reivindicação 1, para a preparação de compostos de fórmula geral I na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de flúor; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_3)_2$, caracterizado pelo facto de se utilizarem compostos iniciais correspondentemente substituídos.

4.- Processo de acordo com a reivindicação 1, para a preparação de compostos de fórmula geral I na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de flúor; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_3)CH_2CH_3$, caracterizado pelo facto de se utilizarem compostos iniciais correspondentemente substituídos.

5.- Processo de acordo com a reivindicação 1, para a preparação de compostos de fórmula geral I na qual R represen-

ta um grupo metilo; X representa um átomo de flúor; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_2CH_3)_2$, caracterizado pelo facto de se utilizarem compostos iniciais correspondentemente substituídos.

6.- Processo para a preparação de composições herbicidas, caracterizado pelo facto de se misturar

(A) um composto de fórmula geral I, preparado pelo processo de acordo com a reivindicação 1, com

(B) um veículo apropriado.

7.- Processo de acordo com a reivindicação 6, caracterizado pelo facto de se utilizar um composto de fórmula geral I na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de hidrogénio; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_3)_2$.

8.- Processo de acordo com a reivindicação 6, caracterizado pelo facto de se utilizar um composto de fórmula geral I na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de flúor; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_3)_2$.

9.- Processo de acordo com a reivindicação 6, caracterizado pelo facto de se utilizar um composto de fórmula geral I

na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de flúor; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_3)CH_2CH_3$.

10.- Processo de acordo com a reivindicação 6, caracterizado pelo facto de se utilizar um composto de fórmula geral I na qual R representa um grupo metilo; X representa um átomo de flúor; Y representa um átomo de cloro e $R_1$ representa um grupo $CH(CH_2CH_3)_2$.

11.- Método para controlar o crescimento de plantas indesejáveis, caracterizado pelo facto de se aplicar ao local a tratar uma quantidade herbicida eficaz de um composto de fórmula geral I, preparado pelo processo de acordo com uma qualquer das reivindicações 1 a 5, geralmente compreendida entre cerca de 0,01 e cerca de 11 Kg/ha.

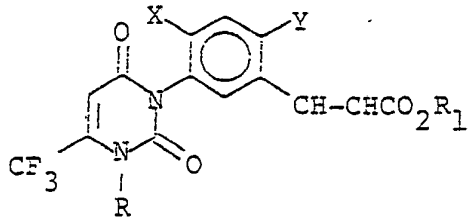
O Agente Oficial da Propriedade Industrial

Lisboa, 1 de Fevereiro de 1991

# R E S U M O

"PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE URACILOS DE ÉSTER CINÂMICO COM ACTIVIDADE HERBICIDA E DE COMPOSIÇÕES HERBICIDAS QUE OS CONTÊM"

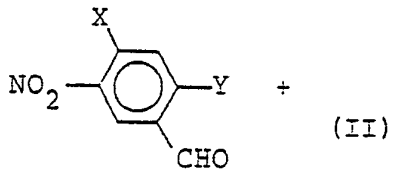
Descreve-se um processo para a preparação de compostos de fórmula geral



(I)

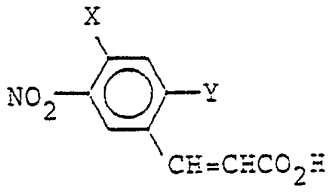
que consiste, nomeadamente, em:

fazer reagir um composto de fórmula geral



(II)

com $CH_2(CO_2H)_2$ na presença de uma base forte, para se obter um ácido cinâmico de fórmula geral



(III)

4.

Também se descreve a preparação de composições herbicidas que contém os compostos de fórmula geral I e um método para a sua aplicação ao controlo de plantas indesejáveis.

O Agente Oficial da Propriedade Industrial

Lisboa, 1 de Fevereiro de 1991