

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 640 592**

51 Int. Cl.:

A01N 35/06	(2006.01)	C07D 309/04	(2006.01)
A01N 43/08	(2006.01)	C07D 311/96	(2006.01)
A01N 43/10	(2006.01)	C07D 213/64	(2006.01)
A01N 43/12	(2006.01)	C07D 239/34	(2006.01)
A01N 43/40	(2006.01)	C07D 241/44	(2006.01)
A01N 43/60	(2006.01)		
A01N 43/78	(2006.01)		
C07C 49/395	(2006.01)		
C07D 307/12	(2006.01)		
C07D 307/93	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.01.2010 PCT/EP2010/050491**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **16.09.2010 WO10102848**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.01.2010 E 10700265 (1)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.07.2017 EP 2389066**

54 Título: **Herbicidas derivados de ciclopentano**

30 Prioridad:

22.01.2009 GB 0901086

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

03.11.2017

73 Titular/es:

**SYNGENTA LIMITED (100.0%)
European Regional Centre, Priestley Road,
Surrey Research Park
Guildford, Surrey GU2 7YH , GB**

72 Inventor/es:

**MATHEWS, CHRISTOPHER JOHN;
FINNEY, JOHN;
SCUTT, JAMES NICHOLAS;
ROBINSON, LOUISA y
DELANEY, JOHN STEPHEN**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 640 592 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

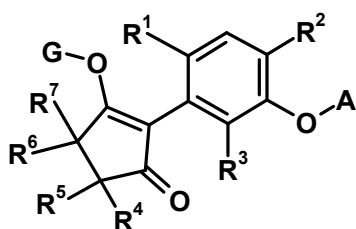
Herbicidas derivados de ciclopentano

5 La presente invención se refiere a nuevas ciclopentanodionas activas como herbicidas y a derivados de las mismas, a procedimientos para su preparación, a composiciones que comprenden esos compuestos y a su uso en controlar malas hierbas, especialmente en cultivos de plantas útiles, o en inhibir un crecimiento de plantas indeseado.

10 Las ciclopentanodionas con acción herbicida se describen, por ejemplo, en los documentos DE 195 18 962 A1, DE 197 08 607 A1, DE 199 35 963 A1, WO 01/74770, WO 96/03366 y US4283348.

Se han encontrado ahora nuevas ciclopentanodionas y derivados de las mismas con propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento.

15 La presente invención se refiere, por lo tanto, a compuestos de fórmula I



en donde

20

A es fenilo, naftilo, piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, cinolinilo, quinolinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo o benzotriazinilo, en cada caso sustituido con Halógeno, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, nitro o ciano,

25 R¹ e metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, halógeno, halometoxi o haloetoxi,

R² y R³ son hidrógeno; y

30 R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃-C₇ opcionalmente sustituido, alqueno C₂-C₆ opcionalmente sustituido, cicloalqueno C₅-C₇ opcionalmente sustituido, alquinilo C₂-C₆ opcionalmente sustituido, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃-C₇ opcionalmente sustituido, alquil C₁-C₆ tio opcionalmente sustituido, alquil C₁-C₆ sulfonilo opcionalmente sustituido, alquil C₁-C₆ sulfonilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido,

35 arilo opcionalmente sustituido, arilitio opcionalmente sustituido, arilsulfonilo opcionalmente sustituido, arilsulfonilo opcionalmente sustituido, heterocicilo opcionalmente sustituido, heterociciloxi opcionalmente sustituido, heterociclitio opcionalmente sustituido, heterocicilsulfonilo opcionalmente sustituido, heterocicilsulfonilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, heteroarilitio opcionalmente sustituido, heteroarilsulfonilo opcionalmente sustituido, heteroarilsulfonilo opcionalmente sustituido, ciano o amino opcionalmente sustituido;

40 o R⁴ y R⁵, o R⁶ y R⁷, junto con los átomos a los que están unidos, forman un carbocicilo o heterocicilo saturado o insaturado, opcionalmente sustituido, en donde el heterociclo contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre;

o R⁵ y R⁶, junto con los átomos a los que están unidos, forman un carbocicilo o heterocicilo saturado o insaturado, opcionalmente sustituido, en donde el heterociclo contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, y carbocicilo que puede estar puenteado, además, por alquil C₁-C₂ diilo o por oxígeno, y

G es hidrógeno o un grupo metal, sulfonio, amonio o latenciador aceptable en agricultura;

45 y en donde, cuando G es un grupo latenciador, entonces G es fenil-alquilo C₁-C₈ (en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃ tio, alquil C₁-C₃ sulfonilo, alquil C₁-C₃ sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo C₁-C₈ (en donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃ tio, alquil C₁-C₃ sulfonilo, alquil C₁-C₃ sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alqueno C₃-C₈, haloalqueno C₃-C₈, alquinilo C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h;

50

en donde X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son, independientemente uno de otro, oxígeno o azufre, y en donde

55 R^a es H, alquilo C₁-C₁₈, alqueno C₂-C₁₈, alquinilo C₂-C₁₈, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅ amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈ amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alqueno C₃-C₅ oxo-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅ tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅ sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅ sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquilideno C₂-C₈ aminoalquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅ carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅ carbonil-alquilo (C₁-C₅), aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅ aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅),

R^f y R^g son, cada uno independientemente uno de otro, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenil C₃-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfonyl-alquilo (C₂-C₈), alquiliden C₂-C₈aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonilamino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)carbonil-*N*-alquil (C₂-C₅)aminoalquilo, trialquil C₃-C₆silil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonyl, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonyl, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; difenilamino o difenilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o cicloalquil C₃-C₇amino, di-cicloalquil C₃-C₇amino, cicloalcoxi C₃-C₇, haloalcoxi C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅amino o dialquil C₂-C₈amino; o benciloxi o fenoxi, en donde los grupos bencilo y fenilo pueden estar a su vez sustituidos con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

R^h es alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₃-C₁₀, alquinilo C₃-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenil C₃-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₃-C₅tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfonyl-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₁-C₅aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₂-C₈carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonilamino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆silil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonyl, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonyl, halógeno, ciano o con nitro), fenoxialquilo (C₁-C₅), (en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonyl, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonyl, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro;

y en donde:

"arilo" significa fenilo o naftilo;

"carbocicilo" significa arilo, cicloalquilo o cicloalquenilo;

"heteroarilo" significa un sistema de anillo aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un anillo sencillo o en dos anillos condensados; y

«heterocicilo» significa un sistema de anillo no aromático, monocíclico o bicíclico que contiene hasta 7 átomos, incluyendo uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N;

y en donde:

cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto alquilo son uno o más de halógeno, nitro, ciano, cicloalquilo C₃-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo C₅-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), hidroxilo, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), trialquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiloxi C₃-C₇ (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alqueniloxi C₃-C₁₀, alquiloxi C₃-C₁₀, mercapto, alquil C₁-C₁₀tio, haloalquil C₁-C₁₀tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-C₇tio (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)silil-(alquil C₁-C₆)tio, ariltio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁-C₆sulfonyl, haloalquil C₁-C₆sulfonyl, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, arilsulfonyl (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), trialquil (C₁-C₄)sililo, arildialquil (C₁-C₄)sililo, alquil (C₁-C₄)diarilsililo, triarilsililo, aril-(alquil C₁-C₄)tio-alquilo (C₁-C₄), ariloxi-alquilo (C₁-C₄), formilo, alquil C₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁-C₁₀carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil(C₁-C₆)aminocarboniloxi, alquil C₁-C₆iminooxi, alquenil C₃-

5 C₆oxiimino, ariloxiimino, arilo (por sí mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (por sí mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi (en donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterociclioxi (en donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆amino, dialquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)amino, alquenil C₂-C₆carbonilo, alquinil C₂-C₆carbonilo, alquenil C₃-C₆oxicarbonilo, alquinil C₃-C₆oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), o arilcarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido);

10 cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo son los sustituyentes opcionales tal como se definen para un resto alquilo;

15 cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo son alquilo C₁-C₃ o son los sustituyentes opcionales tal como se definen para un resto alquilo;

20 y, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclilo se seleccionan independientemente de halógeno, nitro, ciano, tiocianógeno, isotiocianato, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo (C₁-C₆), alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo C₅₋₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), trialquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆), cicloalquil C₃-C₇oxi (en que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alquenil C₃-C₁₀oxi, alquinil C₃-C₁₀oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀tio, haloalquil C₁-C₁₀tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio, cicloalquil C₃-C₇tio (en que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)silil-alquil (C₁-C₆)tio, ariltio, alquil C₁-C₆sulfonilol, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, arilsulfonilo, trialquil (C₁-C₄)sililo, arildialquil (C₁-C₄)sililo, alquil C₁-C₄diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, C₁-C₁₀alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil (C₁-C₆)aminocarboniloxi, arilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroarilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterociclilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en que el arilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroariloxi (en que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterociclioxi (en que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆amino, dialquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)amino y arilcarbonilo (en que el grupo arilo está por sí mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆); o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo están cicladas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, por sí mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆;

40 y en donde grupos heterociclilo sustituidos están sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆tio, alquil C₁-C₆sulfinilo, alquil C₁-C₆sulfonilo, nitro y ciano.

45 En las definiciones de los sustituyentes de los compuestos de fórmula I, cada uno de los restos alquilo, ya sea solo o como parte de un grupo mayor (tal como alcoxi, alquiltio, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena lineal o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo o neopentilo. Los grupos alquilo son adecuadamente grupos alquiloC₁-C₆, pero son preferiblemente grupos alquiloC₁-C₄ o alquiloC₁-C₃, y, más preferiblemente, grupos alquiloC₁-C₂.

50 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto alquilo (solos o como parte de un grupo mayor tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, cicloalquilo C₃-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo C₅₋₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), hidroxilo, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), trialquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiloxi C₃-C₇ (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alqueniloxi C₃-C₁₀, alquiniloxi C₃-C₁₀, mercapto, alquil C₁-C₁₀tio, haloalquil C₁-C₁₀tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-C₇tio (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)silil-alquil (C₁-C₆)tio, ariltio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, arilsulfonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), trialquil (C₁-C₄)sililo, arildialquil (C₁-C₄)sililo, alquil (C₁-C₄)diarilsililo, triarilsililo, aril-alquil (C₁-C₄)tio-alquilo (C₁-C₄), ariloxi-alquilo(C₁-C₄), formilo, alquil C₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁-C₁₀carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil(C₁-C₆)aminocarboniloxi, alquil C₁-C₆iminooxi, alquenil C₃-C₆oxiimino, ariloxiimino, arilo (por sí mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (por sí mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi (en donde el grupo heteroarilo está

opcionalmente sustituido), heterocicliloxi (en donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆amino, dialquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)amino, alquenil C₂-C₆carbonilo, alquinil C₂-C₆carbonilo, alquenil C₃-C₆oxicarbonilo, alquinil C₃-C₆oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), y arilcarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido).

5

Los restos alquenilo y alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alquenilo, en caso apropiado, pueden estar en la configuración (*E*) o (*Z*). Algunos ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los restos alquenilo y alquinilo pueden contener uno o más dobles y/o triples enlaces en cualquier combinación. Se sobreentiende que alenilo y alquilnilalquenilo se incluyen en estos términos.

10

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo son los sustituyentes opcionales tal como se definen para un resto alquilo.

15

Halógeno equivale a flúor, cloro, bromo o yodo.

Grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más de los átomos de halógeno, iguales o diferentes, y son, por ejemplo, CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, FCH₂, ClCH₂, BrCH₂, CH₃CHF, (CH₃)₂CF, CF₃CH₂ o CHF₂CH₂.

20

En el contexto de la presente memoria descriptiva, un grupo arilo preferido es fenilo.

El término "heteroarilo" significa un sistema de anillo aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un anillo sencillo o en dos anillos condensados. Preferentemente, los anillos únicos contendrán hasta tres heteroátomos y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que se seleccionarán preferentemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo.

25

30

El término "heterociclilo" se refiere a sistemas de anillos no aromáticos, preferiblemente monocíclicos o bicíclicos que contiene hasta 7 átomos, incluyendo uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N. Ejemplos de este tipo de anillos incluyen 1,3-dioxolano, oxetano, tetrahidrofurano, morfolina, tiomorfolina y piperazina. Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en heterociclilo son como se definen más adelante.

35

Cicloalquilo incluye preferentemente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Cicloalquilalquilo es preferentemente ciclopropilmetilo. Cicloalquenilo incluye preferentemente ciclopentenilo y ciclohexenilo. Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo incluyen alquilo C₁-C₃ así como los sustituyentes opcionales tal como se definen arriba para un resto alquilo.

40

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclos se seleccionan de preferencia, independientemente, de halógeno, nitro, ciano, tiocianógeno, isotiocianato, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo (C₁-C₆), alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo C₅₋₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), hidroxil, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), trialquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆), cicloalquil C₃-C₇oxi (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alquenil C₃-C₁₀oxi, alquinil C₃-C₁₀oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀tio, haloalquil C₁-C₁₀tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio, cicloalquil C₃-C₇tio (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)-silil-alquil (C₁-C₆)tio, ariltio, alquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, arilsulfonilo, trialquil (C₁-C₄)sililo, arildialquil (C₁-C₄)sililo, alquil C₁-C₄diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁-C₁₀carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, *N*-(alquil C₁-C₃)-*N*-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil (C₁-C₆)aminocarboniloxi, arilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroarilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterociclilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroariloxi (en donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloxi (en donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), amino, C₁-C₆alquilamino, dialquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)amino, arilcarbonilo, (en que el grupo arilo está por sí mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆) o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo pueden estar cicladas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, por sí mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆.

50

55

60

65

- Para grupos heterociclilo sustituidos, los uno o más sustituyentes se seleccionan independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆l, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆tio, alquil C₁-C₆sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfonilo, nitro y ciano. Ha de entenderse que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos, en donde los grupos dialquilo, junto con el átomo de N al que está unidos, un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo C₁-C₆independientemente seleccionados. Cuando anillos heterocíclicos se forman al unir dos grupos en un átomo de N, los anillos resultantes son adecuadamente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina, cada uno de los cuales puede estar sustituido con uno o dos grupos alquilo C₁-C₆ independientemente seleccionados.
- La invención también se refiere a las sales aceptables en agricultura que los compuestos de fórmula I sean capaces de formar con bases de metales de transición, metales alcalinos y metales alcalinotérreos, aminas, bases de amonio cuaternario o bases de sulfonio terciario.
- Entre los formadores de sales de metales de transición, metales alcalinos y metales alcalinotérreos, cabe destacar especialmente los hidróxidos de cobre, hierro, litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, y preferentemente los hidróxidos, bicarbonatos y carbonatos de sodio y potasio.
- Ejemplos de aminas adecuadas para la formación de la sal amonio incluyen amoniaco así como alquil C₁-C₁₈aminas primarias, secundarias y terciarias, hidroxialquil C₁-C₄aminas y alcoxialquil C₂-C₄aminas, por ejemplo metilamina, etilamina, *n*-propilamina, isopropilamina, los cuatro isómeros de butilamina, *n*-amilamina, isoamilamina, hexilamina, heptilamina, octilamina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metilpentadecilamina, metilhexilamina, metilnonilamina, metilpentadecilamina, metiloctadecilamina, etilbutilamina, etilheptilamina, etiloctilamina, hexilheptilamina, hexiloctilamina, dimetilamina, dietilamina, di-*n*-propilamina, di-isopropilamina, di-*n*-butilamina, di-*n*-amilamina, di-isoamilamina, dihexilamina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, *n*-propanolamina, isopropanolamina, *N,N*-dietanolamina, *N*-etilpropanolamina, *N*-butiletanolamina, alilamina, *n*-but-2-enilamina, *n*-pent-2-enilamina, 2,3-dimetilbut-2-enilamina, dibut-2-enilamina, *n*-hex-2-enilamina, propilendiamina, trimetilamina, trietilamina, tri-*n*-propilamina, tri-isopropilamina, tri-*n*-butilamina, tri-isobutilamina, tri-*sec*-butilamina, tri-*n*-amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas, por ejemplo piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias, por ejemplo anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, *o*-, *m*- y *p*-toluidinas, fenilendiaminas, bencidinas, nadtilaminas y *o*-, *m*- y *p*-cloroanilinas; pero especialmente trietilamina, Isopropilamina y di-isopropilamina.
- Las bases de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales se corresponden, por ejemplo, con la fórmula [N(R_a R_b R_c R_d)]OH, donde R_a, R_b, R_c y R_d son cada uno independientemente de los demás hidrógeno o alquilo C₁-C₄. Se pueden obtener otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio aniónico.
- Las bases de sulfonio terciario preferidas adecuadas para la formación de sales se corresponden, por ejemplo, con la fórmula [SR_eR_fR_g]⁺OH, en donde R_e, R_f y R_g son, cada uno independientemente de los demás, alquilo C₁-C₄. Se prefiere especialmente el hidróxido de trimetilsulfonio. Las bases de sulfonio adecuadas se pueden obtener a partir de la reacción de tioéteres, en particular sulfuros de dialquilo, con haluros de alquilo, seguida de la conversión en una base adecuada, por ejemplo, un hidróxido, mediante reacciones de intercambio aniónico.
- Se debe sobreentender que en aquellos compuestos de fórmula I, en los que G sea un metal, amonio o sulfonio tal como se mencionó anteriormente y como tal represente un catión, la carga negativa correspondiente estará deslocalizada en gran parte en la unidad O-C=C-C=O.
- Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen hidratos que pueden formarse durante la formación de sales.
- Los grupos G latenciadores se seleccionan para permitir su separación mediante uno o una combinación de procesos bioquímicos, químicos o físicos para proporcionar compuestos de fórmula I, en que G es H antes, durante o tras la aplicación a la zona tratada o a las plantas. Los ejemplos de estos procesos incluyen escisión enzimática, fotólisis e hidrólisis química. Los compuestos que contienen dichos grupos G pueden ofrecer ciertas ventajas tales como una penetración mejorada de la cutícula de las plantas tratadas, un aumento de la tolerancia de los cultivos, una compatibilidad o estabilidad mejorada en mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, protectores contra herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas, o una reducción de la filtración en los suelos.
- Grupos latenciadores incluyen alquilo C₁-C₈, haloalquilo C₂-C₈, fenil-alquilo C₁-C₈ (en donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfonilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo C₁-C₈ (en donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfonilo, alquil C₁-C₃ sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquenilo C₃-C₈, haloalquenilo C₃-C₈, alquinilo C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^b-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h en donde X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son, independientemente uno de otro, oxígeno o azufre;

sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, o cicloalquil C₃-C₇amino, dicicloalquil C₃-C₇amino o cicloalcoxi C₃-C₇, alcoxi C₁-C₁₀, haloalcoxi C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅amino o dialquil C₂-C₈amino,

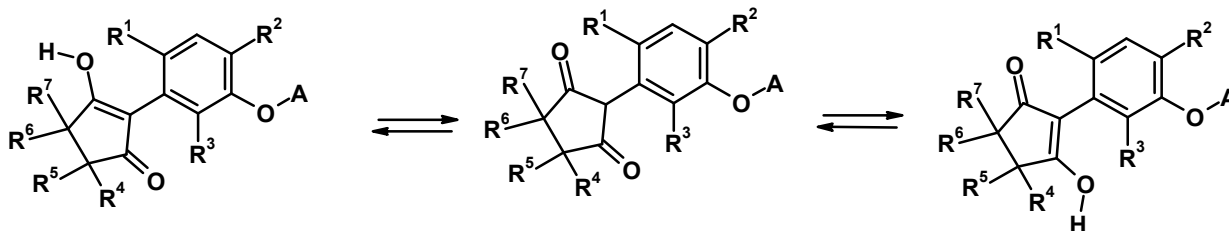
R⁷ y R⁹ son, cada uno independientemente uno de otro, alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀, alquino C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonilamino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)carbonil-*N*-alquil (C₂-C₅)aminoalquilo, trialquil C₃-C₆silil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenoil C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, difenilamino, o difenilamino sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, alquiliden C₂-C₈aminoxi-alquilo (C₁-C₅), dicicloalquil C₃-C₇amino o cicloalcoxi C₃-C₇, haloalcoxi C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅amino o dialquil C₂-C₈amino, benciloxi o fenoxi, en donde los grupos bencilo y fenilo pueden estar a su vez sustituidos con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, y

R^h es alquilo C₁-C₁₀, alquenoil C₃-C₁₀, alquinoil C₃-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alquenoil C₃-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfonil-alquilo (C₁-C₅), alquiliden C₂-C₈aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonilamino-alquilo (C₁-C₅), *N*-alquil (C₁-C₅)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₅)amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆silil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxi-alquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenoil C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro.

En particular, el grupo G latenciador es un grupo -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b, y los significados de X^a, R^a, X^b, X^c y R^b son como se definen arriba.

Se prefiere que G sea hidrógeno, un metal alcalino o un metal alcalinotérreo, en donde hidrógeno es especialmente preferido.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes formas isoméricas. Por ejemplo, cuando G es hidrógeno y R⁴ y R⁵ son diferentes de R⁶ y R⁷, compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes formas tautoméricas.



Esta invención abarca todos estos isómeros y tautómeros, y sus mezclas en todas las proporciones. También, cuando los sustituyentes contienen dobles enlaces, pueden existir isómeros *cis* y *trans*. Estos isómeros, también, están dentro del alcance de los compuestos reivindicados de la fórmula I.

R¹ es preferiblemente metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, halógeno, halometoxi o haloetoxi, especialmente etilo,.

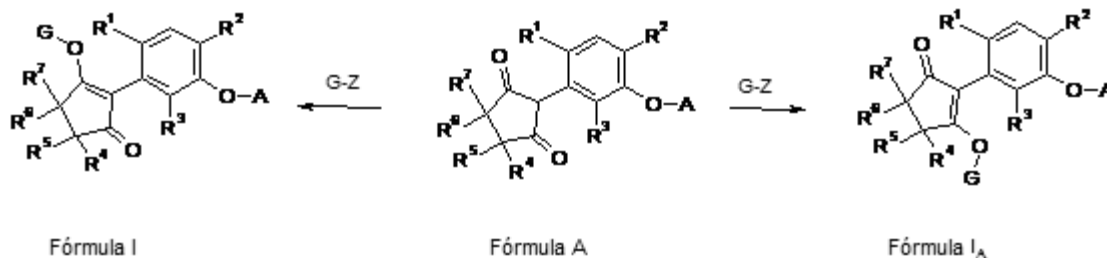
Preferiblemente, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, heterociclilo de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido o heterociclil-alquilo C₁-C₂ de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido, o R⁴ y R⁵, o R⁶ y R⁷, junto con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo o heterociclilo de cinco o seis miembros, saturado o insaturado, opcionalmente sustituido, que contiene uno o dos átomos de oxígeno, o R⁵ y R⁶, con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo de cinco o seis miembros, saturado o insaturado, opcionalmente sustituido, que está opcionalmente puentado por alquil C₁-C₂diilo o por oxígeno.

Más preferiblemente, R⁴ y R⁷ son hidrógeno y R⁵ y R⁶, con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo de cinco o seis miembros, saturado o insaturado, que está puentado por alquil C₁-C₂diilo o por oxígeno.

Compuestos particularmente preferidos de la fórmula (I) son aquellos en donde R¹ es etilo o ciclopropilo, R² y R³ son hidrógeno, R⁴, R⁷, R⁵ y R⁶ son hidrógeno, o R⁴ y R⁷ son hidrógeno y R⁵ y R⁶, con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo de cinco o seis miembros, saturado, que está puentado por alquil C₁-C₂diilo o por oxígeno, A es fenilo sustituido con fluoro, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, ciano o nitro, o A es piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, benzotiazolilo, quinolinilo o quinoxalinilo, en cada caso sustituido con fluoro, cloro, bromo, trifluorometilo, metoxi o nitro, y G es hidrógeno..

Un compuesto de fórmula I, en donde G es alquilo C₁-C₈, haloalquilo C₂-C₈, fenil-alquilo C₁-C₈ (en donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sufinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo C₁-C₈ (en donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sufinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alqueno C₃-C₈, haloalqueno C₃-C₈, alquinilo C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h, en que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e, X^f, R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R^f, R^g y R^h son como se definen arriba, se pueden preparar tratando un compuesto de fórmula (A), que es un compuesto de fórmula (I), en donde G es H, con un reactivo G-Z, en donde G-Z es un agente alquilante tal como un haluro de alquilo (la definición de haluros de alquilo incluye haluros de alquilo C₁-C₈ simples tales como yoduro de metilo y yoduro de etilo, haluros de alquilo sustituidos tales como clorometil-alquil-éteres, Cl-CH₂-X^f-R^h, en donde X^f es oxígeno, y sulfuros de clorometil-alquilo Cl-CH₂-X^f-R^h, en donde X^f es azufre), un sulfonato de alquilo C₁-C₈, o un sulfato de di(alquilo C₁-C₈), o con un haluro de alqueno C₃-C₈, o con un haluro de alquinilo C₃-C₈, o con un agente acilante tal como un ácido carboxílico, HO-C(X^a)R^a, en donde X^a es oxígeno, un cloruro de ácido, Cl-C(X^a)R^a, en donde X^a es oxígeno, o un anhídrido de ácido, [R^aC(X^a)]₂O, en donde X^a es oxígeno, o un isocianato, R^cN=C=O, o un cloruro de carbamilo, Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d (en donde X^d es oxígeno y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloruro de tiocarbonylo Cl-(X^d)-N(R^c)-R^d (en donde X^d es azufre y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno) o un cloroformiato, Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en donde X^b y X^c son oxígeno), o un clorotioformiato Cl-C(X^b)-X^c-R^b (en donde X^b es oxígeno y X^c es azufre), o un cloroditioformiato Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en donde X^b y X^c son azufre), o un isotiocianato, R^cN=C=S, o mediante tratamiento secuencial con disulfuro de carbono y un agente alquilante, o con un agente fosforilante tal como un cloruro de fosforilo, Cl-P(X^e)(R^f)-R^g o con un agente sulfonilante tal como cloruro de sulfonilo Cl-SO₂-R^e, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de una base.

En los casos en los que R⁴ y R⁵ no sean iguales a sustituyentes R⁶ y R⁷, estas reacciones pueden producir, además de un compuesto de fórmula (I), un segundo compuesto de fórmula (I_A).



Esta invención cubre tanto un compuesto de fórmula (I) como un compuesto de fórmula (I_A), junto con mezclas de estos compuestos en cualquier relación.

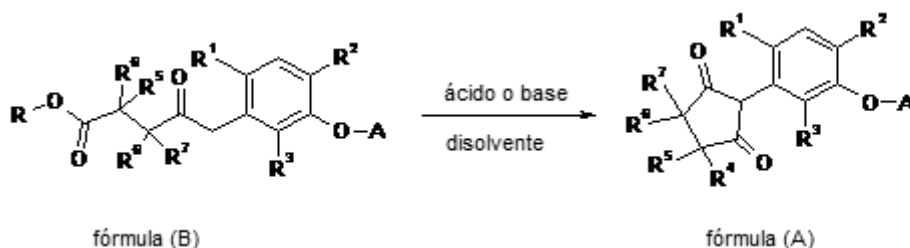
La O-alkilación de 1,3-dionas cíclicas es conocida; métodos adecuados se describen, por ejemplo, por T. Wheeler, documento US4436666. Procedimientos alternativos han sido reseñados por M. Pizzorno y S. Albonico, Chem. Ind. (London), (1972), 425-426; H. Born *et al.*, J. Chem. Soc., (1953), 1779-1782; M. G. Constantino *et al.*, Synth. Commun., (1992), 22 (19), 2859-2864; Y. Tian *et al.*, Synth. Commun., (1997), 27 (9), 1577-1582; S. Chandra Roy *et al.*, Chem. Letters, (2006), 35 (1), 16-17; P. K. Zubaidha *et al.*, Tetrahedron Lett., (2004), 45, 7187-7188.

La O-acilación de las 1,3-dionas cíclicas se puede realizar mediante procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, R. Haines, documento US4175135 y T. Wheeler, documentos US4422870, US4659372 y US4436666. Normalmente las dionas de fórmula (A) se pueden tratar con un agente acilante preferentemente en presencia de al menos un equivalente de una base adecuada y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado. La base puede ser inorgánica, tal como un hidróxido o carbonato de un metal alcalino, o un hidruro metálico, o una base orgánica tal como una amina terciaria o alcóxido metálico. Ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, o hidróxido de sodio o potasio, hidruro de sodio y bases orgánicas adecuadas incluyen trialkilaminas, tal como trimetilamina y trietilamina, piridinas u otras bases de amina tales como 1,4-diazobicyclo[2.2.2]octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los disolventes adecuados para esta reacción se seleccionan para que sean compatibles con los reactivos e incluyen éteres tales como tetrahydrofurano y 1,2-dimetoxietano y disolventes halogenados tales como diclorometano y cloroformo. Ciertas bases, tales como la piridina y trietilamina, se pueden utilizar con éxito como base y también como disolvente. Para los casos en los que el agente acilante sea un ácido carboxílico, la acilación se lleva a cabo preferiblemente en presencia de un agente de acoplamiento conocido tal como yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, *N,N'*-diclohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y *N,N'*-carbodiimidazol y opcionalmente en presencia de una base tal como trietilamina o piridina en un disolvente apropiado tal como tetrahydrofurano, diclorometano o acetonitrilo. Procedimientos apropiados se describen por ejemplo, por parte de W. Zhang y G. Pugh, *Tetrahedron Lett.*, (1999), 40 (43), 7595-7598; T. Isobe y T. Ishikawa, *J. Org. Chem.*, (1999), 64 (19), 6984-6988 y K. Nicolaou, T. Montagnon, G. Vassilikogiannakis, C. Mathison, *J. Am. Chem. Soc.*, (2005), 127(24), 8872-8888.

La fosforilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar utilizando un haluro de fosforilo o haluro de tiofosforilo y una base mediante procedimientos análogos a los descritos por L. Hodakowski, documento US4409153.

La sulfonilación de un compuesto de fórmula (A) se puede conseguir utilizando un haluro de alquil- o arilsulfonilo, preferentemente en presencia de al menos un equivalente de base, por ejemplo, mediante el procedimiento de C. Kowalski y K. Fields, *J. Org. Chem.*, (1981), 46, 197-201.

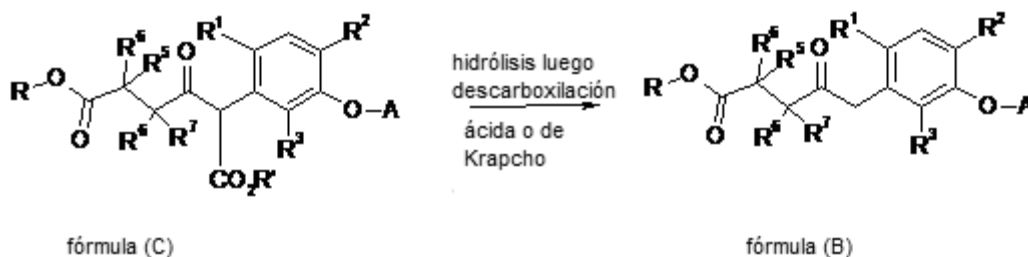
Un compuesto de fórmula (A) se puede prepara a través de la ciclación de un compuesto de fórmula (B), preferiblemente en presencia de un ácido o una base, y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, por métodos análogos a los descritos por T. Wheeler, documento US4283348. Los compuestos de fórmula (B) se designan particularmente como intermedios en la síntesis de los compuestos de fórmula I. Los compuestos de fórmula (B) en la que R es hidrógeno o alquilo C₁-C₄ (especialmente, metilo, etilo y *terc.*-butilo) se pueden ciclar en condiciones ácidas, preferiblemente en presencia de un ácido fuerte tal como ácido sulfúrico, ácido polifosfórico o reactivo de Eaton, opcionalmente en presencia de un disolvente apropiado tal como ácido acético, tolueno o diclorometano.



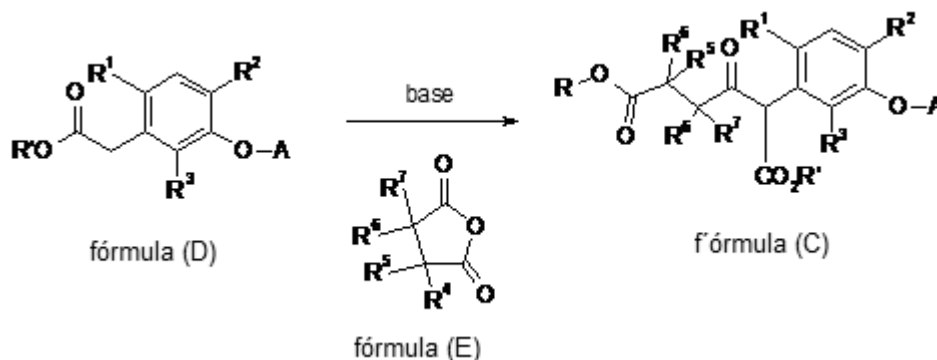
Un compuesto de fórmula (B), en donde R es alquilo (preferiblemente metilo o etilo) se puede ciclar bajo condiciones de carácter ácido o básico, preferiblemente bajo condiciones de carácter básico, en presencia de al menos un equivalente de una base fuerte tal como *terc.*-butóxido de potasio, diisopropilamida de litio bis(trimetilsilil)amida de sodio o hidruro sódico, y en un disolvente tal como tetrahydrofurano, tolueno, dimetilsulfóxido o *N,N*-dimetilformamida.

Un compuesto de fórmula (B), en donde R es H, se puede esterificar para dar un compuesto de fórmula (B), en donde R es alquilo, bajo condiciones conocidas (por ejemplo mediante tratamiento con un alcohol, R-OH, en presencia de un catalizador ácido).

Un compuesto de fórmula (B), en donde R es H, se puede preparar mediante hidrólisis de un compuesto de fórmula (C), en donde R es H o alquilo y R' es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), seguido de acidificación de la mezcla de reacción para efectuar la descarboxilación. Alternativamente, un compuesto de fórmula (B), en donde R es alquilo, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (C), en donde R es alquilo y R' es metilo o etilo (preferiblemente metilo) a través de un proceso de descarboxilación de Krapcho, bajo condiciones conocidas, utilizando reactivos conocidos (véase, por ejemplo, G. Quallich, P. Morrissey, *Synthesis*, (1993), (1), 51-53).

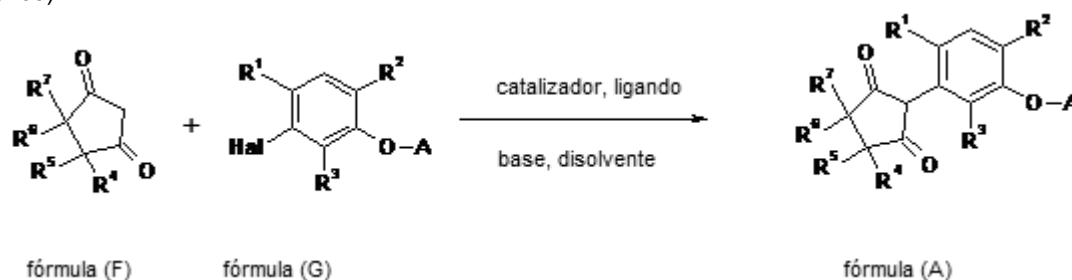


5 Un compuesto de fórmula (C), en donde R es H, se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (D) con una base adecuada (tal como *terc.*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amida de sodio y diisopropilamida de litio) en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura adecuada (entre -80 °C y 30 °C) y haciendo reaccionar el anión resultante con anhídrido adecuado de fórmula (E).



10 Compuestos de fórmula (D) son conocidos o se pueden preparar por métodos conocidos a partir de materiales de partida comercialmente disponibles (véase, por ejemplo, *et al.*, Chem. Pharm. Bull., (1991), 39 (11), 2878-2882; R. Kirsten *et al.*, documento EP338306 A2; W. Marshall, documento US3649679) o se pueden preparar por métodos similares a partir de compuestos conocidos. Compuestos de fórmula (E) son conocidos o se pueden preparar por métodos conocidos a partir de materiales de partida comercialmente disponibles (véase, por ejemplo, J. Rowley *et al.*, J. Am. Chem. Soc., (2007), 129 (16), 4948-4960; J. Pohlmann *et al.*, Bioorg. Med. Chem. Lett., (2005), 15(4), 1189-1192; L. Fieser y E. Martin., Org. Synth. Coll. Vol. II (1943), 560-561).

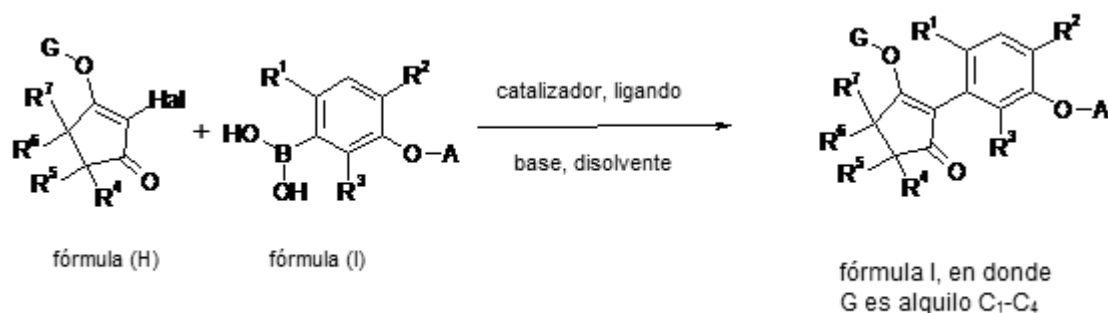
20 En un enfoque alternativo, un compuesto de fórmula (A) se puede preparar mediante acoplamiento cruzado de una diona de fórmula (F) con un haluro de arilo de fórmula (G). Acoplamientos similares son conocidos en la bibliografía (véase, por ejemplo, S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc. (2000), 122, 1360-1370; B. Hong *et al.* Documento WO 2005/000233).



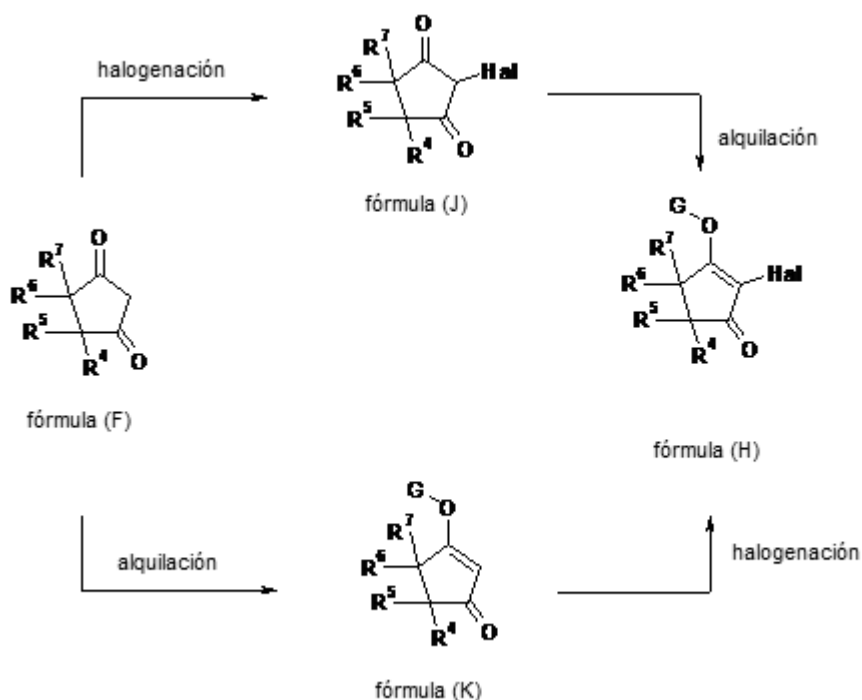
25 Compuestos de fórmula (F) son conocidos o se pueden preparar por métodos conocidos a partir de compuestos conocidos (véase, por ejemplo, M. Nishizawa *et al.*, Synlett., (2006), 4, 642-644; J. Mascarenas *et al.*, Org. Lett., (2003), 5 (11), 1975-1977; A. Demir y D. Enders, Journal fuer Praktische Chemie, (1997), 339 (6), 553-563; B. Zwanenburg *et al.*, Tetrahedron (1989), 45 (22), 7109-7133; A. Demir y D. Enders, Tetrahedron Lett., (1989), 30 (13), 1705-1708; E. Guntrum *et al.*, Synthesis, (1986), (11), 921-925, y por M. Oda *et al.*, Chem. Lett., (1977), 6 (3), 307-310).

30 En un enfoque alternativo, un compuesto de fórmula I, en donde G es alquilo C₁₋₄ se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (H) (en donde G es alquilo C₁₋₄, y Hal es un halógeno, preferiblemente bromo o yodo) con un ácido arilborónico de fórmula (I) en presencia de un catalizador de paladio adecuado (por ejemplo acetato de paladio(II) al 0.001-50% con respecto a un compuesto (H)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de fosfato de potasio con respecto al compuesto (H)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo (2-diciclohexil-fosfino)-2',6'-dimetoxibifenilo al 0.001-50% con respecto al compuesto (U)), y en un disolvente adecuado

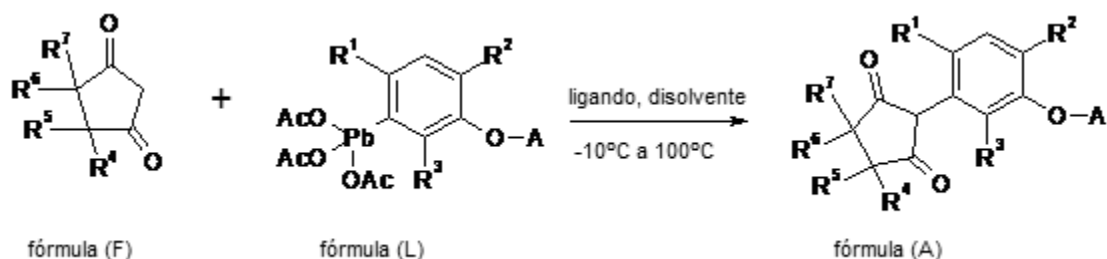
(por ejemplo tolueno), preferiblemente entre 25°C y 200°C. Acoplamientos similares son conocidos en la bibliografía (véase, por ejemplo, Y. Song, B. Kim y J.-N. Heo, *Tetrahedron Letters* (2005), 46 (36), 5987-5990).



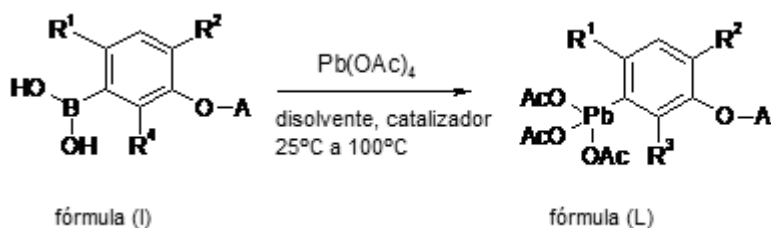
- 5 Un compuesto de fórmula (H) se puede preparar halogenando un compuesto de fórmula (F), seguido de reacción del haluro resultante de fórmula (J) con un haluro de alquilo C₁-C₄ u ortoformiato de tri-alquilo C₁-C₄ bajo condiciones conocidas, por ejemplo mediante los procedimientos de R. Shepherd y A. White (*J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1* (1987), 2153-2155) y Y.-L. Lin *et al.* (*Bioorg. Med. Chem.* (2002), 10, 685-690). Alternativamente, un compuesto de fórmula (H) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (F) con un haluro de alquilo C₁-C₄ o un ortoformiato de tri-alquilo C₁-C₄, y halogenando la enona resultante de fórmula (K) bajo condiciones conocidas (véase por ejemplo Y. Song, B. Kim y J.-N. Heo, *Tetrahedron Letters* (2005), 46(36), 5987-5990).



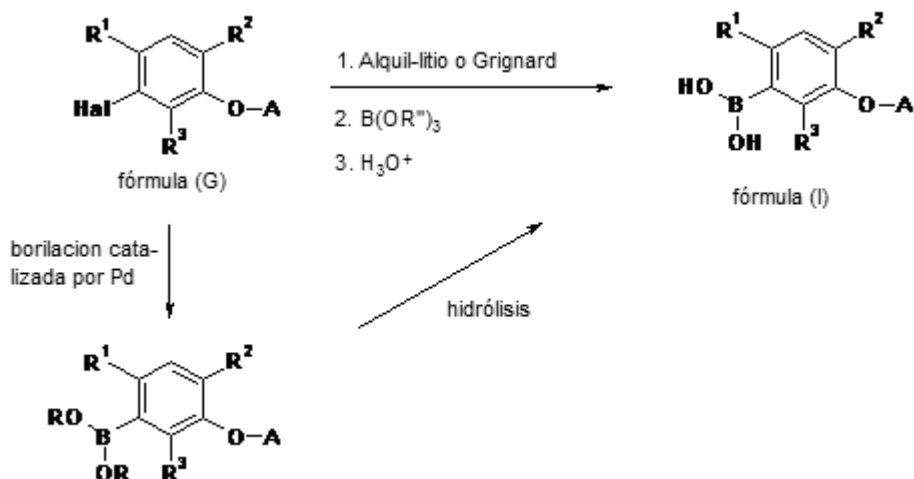
- 15 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula (A) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (F) con un tricarboxilato arilado, en presencia de un ligando adecuado y en un disolvente adecuado. Reacciones similares se describen en la bibliografía (por ejemplo, véase, M. Muehlebach *et al.*, documento WO08/071405; J. Pinhey, B. Rowe, *Aust. J. Chem.*, (1979), 32, 1561-6; J. Morgan, J. Pinhey, *J. Chem. Soc. Perkin Trans* Preferiblemente, el tricarboxilato arilado es un triacetato arilado de fórmula (L). Preferiblemente, el ligando es un heterociclo que contiene nitrógeno tal como *N,N*-dimetilamino-piridina, 1,10-fenantrolina-piridina, biperidina o imidazol, y preferiblemente se utilizan uno a diez equivalentes de ligando con respecto a un compuesto de fórmula (F). Más preferentemente, el ligando es *N,N*-dimetilaminopiridina. El disolvente es preferiblemente cloroformo, diclorometano o tolueno, más preferiblemente cloroformo o una mezcla de cloroformo y tolueno. Preferentemente la reacción se lleva a cabo a una temperatura de -10°C a 100°C, más preferentemente de 40 a 90°C).



5 Un compuesto de fórmula (L) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (I) mediante tratamiento con tetraacetato de plomo en un disolvente adecuado (por ejemplo cloroformo) a 25°C hasta 100°C (preferiblemente 25-50°C) y opcionalmente en presencia de un catalizador tal como diacetato de mercurio, de acuerdo con procedimientos descritos en la bibliografía (por ejemplo, véase M. Muehlebach *et al.*, documento WO08/071405; K. Shimi, G. Boyer, J-P. Finet y J-P. Galy, *Letters in Organic Chemistry*, (2005), 2, 407-409; J. Morgan y J. Pinhey, *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1*; (1990), 3, 715-720).

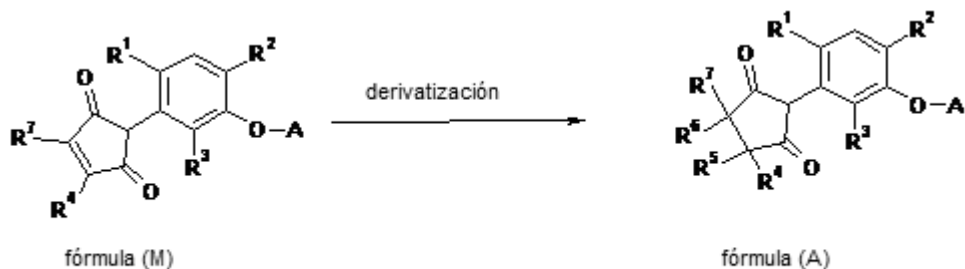


10 Un ácido aril-borónico de fórmula (I) se puede preparar a partir de un haluro de arilo de fórmula (G), en donde Hal es bromo o yodo, por métodos conocidos (véase, por ejemplo, W. Thompson y J. Gaudino, *J. Org. Chem.*, (1984), 49, 5237-5243 y R. Hawkins *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.*, (1960), 82, 3053-3059). Por lo tanto, un haluro de arilo de fórmula (G) se puede tratar con un haluro de alquil-litio o alquil-magnesio a baja temperatura, y el reactivo de aril-magnesio o aril-litio obtenido se deja que reaccione con un borato de trialquilo, B(OR'')₃, preferiblemente borato de trimetilo (R'' es metilo), para dar un dialquilboronato de arilo, que se puede hidrolizar para dar el ácido borónico deseado de fórmula (I) bajo condiciones ácidas. Alternativamente, la misma transformación global de compuesto (G) en compuesto (I) se puede conseguir a través de una reacción de borilación catalizada por paladio bajo condiciones conocidas, utilizando reactivos conocidos (véase, por ejemplo, T. Ishiyama, M. Murata, N. Miyaura, *J. Org. Chem.* (1995), 60, 7508-7501; y K. L. Billingsley, T. E. Barder, S. L. Buchwald, *Angew. Chem. Int. Ed.* (2007), 46, 5359-5363), seguido de hidrólisis del éster boronato intermedio.

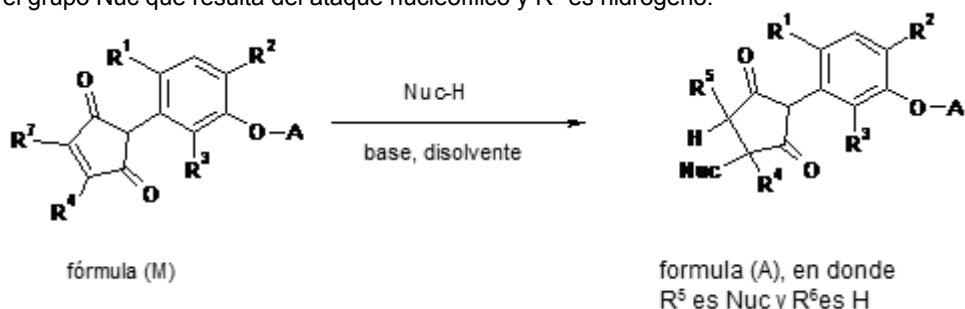


25 Haluros de arilo de fórmula (G) son compuestos conocidos o se pueden preparar por métodos conocidos a partir de compuestos conocidos (véase, por ejemplo, R. Clark, *J. Agric. Food Chem.*, (1996), 44 (11), 3643-3652; T. Okamoto y J. Bunnett, *J. Am. Chem. Soc.*, (1956), 78, 5357-5362; H. Scarborough y J. Sweeten, *J. Chem. Soc.*, (1934), 52-56).

30 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula (A) se puede preparar por derivatización de un compuesto de fórmula (M), que es un compuesto de fórmula I, en donde G es hidrógeno y R⁵ y R⁶ juntos forman un enlace. Compuestos de fórmula (M) son dionas cíclicas α,β-insaturadas y sufren reacciones en presencia de reactivos conocidos para efectuar transformaciones de cetonas α,β-insaturadas para dar compuestos adicionales de fórmula (A).



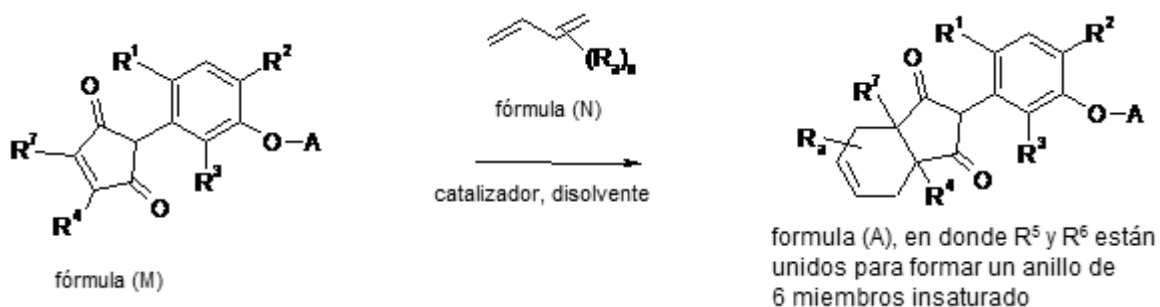
5 Por ejemplo, un compuesto de fórmula (M) se puede hacer reaccionar con un nucleófilo adecuado Nuc-H, opcionalmente en presencia de una base adecuada y un disolvente adecuado, para dar compuestos de fórmula (A), en donde R⁵ es el grupo Nuc que resulta del ataque nucleofílico y R⁶ es hidrógeno.



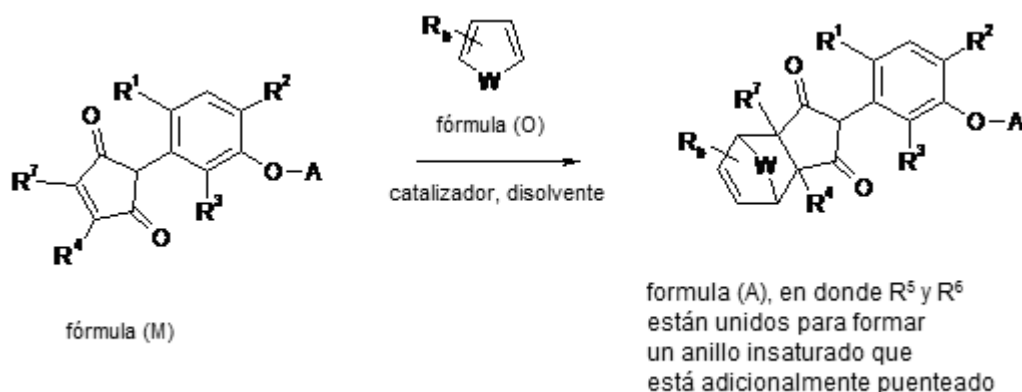
10 Nucleófilos adecuados, Nuc-H, incluyen, a modo no taxativo, alquilC₁-C₆tiolos opcionalmente sustituidos, ariltiols opcionalmente sustituidos, heteroariltiols opcionalmente sustituidos, alcoholes de alquiloC₁-C₆ opcionalmente sustituidos y alcoholes C₃-C₇ cíclicos opcionalmente sustituidos (incluidos alcoholes C₃-C₆ alicíclicos, alcoholes heterocíclicos de 4-6 miembros, fenoles y alcoholes heteroaromáticos).

15 Un compuesto de fórmula (M) también participará en reacciones de cicloadición bajo condiciones adecuadas para proporcionar compuestos adicionales de fórmula (A).

20 Por ejemplo, un compuesto de fórmula (M) puede hacerse reaccionar con un 1,3-dieno adecuado de fórmula (N), en donde R_a representa un sustituyente adecuado (tal como alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o tri-alquilo C₁-C₄ sililoxi) y n es 0, 1 o 2 bajo condiciones adecuadas para dar un compuesto de fórmula (A), en donde R⁵ y R⁶, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo de seis miembros insaturado.



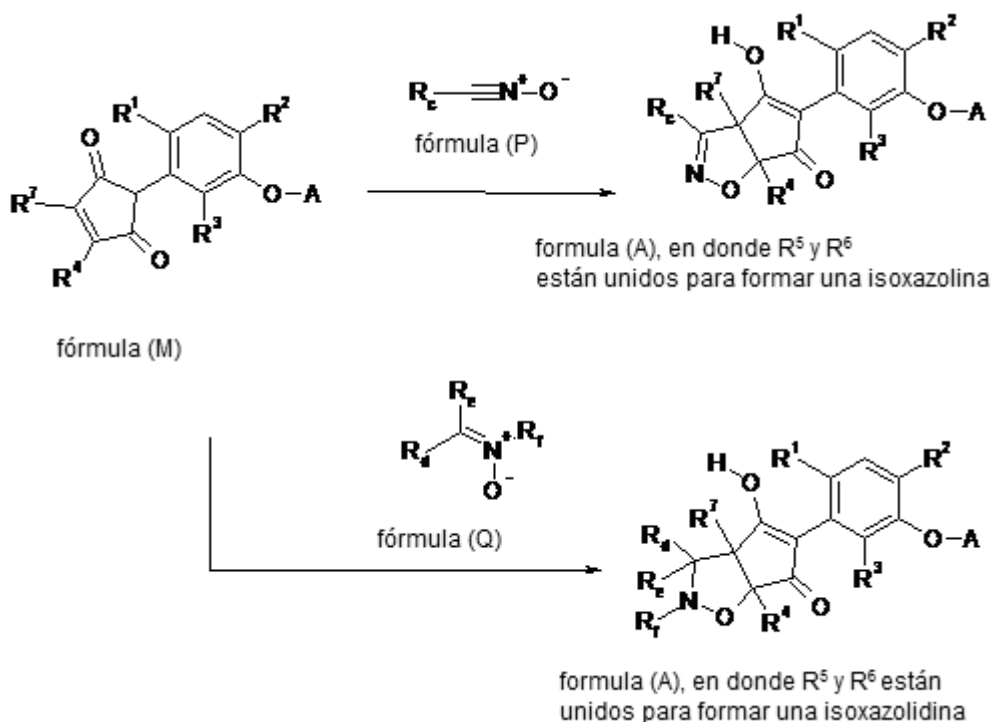
25 1,3-dienos adecuados incluyen 1,3-butadieno (o un equivalente, por ejemplo, 2,5-dihidrotiofeno-1,1-dióxido) y 1,3-butadienos sustituidos. De manera similar, un compuesto de fórmula (M) también se puede hacer reaccionar con dienos cíclicos de fórmula (O) tal como ciclopentadieno (W es -CH₂- y R_b es hidrógeno), ciclopentadienos sustituidos, ciclohexa-1,3-dieno (W es -CH₂-CH₂- y R_b es hidrógeno), ciclopentadienos sustituidos, furano (W es oxígeno y R_b es hidrógeno) y furanos sustituidos.



Los expertos en la técnica apreciarán que dienos cíclicos de fórmula (O) que portan una amplia diversidad de sustituyentes R_b sufrirán reacciones de cicloadición con un compuesto de fórmula (M) para dar nuevos compuestos de fórmula (A), bajo condiciones apropiadas (por ejemplo, en presencia o ausencia de catalizadores de ácidos de Lewis tales como cloruro de aluminio, cloruro de bismuto(III), trifluorometanosulfonato de bismuto(III), trifluoruro de boro, cloruro de cerio(III), trifluorometanosulfonato de cobre (I), cloruro de dietilaluminio, cloruro de hafnio(IV), cloruro de hierro(III), perclorato de litio, trifluorometanosulfonato de litio, bromuro de magnesio, yoduro de magnesio, trifluorometanosulfonato de escandio(III), cloruro de estaño(IV), cloruro de titanio(IV), isopropóxido de titanio(IV), trimetilaluminio, N-trimetilsilil-bis(trifluorometanosulfonil)imida, trifluorometano-sulfonato de trimetilsililo, trifluorometanosulfonato de iterbio(III), yoduro de zinc y cloruro de zirconio(IV), y en presencia o ausencia de disolventes tales como cloroformo, diclorometano, dietil-éter, etanol, metanol, alcanos perfluorados tales como perfluorohexano, tolueno, agua y líquidos iónicos tales como tetrafluoroborato de 1-butil-3-metilimidazolio y hexafluorofosfato de 1-butil-3-metilimidazolio, y a la presión atmosférica normal o bajo condiciones de alta presión), tal como se describe, por ejemplo, por G. Silvero *et al.*, *Tetrahedron* (2005), 61, 7105-7111; I. Hemeon *et al.*, *Synlett*, (2002), 11, 1815-1818; S. Otto y J. Engberts, *Pure Appl. Chem.* (2000), 72 (7), 1365-1372; R. Breslow, *Acc. Chem. Res.*, (1991), 24 (6), 159-164; K. Hara *et al.*, *Org. Lett.*, (2005), 7 (25), 5621-5623; J. Augé *et al.*, *Synlett*, (2000), 6, 877-879; B. Garrigues y A. Oussaid, *J. Organometallic Chem.*, (1989), 585, 253-255; B. Mathieu y L. Ghosez, *Tetrahedron Lett.*, (1997), 38 (31), 5497-5500; M. Ordoñez *et al.*, *Tetrahedron Asymmetry*, (1996), 7 (9), 2675-2686; S. Kobayashi *et al.*, *Tetrahedron Lett.*, (1993), 34 (23), 3755-3758; C. Cativiela *et al.*, U. Pindur *et al.*, *Chem. Rev.*, (1993), 93, 741-761; *Tetrahedron*, (1992), 48 (31), 6467-6476; J. Aubé *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.*, (1992), 114, 5466-5467; S. Danishefsky y M. Bednarski, *Tetrahedron Lett.*, (1985), 26 (21), 2507-2508 y referencias en ellas; Q. Chu, W. Zhang y D. Curran, *Tetrahedron Lett.*, (2006), 47, 9287-9290; K. Ishihara y K. Nakano, *J. Am. Chem. Soc.*, (2005), 127 (30), 10504-10505; y A. Northrup y D. MacMillan, (2002), *J. Am. Chem. Soc.*, 124 (11), 2458-2460).

La reacción de compuestos de fórmula (M) con compuestos de fórmula (N) o con compuestos de fórmula (O) proporciona compuestos de fórmula (A), en donde R⁵ y R⁶ están unidos para formar un anillo insaturado. Dichos compuestos son alquenos que pueden someterse a reacciones típicas de alquenos (por ejemplo reducción, halogenación o acoplamiento cruzado) para proporcionar compuestos adicionales de fórmula (A).

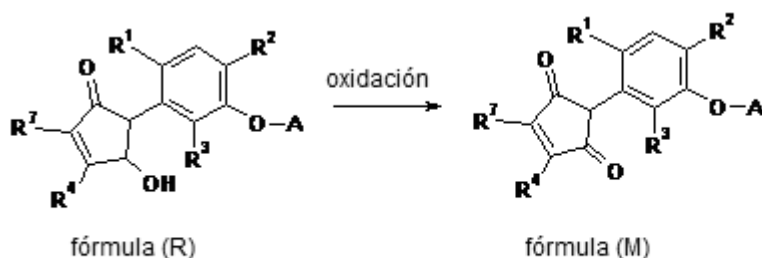
Un compuesto de fórmula (M) también puede actuar como un dipolarófilo y, por lo tanto, sufrirá una gama 3+2 de reacciones de cicloadición con reactivos dipolares adecuados bajo condiciones adecuadas. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (M) puede reaccionar con un óxido de nitrilo de fórmula (P), en donde R_c es un sustituyente adecuado (por ejemplo alquilo o arilo C₁-C₄), o con una nitrona de fórmula (Q), en donde R_e, R_f y R_g son sustituyentes adecuados (por ejemplo, hidrógeno o alquilo C₁-C₄), bajo condiciones apropiadas para dar compuestos adicionales de fórmula (A), en donde R⁴ y R⁷, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo de isoxazolina o isoxazolidona, respectivamente.



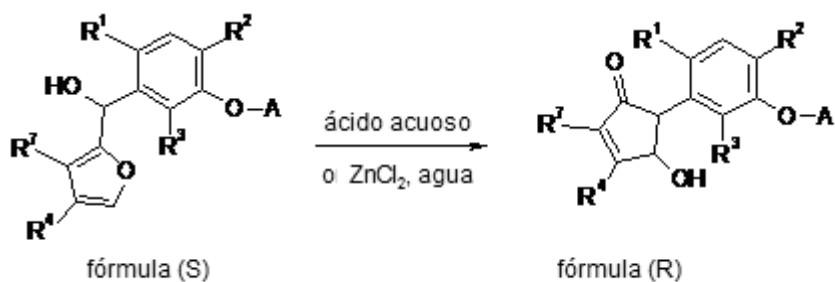
5 Condiciones adecuadas para efectuar 3+2 cicloadiciones se describen , por ejemplo, por L. Deng e Y. Hu, Synth. Commun. 2007), 37, 157-163; E. Kantorowski *et al.*, J. Org. Chem., (1998), 63, 5272-5274; y por V. Jäger e I. Müller, Tetrahedron (1985), 41 (17), 3519-3528.

10 Un compuesto de fórmula (M) se puede preparar oxidando un compuesto de formula (R) en un disolvente adecuado tal como tolueno, acetona, cloroformo, diclorometano o 1,4-dioxano. Una amplia gama de oxidantes es adecuada para efectuar esta transformación, incluyendo oxidantes inorgánicos tales como trióxido de cromo, dicromato de piridinio, dióxido de manganeso y alcóxidos de aluminio tal como isopropóxido de aluminio, así como oxidantes orgánicos tales como 2,3-dicloro-5,6-diciano-*p*-benzoquinona y oxidantes de yodo hipervalentes tales como 1,1,1-tris(acetiloxi)-1,1-dihidro-1,2-benziodoxol-3-(1H)-ona (peryodinano de Dess-Martin). Procedimientos adecuados se describen, por ejemplo, por K. Saito y H. Yamachika, documento US4371711, y por G. Piancatelli *et al.*, Tetrahedron (1978), 34, 2775.

15

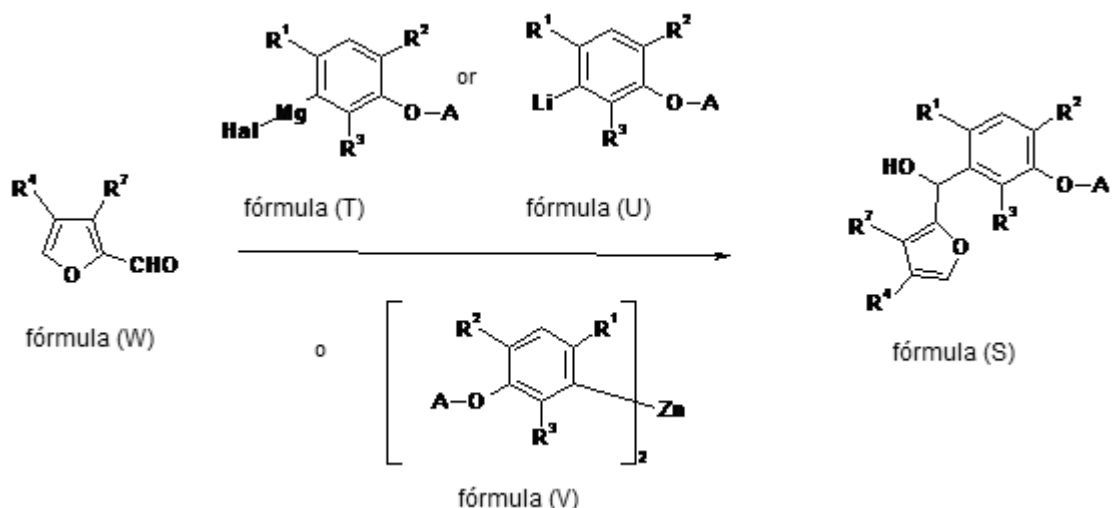


Un compuesto de fórmula (R) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (S) mediante tratamiento con un catalizador ácido adecuado en presencia de agua y, opcionalmente, en presencia de un disolvente adecuado.



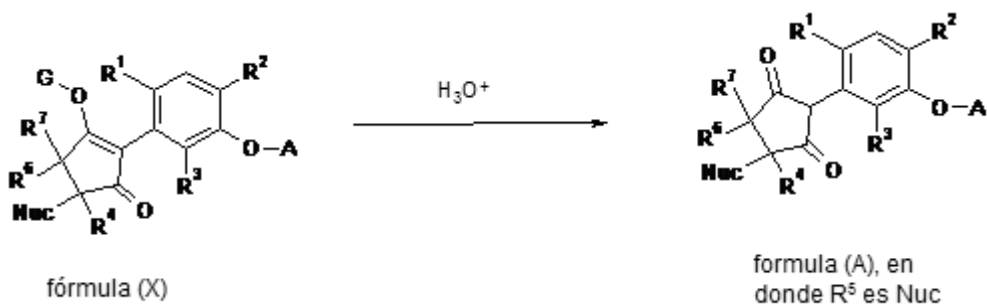
5 Por ejemplo, un compuesto de fórmula (S) se puede convertir en un compuesto de fórmula (R) en presencia de una disolución acuosa de un ácido tal como ácido fosfórico o ácido polifosfórico bajo condiciones descritas, por ejemplo, por K. Saito y H. Yamachika, documento US4371711. Alternativamente, se puede preparar un compuesto de fórmula (R) a partir de un compuesto de fórmula (S) mediante transposición en presencia de un catalizador de ácido de Lewis tal como cloruro de zinc de acuerdo con el procedimiento de G. Piancatelli *et al.*, Tetrahedron, (1978), 34, 2775.

10 Un compuesto de fórmula (S) se puede preparar mediante la adición de un reactivo organometálico adecuado tal como un haluro de arilmagnesio de fórmula (T), en donde Hal es un haluro tal como cloruro, bromuro o yoduro, o un reactivo de aril-litio de fórmula (U) o un reactivo de diarilzinc de fórmula (V) a un furan-2-carboxaldehído de fórmula (W) de acuerdo con procedimientos conocidos (véase, por ejemplo, G. Panda *et al.*, Tetrahedron Lett., (2005), 46, 3097).



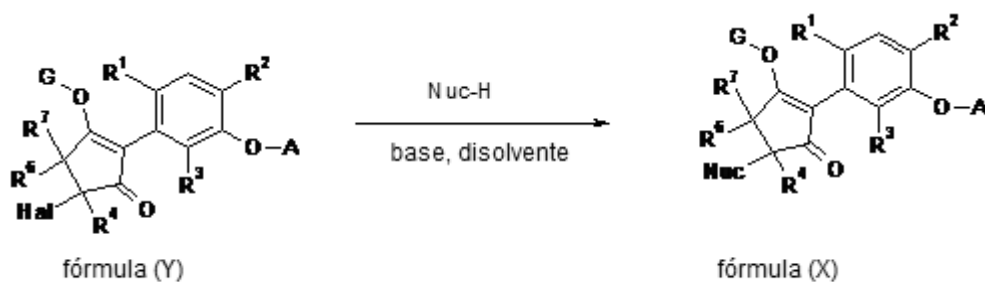
15 Los reactivos organometálicos de fórmula (T), fórmula (U) y fórmula (V) pueden prepararse por métodos conocidos a partir de un compuesto de fórmula (G).

20 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula (A), en donde R⁵ es Nuc (y Nuc es como se ha definido previamente) se pueden preparar mediante la hidrólisis de un compuesto de fórmula (X), que es un compuesto de fórmula I, en donde G es alquilo C₁-C₄, bajo condiciones ácidas.



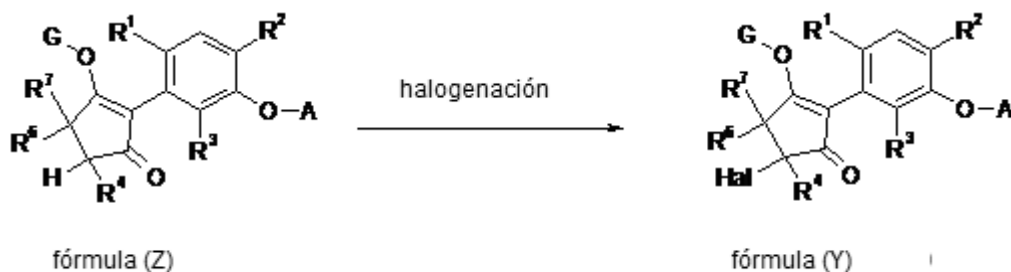
25 Un compuesto de fórmula (X) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (Y), que es un compuesto de fórmula I, en donde R⁵ es Hal y Hal es cloro, bromo o yodo, mediante tratamiento con un nucleófilo, Nuc-H, opcionalmente en presencia de una base adecuada y en un disolvente adecuado. Las condiciones adecuadas para

efectuar la sustitución nucleofílica se describen, por ejemplo, en J. March, *Advanced Organic Chemistry*, Tercera Edición, ed J. Wiley y Sons, 1985.



5

Un compuesto de fórmula (Y) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (Z), que es un compuesto de fórmula I, en donde R⁵ es H y G es alquilo C₁-C₄, mediante halogenación.



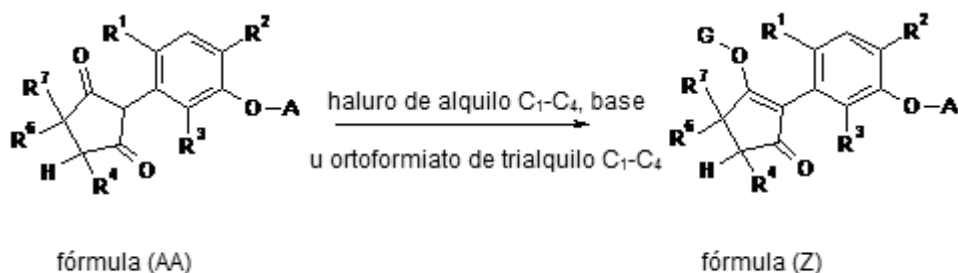
10

Por ejemplo, un compuesto de fórmula (Y), en donde Hal es cloro, se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (Z) con cloruro de cobre(II) y cloruro de litio de acuerdo con el procedimiento de E. Kosower *et al.*, *J. Org. Chem.*, (1963), 28, 630. Alternativamente, un compuesto de fórmula (Y), en donde Hal es bromo, se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (Z) con trifluorometanosulfonato de dibutilborilo y *N*-bromosuccinimida, por métodos similares a los descritos por P. Page *et al.*, *Tetrahedron* (1995), 51 (4), 1285-1294.

15

Un compuesto de fórmula (Z) se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula (AA) con un haluro de alquilo C₁-C₄ en presencia de una base y un disolvente o mediante reacción con un ortoformiato de tri-alquilo C₁-C₄ bajo condiciones similares a las descritas para la preparación de un compuesto de fórmula (K).

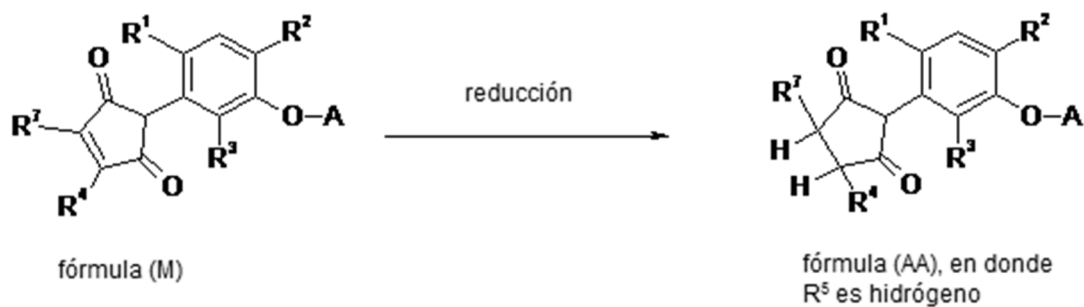
20



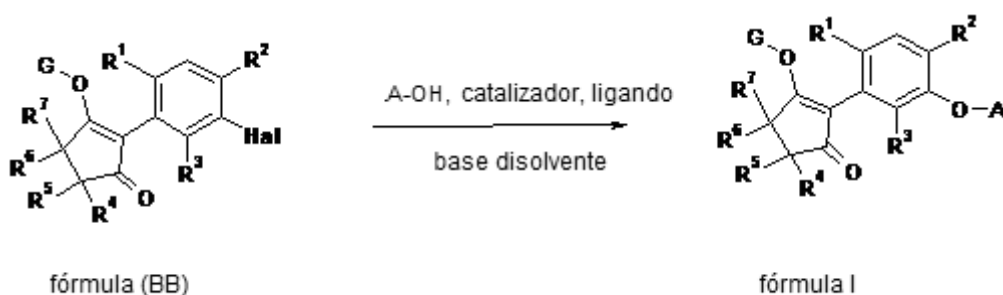
Un compuesto de fórmula (AA) es un compuesto de fórmula I, en donde R⁵ es hidrógeno, y se puede preparar por métodos descritos previamente para la preparación de un compuesto de fórmula (A).

25

Alternativamente, un compuesto de fórmula (AA), en donde R⁵ es hidrógeno, se puede preparar mediante reducción de un compuesto de fórmula (M), por ejemplo mediante hidrogenación catalítica, o mediante el uso de un metal adecuado (tal como zinc) en un disolvente adecuado (tal como ácido acético).



5 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula I se puede preparar mediante acoplamiento cruzado de un haluro de arilo de fórmula (BB), en donde Hal representa bromo o yodo, con un fenol, A-OH, en presencia de un catalizador adecuado, opcionalmente un ligando o aditivo adecuado, una base adecuada y un disolvente adecuado.

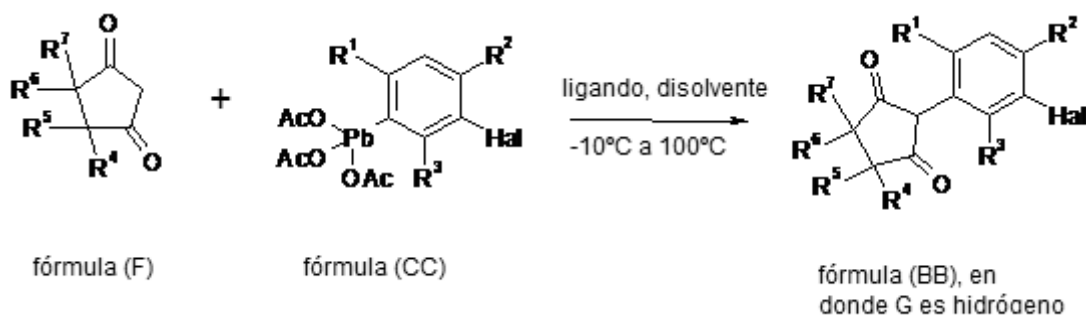


10 Condiciones adecuadas para efectuar este acoplamiento cruzado se describen, por ejemplo, por S. Hu *et al.*, J. Org. Chem., (2008), 73, 7814-7817; P. Chan *et al.*, Tetrahedron Lett., (2008), 49, 2018-2022; R. Hosseinzadeh *et al.*, Synthetic Commun., (2008) 38, 3023-3031; S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc., (2006), 128, 10694-10695; H. Rao *et al.*, Chem. Eur. J., (2006), 12, 3636-3646; M. Taillefer *et al.*, Adv. Synth. Catal. (2006), 348, 499-505; M. Beller *et al.*, Tetrahedron Lett., (2005), 46 (18), 3237-3240; M. Taillefer *et al.*, Org. Lett. (2004), 6 (6), 913; D. Ma y Q. Cai, Org. Lett. (2003), 5 (21), 3799-3802; J. Song *et al.*, Org. Lett. (2002), 4 (9), 1623-1626; R. Venkataraman *et al.*, Org. Lett. (2001), 3 (26), 4315-4317; S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc. (1999), 121, 4369-4378; S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc., (1997), 119, 10539-10540; G. Mann y J. Hartwig, Tetrahedron Lett., (1997), 38 (46), 8005-8008.

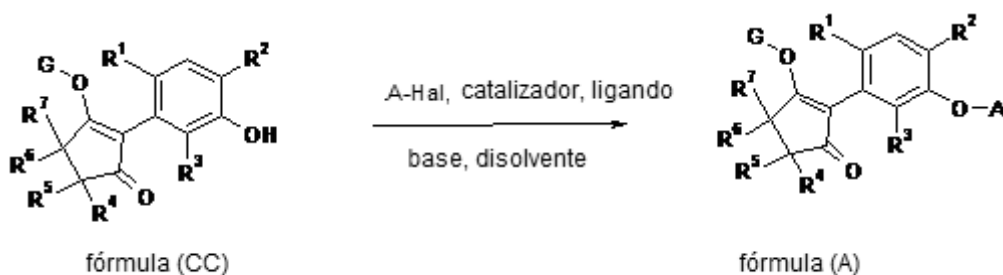
20 Catalizadores adecuados incluyen catalizadores de paladio y cobre tales como acetato de paladio(II), bis(dibenzilidenoacetona)paladio(II), polvo de cobre, acetato de cobre (II), cloruro de cobre(I), bromuro de cobre(I), bromuro de cobre(II), yoduro de cobre(I), óxido de cobre(I), sulfato de cobre(II), trifluorometanosulfonato de cobre(I) y trifluorometanosulfonato de cobre(II). Opcionalmente, los catalizadores se utilizan en unión con ligandos o aditivos apropiados tales como *N*-metilgliclina, *N,N*-dimetilgliclina, 1-butimidazol, acetato de etilo, diacetato de etilenglicol, 8-hidroxiquinolina, L-prolina, ácido 1-naftoico, trifenilfosfina, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, salicilaldoxima, 2-(*N,N*-dimetilamino)-2'-di-*terc*-butilfosfinobifenilo, neocuproina, monoéster fenílico de ácido pirrolidina-2-fosfónico, 2,2,6,6-tetrametilheptano-3,5-diona, bromuro de tetrabutilamonio, 2,2-bipiridina o 1,10-fenantrolina. Bases adecuadas son carbonato de cesio, fluoruro de cesio, fluoruro de potasio, fosfato potásico e hidróxido sódico. Disolventes adecuados son acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida, 1,4-dioxano o tolueno, o sistemas disolventes mixtos tales como tolueno / tetrahidrofurano y 1,4-dioxano / agua.

30 Se prefiere el uso de catalizadores de yoduro de cobre(I) y trifluorometanosulfonato de cobre(II).

35 Un compuesto de fórmula (BB) se puede preparar por uno de los métodos descritos previamente para la síntesis de un compuesto de fórmula (A), utilizando materiales de partida apropiados. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (F) y un reactivo arilado de fórmula (CC) bajo condiciones descritas previamente.

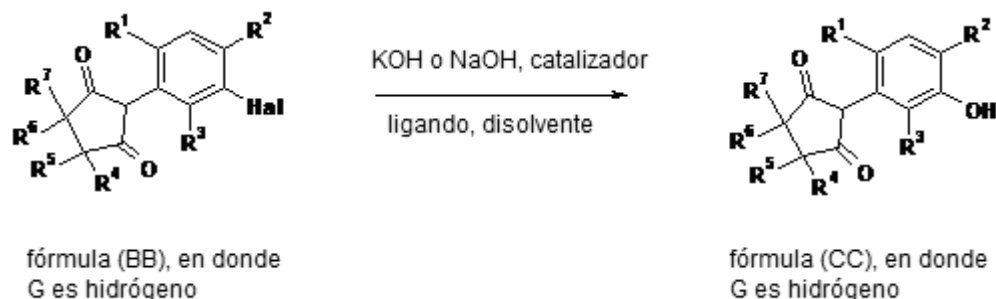


5 En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula I se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (CC) con un haluro de arilo o heteroarilo de fórmula A-Hal, en donde Hal representa flúor, cloro, bromo o yodo bajo condiciones apropiadas.



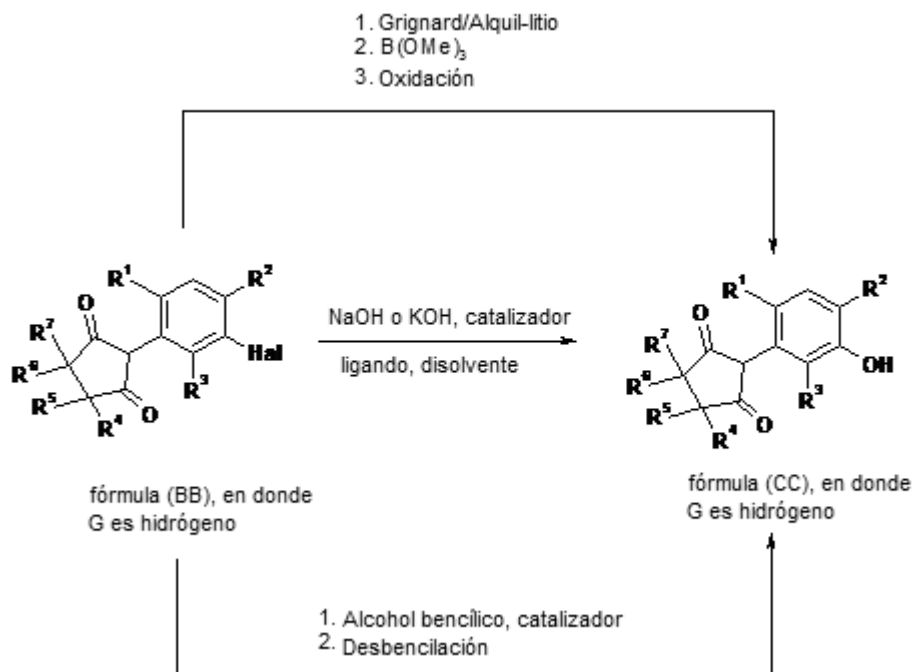
10 Cuando A-Hal es un bromuro de arilo o yoduro de arilo, la reacción se puede efectuar utilizando catalizadores adecuados de cobre o paladio bajo condiciones descritas previamente para la preparación de un compuesto de fórmula (A) a partir de un compuesto de fórmula (BB). Alternativamente, cuando A-Hal es un haluro de arilo adecuado, deficiente en electrones (por ejemplo un fluoruro de arilo o cloruro de arilo que porta adicionalmente uno o más sustituyentes sustractores de electrones tales como trifluorometilo, nitro o ciano), o un haluro de heteroarilo adecuado (por ejemplo una halopiridina o halopirimidina, haloquinolina, haloquinazolina o haloquinoxalina), la reacción se puede efectuar en presencia de una base adecuada tal como carbonato de potasio o carbonato de cesio, sin la necesidad de un catalizador y un ligando.

20 Un compuesto de fórmula (CC), en donde G es hidrógeno, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno.



25 En un enfoque, un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno, se desprotona con una base (tal como un reactivo de Grignard o reactivo de alquil-litio) y luego tratar con un reactivo de alquil-litio para efectuar el intercambio metal-halógeno. Las especies organometálicas resultantes pueden entonces convertirse en un compuesto de fórmula (CC) mediante transformación un borato de trialquilo tal como borato de trimetilo, seguido de oxidación (por ejemplo, mediante peróxido de hidrógeno, *N*-metilmorflina/*N*-óxido u oxona) tal como se describe, por ejemplo, por G. Prakash *et al.*, *J. Org. Chem.*, (2001), 66 (2), 633-634; J-P Gotteland y S Halazy, *Synlett.* (1995), 931-932; K. Webb y D. Levy, *Tetrahedron Lett.*, (1995), 36 (29), 5117-5118. En un enfoque alternativo, un compuesto de fórmula (CC), en donde G es hidrógeno, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno, mediante tratamiento con una disolución acuosa de un hidróxido de metal alcalino en presencia de un catalizador adecuado y un ligando adecuado, de acuerdo con procedimientos conocidos. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (CC), en donde G es hidrógeno, se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno, con hidróxido de potasio en presencia de un catalizador de paladio (por ejemplo,

bis(dibencilideno-acetona)paladio(II), y en presencia de un ligando de fosfina adecuado tal como 2-(di-*tert.*-butilfosfino)-2',4',6'-trisisopropilbifenilo y 2-(di-*tert.*-butilfosfino)-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-trisisopropilbifenilo bajo condiciones descritas, por ejemplo, por S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc., (2006), 128, 10694-10695. Alternativamente, un compuesto de fórmula (CC), en donde G es hidrógeno, se puede preparar tratando un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno, mediante tratamiento con una disolución acuosa de hidróxido de sodio, en presencia de un catalizador de cobre adecuado (por ejemplo yoduro de cobre (I)) y un ligando adecuado (tal como L-prolina), bajo condiciones descritas, por ejemplo, por C. Kormos y N. Leadbeater, Tetrahedron (2006), 62 (19), 4728-4732 .



En un tercer enfoque a un compuesto de fórmula (CC), en donde G es hidrógeno, un compuesto de fórmula (BB), en donde G es hidrógeno, se puede tratar con un alcohol bencilico en presencia de un catalizador de cobre adecuado, seguido de desbencilación bajo condiciones conocidas (por ejemplo, mediante hidrogenólisis catalítica). En un enfoque adicional, un compuesto de fórmula (CC) se puede preparar mediante la desprotección de un compuesto de fórmula (DD), en donde P es un grupo protector adecuado. Grupos protectores adecuados por fenoles y condiciones para la separación del grupo protector se describen, por ejemplo, por T. Green and P. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 3ª Edición, J. Wiley and Sons, (1999). Preferiblemente, el grupo protector P es un grupo bencilo.



Compuestos de fórmula (DD) se pueden preparar por uno o más de los métodos similares a los descritos arriba para la preparación de compuestos de fórmula I, utilizando materiales de partida apropiados y reactivos apropiados.

Los compuestos de la fórmula (M) y (CC) han sido particularmente diseñados como compuestos intermedios en la síntesis de los compuestos de fórmula I.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención se pueden utilizar como agentes protectores de cultivos en forma no modificada, según se obtienen en la síntesis, pero generalmente se formulan en composiciones para la protección de cultivos en una diversidad de formas, utilizando adyuvantes de la formulación tales como portadores, disolventes y sustancias tensioactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, por ejemplo en forma de polvos para espolvorear, geles, polvos humectables, gránulos revestidos o impregnados para la distribución manual o mecánica en sitios diana, gránulos dispersables en agua, gránulos solubles en agua, gránulos emulsionables, tabletas

dispersables en agua, tabletas comprimidas efervescentes, cintas solubles en agua, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua (EW) o de agua en aceite (WO), otros sistemas multifase tales como productos de aceite/agua/aceite y agua/aceite/agua, productos fluidos de aceite, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspoemulsiones, suspensiones en cápsula, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible en agua como portador), películas poliméricas impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo, a partir del Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5ª Edición, 1999. El principio activo se puede incorporar en microfibras o microvarillas formadas a partir de polímeros o monómeros polimerizables, y que tienen un diámetro de entre aproximadamente 0.1 y aproximadamente 50 micras, y una relación entre dimensiones de entre aproximadamente 10 y aproximadamente 1000. Tales formulaciones pueden utilizarse directamente o diluirse antes de usarlas. Pueden aplicarse posteriormente con un equipo de pulverización para la aplicación aérea o al suelo adecuada, u otro equipo de aplicación al suelo tal como sistemas de riego móviles centrales o medios de riego por goteo.

Las formulaciones diluidas se pueden preparar, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

Las formulaciones se pueden preparar, por ejemplo, mezclando el principio activo con adyuvantes de formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, soluciones, dispersiones o emulsiones. Los principios activos también pueden estar contenidos en microcápsulas finas constituidas por un núcleo y una cubierta polimérica. Las microcápsulas suelen tener un diámetro de 0.1 a 500 micras. Contienen principios activos en una cantidad comprendida entre aproximadamente un 25 y un 95% en peso del peso de la cápsula. Los principios activos pueden presentarse en forma de material técnico líquido, en forma de una solución adecuada, en forma de partículas finas en dispersión sólida o líquida, o como un sólido monolítico. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, gomas naturales o sintéticas, celulosa, copolímeros de estireno-butadieno u otro material que forme membranas adecuado similar, poliácridonitrilo, poliácridato, poliéster, poliamidas, poliureas, poliuretano, resinas aminoplast o almidón modificado químicamente, u otros polímeros con los que esté familiarizado un experto en la técnica a este respecto.

Alternativamente, es posible, para bien, formar las denominadas "microcápsulas", en donde el ingrediente activo está presente en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de una sustancia base, pero en ese caso la microcápsula no está encapsulada con una membrana limitante de difusión, tal como se esboza en el párrafo precedente.

Los principios activos se pueden adsorber en un portador poroso. Esto puede permitir que los principios activos se liberen en sus entornos en cantidades controladas (p. ej., liberación lenta).

Otras formas de formulaciones de liberación controlada son gránulos o polvos en los que el principio activo se dispersa o se disuelve en una matriz sólida constituida por un polímero, una cera o una sustancia sólida adecuada de peso molecular inferior. Polímeros adecuados son acetatos polivinílicos, poliestirenos, poliolefinas, alcoholes polivinílicos, pirrolidonas polivinílicas, pirrolidonas polivinílicas alquiladas, copolímeros de pirrolidonas polivinílicas y anhídrido maleico y ésteres y medio ésteres de los mismos, ésteres de celulosa químicamente modificados como carboximetilcelulosa, metilcelulosa, hidroxietil celulosa, ejemplos de ceras adecuadas son cera de polietileno, cera de polietileno oxidada, ceras de éster como ceras montana, ceras de origen natural como cera de carnauba, cera de candelilla, cera de abejas, etc.

Otros materiales para matriz adecuados para formulaciones de liberación lenta son almidón, estearina, lignina.

Los adyuvantes de la formulación, adecuados para la preparación de estas composiciones de acuerdo con la invención son conocidos *per se*.

Como portadores líquidos se pueden utilizar agua, disolventes aromáticos tales como tolueno, m-xileno, o-xileno, p-xileno y mezclas de los mismos, cumeno, mezclas de hidrocarburos aromáticos con intervalos de ebullición entre 140 y 320 °C conocidas bajo diversas marcas registradas tales como Solvesso®, Shellsol A®, Caromax®, Hydrosol®, portadores parafínicos e isoparafínicos tales como aceites de parafina, aceites minerales, disolventes hidrocarbonados desaromatizados con intervalos de ebullición entre 50 y 320°C, conocidos, por ejemplo, bajo la marca registrada Exxsol®, disolventes hidrocarbonados no desaromatizados con intervalos de ebullición entre 100 y 320 °C, conocidos bajo la marca registrada Varsol®, disolventes isoparafínicos con intervalos de ebullición entre 100 y 320 °C, conocidos bajo marcas registradas tales como Isopar® o Shellsol T®, hidrocarburos tales como ciclohexano, tetrahidronaftaleno (tetralina), decahidronaftaleno, alfa-pineno, d-limoneno, hexadecano, isooctano, disolventes éster tales como acetato de etilo, acetato de *n*/*i*-butilo, acetato de amilo, acetato de *i*-bornilo, acetato de 2-etilhexilo, ésteres alquílicos C₆ – C₁₈ del ácido acético, conocidos bajo la marca registrada Exxate®, éster etílico del ácido láctico, éster propílico del ácido láctico, éster butílico del ácido láctico, benzoato de bencilo, lactato de bencilo, lactato de dipropilenglicol, ésteres dialquílicos del ácido succínico, maleico y fumárico y disolventes polares tales como *N*-metilpirrolidona, *N*-etilpirrolidona, pirrolidonas de alquilo C₃-C₁₈, gamma-butirolactona, dimetilsulfóxido, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N,N*-dimetilactamida, dimetilamidas de ácidos grasos C₄-C₁₈, dimetilamida del ácido benzoico, acetonitrilo, acetona, metil-eti-cetona, metil-isobutil-cetona, isoamil-cetona, 2-heptanona, ciclohexanona, isoforona, metil-isobutenil-cetona (óxido de mesitilo), acetofenona, carbonato de etileno, carbonato de propileno, carbonato de butileno,

diluyentes y disolventes alcohólicos tales como metanol, etanol, propanol, *n*/*iso*-butanol, *n*/*iso*-pentanol, 2-etil hexanol, *n*-octanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, 2-metil-2,4-pentanodiol, 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, ciclohexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, etilenglicol butil éter, etilenglicol metil éter, dietilenglicol, dietilenglicol butil éter, dietilenglicol etil

- éter, dietilenglicol metil éter, propilenglicol, dipropilenglicol, dipropilenglicol metil éter y otros disolventes de glicol éter en base a materias primas de etilenglicol, propilenglicol y butilenglicol, trietilenglicol, polietilenglicol (PEG 400), polipropilenglicoles con masas moleculares de 400 - 4000, glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, 1,4-dioxano, abietato de dietilenglicol, clorobenceno, clorotolueno, ésteres de ácido graso tales como octanoato de metilo, miristato de isopropilo, laurato de metilo, oleato de metilo, mezcla de éster metílico de ácidos grasos C₈-C₁₀, ésteres de metilo y etilo de aceite de soja, ésteres de metilo y etilo de aceite de soja, aceites vegetales, ácidos grasos tal como ácido oleico, ácido linoleico, ácido linolénico, ésteres de ácido fosfórico y fosfónico tales como trietil fosfato, tris-alkiloC₃-C₁₈ fosfatos, alquilaryl fosfatos, bis-octil-octil fosfonatos.
- 5
- 10 Generalmente el portador de elección para la dilución de los concentrados es agua.
- Los vehículos sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla de pirofilita, (sílice pirógena o precipitada y opcionalmente funcionalizada o tratada, por ejemplo, silanizada), arcilla de atapulgita, tierra de diatomeas, caliza, carbonato de calcio, bentonita, montmorillonita de calcio, cascarillas de semilla de algodón, harina de trigo, 15 harina de semillas de soja, piedra pómez, aserrín, cáscara de nogal, lignina y materiales similares, como se describe, por ejemplo, en EPA CFR 180.1001. (c) y (d). También pueden utilizarse fertilizantes en polvo o granulados como portadores sólidos.
- 20 Se puede utilizar un gran número de sustancias tensioactivas tanto en formulaciones sólidas como líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que se pueden diluir con un portador antes del uso. Las sustancias tensioactivas pueden ser aniónicas, catiónicas, anfóteras, no iónicas o poliméricas y se pueden utilizar como agentes emulsionantes, humectantes, dispersantes o de suspensión, o con otros fines. Sustancias tensioactivas típicas incluyen, por ejemplo, sales de sulfatos de alquilo tales como lauril-sulfato de dietanolamónio; lauril-sulfato de sodio, sales de alquilarilsulfonatos tales como dodecibencenosulfonato de calcio o sodio; productos de adición de alquilfenol-óxido de 25 alquileno tales como etoxilatos de nonilfenol; productos de adición de alcohol-óxido de alquileno tales como etoxilato de alcohol tridecílico; jabones tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalensulfonatos tales como dibutilnaftalensulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales sulfosuccinato tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato de sodio; ésteres de sorbitol tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias tales como cloruro de lauril-trimetilamónio, ésteres de polietilenglicol de ácidos grasos tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloques de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de mono- y di-alkilfosfato; y también sustancias adicionales descritas, p. ej., en "McCUTCHEON'S Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1981.
- 30 Otros adyuvantes que pueden utilizarse habitualmente en formulaciones pesticidas incluyen, inhibidores de cristalización, sustancias modificadoras de viscosidad, agentes de suspensión, tintes, antioxidantes, agentes espumantes, absorbedores de luz, auxiliares de mezcla, antiespumantes, agentes de complejación, sustancias y tampones que neutralizan o modifican el pH, inhibidores de corrosión, fragancias, agentes humectantes, mejoradores de absorción, micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas y agentes de compatibilidad y solubilizantes y también fertilizantes líquidos y sólidos.
- 35 Las formulaciones también pueden comprender sustancias activas adicionales, por ejemplo, otros herbicidas, protectores contra herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas.
- 40 Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir además un aditivo (denominado habitualmente adyuvante) que comprenda un aceite mineral, un aceite de origen animal o vegetal, ésteres alquílicos de tales aceites o mezclas de tales aceites y derivados oleosos. La cantidad de aditivo oleoso utilizada en la composición de acuerdo con la invención está comprendida generalmente entre un 0.01 y un 10%, respecto a la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso se puede añadir a un tanque de pulverización con la concentración deseada después de haber preparado una mezcla de pulverización. Aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionable tal como 45 AMIGO® (Loveland Products Inc.), ésteres alquílicos de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados de metilo, o un aceite de origen animal tal como aceite de pescado y sebo de bovino. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos, esencialmente 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de colza metilado, y también 5% en peso de emulsionantes y modificadores del pH habituales. Los aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden ésteres alquílicos de ácidos grasos C₈-C₂₂, siendo especialmente importantes los derivados metílicos de ácidos grasos C₁₂-C₁₈, por ejemplo, los ésteres metílicos del ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico. Estos ésteres se conocen como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de éster metílico de ácido graso es AGNIQUE ME 18 RD-F® (Cognis). Estos y otros derivados oleosos también se encuentran en el Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ª edición, 50 Universidad del Sur de Illinois, 2000.
- 55 La aplicación y la acción de los aditivos oleosos se pueden mejorar además combinándolos con sustancias tensioactivas tales como surfactantes no iónicos, aniónicos, catiónicos o anfóteros. En las páginas 7 y 8 de WO97/34485 se enumeran ejemplos de surfactantes aniónicos, no iónicos, catiónicos o anfóteros adecuados. Las sustancias tensioactivas preferidas son surfactantes aniónicos del tipo dodecibencilsulfonato, especialmente sus sales de calcio, y también surfactantes no iónicos del tipo alcohol graso etoxilado. Se prefieren especialmente los alcoholes 60 grasos C₁₂-C₂₂ etoxilados con un grado de etoxilación comprendido entre 5 y 40. Algunos ejemplos de surfactantes que
- 65

se pueden adquirir de proveedores comerciales son los de tipo Genapol (Clariant). También se prefieren tensioactivos de silicona, especialmente heptametilsiloxanos modificados con poli(óxido de alquilo) que están comercialmente disponibles, p. ej., como SILWET L-77®, y también tensioactivos perfluorados. La concentración de sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total está comprendida generalmente entre un 1 y un 50% en peso. Algunos ejemplos de aditivos oleosos que están constituidos por mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de estos con surfactantes son TURBOCHARGE®, ADIGOR® (ambos de Syngenta Crop Protection AG), ACTIPRON® (BP Oil UK Limited), AGRI-DEX® (Helena Chemical Company).

Dichas sustancias tensioactivas también se pueden utilizar en las formulaciones solas, es decir, sin aditivos oleosos. Además, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/surfactante puede contribuir a una mejora adicional de la acción. Algunos disolventes adecuados son, por ejemplo, los disolventes SOLVESSO® y AROMATIC® (Exxon Corporation). La concentración de tales disolventes puede estar comprendida entre un 10 y un 80% en peso del peso total. Tales aditivos oleosos, que pueden estar mezclados con disolventes, se describen, por ejemplo, en US 4 834 4834908. Un aditivo oleoso que se puede adquirir de proveedores comerciales descrito en el citado documento se conoce con el nombre de MERGE® (BASF). Otros aditivos oleosos que se prefieren de acuerdo con la invención son SCORE® y ADIGOR® (ambos de Syngenta Crop Protection AG).

Además de los aditivos oleosos enumerados anteriormente, para mejorar la actividad de las composiciones de acuerdo con la invención también es posible añadir formulaciones de alquilpirrolidonas (p. ej., AGRIMAX® de ISP) a la mezcla de pulverización. También se pueden utilizar formulaciones de látices sintéticos tales como, por ejemplo, poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-p-menteno (p. ej., BOND®, COURIER® o EMERALD®). Tales aceites adyuvantes, tal como se han descrito en los párrafos anteriores, se pueden emplear como el líquido portador en el que un compuesto activo se disuelve, emulsiona o dispersa, según sea adecuado para la forma física del compuesto activo.

Las formulaciones pesticidas generalmente comprenden entre un 0.1 y un 99% en peso, especialmente entre un 0.1 y un 95% en peso, de un compuesto de fórmula I, y entre un 1 y un 99.9% en peso de un adyuvante de formulación que incluye preferentemente entre un 0 y un 25% en peso de una sustancia tensioactiva. Aunque los productos comerciales se formularán preferentemente como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

La tasa de aplicación de los compuestos de fórmula I puede variar dentro de límites amplios y depende de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (pre- o posemergencia; revestimiento de semillas; aplicación a los surcos de las semillas; aplicación que no sea de labranza, etc.), la planta de cultivo, la maleza o hierba que se desee controlar, las condiciones climáticas predominantes y otros factores determinados por el método de aplicación, el tiempo de aplicación y el cultivo deseado. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención se aplican generalmente a una tasa de 1- 2000 g/ha, preferiblemente 1- 1000 g / ha y lo más preferiblemente a 1- 500 g / ha.

Formulaciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones representativas: (% = porcentaje en peso):

<u>Concentrados emulsionables:</u>	
principio activo:	de un 1 a un 95%, preferentemente de un 60 a un 90%
agentes tensioactivos:	de un 1 a un 30%, preferentemente de un 5 a un 20%
disolventes como portador líquido:	de un 1 a un 80%, preferentemente de un 1 a un 35%
<u>Polvos:</u>	
principio activo:	de un 0.1 a un 10%, preferentemente de un 0.1 a un 5%
portadores sólidos:	de un 99.9 a un 90%, preferentemente de un 99.9 a un 99%
<u>Concentrados en suspensión:</u>	
principio activo:	de un 5 a un 75%, preferentemente de un 10 a un 50%
agua:	de un 94 a un 24%, preferentemente de un 88 a un 30%
agentes tensioactivos:	de un 1 a un 40%, preferentemente de un 2 a un 30%
<u>Polvos humectables:</u>	
principio activo:	de un 0.5 a un 90%, preferentemente de un 1 a un 80%
agentes tensioactivos:	de un 0.5 a un 20%, preferentemente de un 1 a un 15%
portadores sólidos:	de un 5 a un 95%, preferentemente de un 15 a un 90%
<u>Gránulos:</u>	
principio activo:	de un 0.1 a un 30%, preferentemente de un 0.1 a un 15%
portadores sólidos:	de un 99.5 a un 70%, preferentemente de un 97 a un 85%
<u>Gránulos dispersables en agua:</u>	
principio activo:	de un 1 a un 90%, preferentemente de un 10 a un 80%
agentes tensioactivos:	de un 0.5 a un 80%, preferentemente de un 5 a un 30%
portadores sólidos:	de un 90 a un 10%, preferentemente de un 70 a un 30%

Los siguientes Ejemplos ilustran la invención adicionalmente pero sin limitarla.

<u>F1 Concentrados emulsionables</u>	a)	b)	c)	d)
componente activo	5 %	10 %	25 %	50 %
dodecibenceno-sulfonato de calcio	6 %	8 %	6 %	8 %
éter de aceite de ricino poliglicólico (36 moles de óxido de etileno)	4 %	-	4 %	4 %
éter octilfenol poliglicólico (7-8 mol de óxido de etileno)	-	4 %	-	2 %
NMP	-	10 %	-	20 %
mezcla de hidrocarburos arom. C ₉ -C ₁₂	85 %	68 %	65 %	16 %

Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados diluyendo con agua.

<u>F2 Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	10 %	50 %	90 %
1-metoxi-3-(3-metoxi-propoxi)-propano	40 %	50 %	-	-
polietilenglicol PM 400	20 %	10 %	-	-
NMP	-	-	50 %	10 %
mezcla de hidrocarburos arom. C ₉ -C ₁₂	35 %	30 %	-	-

5 Las soluciones son adecuadas para la aplicación sin diluir o después de diluirlas en agua.

<u>F3 Polvos humectables</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	25 %	50 %	80 %
lignosulfonato de sodio	4 %	-	3 %	-
laurilsulfato de sodio	2 %	3 %	-	4 %
diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6 %	5 %	6 %
éter octilfenol poliglicólico (7-8 mol de óxido de etileno)	-	1 %	2 %	-
ácido silícico muy disperso	1 %	3 %	5 %	10 %
caolín	88 %	62 %	35 %	-

10 El principio activo se mezcla exhaustivamente con los adyuvantes y la mezcla se muele exhaustivamente en un molino adecuado para obtener polvos humectables que se pueden diluir con agua para obtener suspensiones de cualquier concentración deseada.

<u>F4 Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo	0,1 %	5 %	15 %
sílice muy dispersa	0,9 %	2 %	2 %
portador inorgánico (diámetro de 0.1-1 mm), p. ej., CaCO ₃ o SiO ₂	99,0 %	93 %	83 %

15 El principio activo se disuelve en cloruro de metileno, la solución se pulveriza sobre el portador y el disolvente se evapora subsiguientemente *in vacuo*.

<u>F5 Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo	0,1 %	5 %	15 %
polietilenglicol PM 200	1,0 %	2 %	3 %
sílice muy dispersa	0,9 %	1 %	2 %
portador inorgánico (diámetro de 0.1-1 mm), p. ej., CaCO ₃ o SiO ₂	98,0 %	92 %	80 %

20 El principio activo finamente molido se aplica de forma uniforme, en una mezcladora, sobre el portador humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen gránulos recubiertos que no generan polvo.

<u>F6 Gránulos extrudidos</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	0,1 %	3 %	5 %	15 %
lignosulfonato de sodio	1,5 %	2 %	3 %	4 %
carboximetilcelulosa	1,4 %	2 %	2 %	2 %
caolín	97,0 %	93 %	90 %	79 %

El principio activo se mezcla y muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extrude y después se seca con una corriente de aire.

<u>F7 Gránulos dispersables en agua</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	10 %	40 %	90 %
lignosulfonato de sodio	20 %	20 %	15 %	7 %
naftalenosulfonato de dibutilo	5 %	5 %	4 %	2 %
goma arábica	2 %	1 %	1 %	1 %
diatomita	20 %	30 %	5 %	-
sulfato de sodio	-	4 %	5 %	-

caolín 48 % 30 % 30 %

El principio activo se mezcla y muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extrude y después se seca con una corriente de aire.

F8 Polvos espolvoreables

ingrediente activo	a)	b)	c)
talco	0,1 %	1 %	5 %
caolín	39,9 %	49 %	35 %
	60,0 %	50 %	60 %

5

Polvos espolvoreables listos para el uso se obtienen mezclando el ingrediente activo con los portadores y moliendo la mezcla en un molino adecuado.

F9 Concentrados en suspensión

ingrediente activo	a)	b)	c)	d)
propilenglicol	3 %	10 %	25 %	50 %
éter nonilfenol poliglicólico (15 moles de óxido de etileno)	5 %	5 %	5 %	5 %
lignosulfonato de sodio	-	1 %	2 %	-
heteropolisacárido (xantano)	3 %	3 %	7 %	6 %
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,2 %	0,2 %	0,2 %	0,2 %
emulsión de aceite de silicona	0,1 %	0,1 %	0,1 %	0,1 %
agua	0,7 %	0,7 %	0,7 %	0,7 %
	87 %	79 %	62 %	38 %

10

Se crea una mezcla íntima del principio activo finamente molido y los adyuvantes para obtener un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden preparar suspensiones de cualquier concentración deseada por dilución con agua.

15

Los cultivos de plantas útiles en los que se pueden utilizar las composiciones de acuerdo con la invención incluyen especialmente cereales, en particular trigo y cebada, arroz, maíz, colza, remolacha azucarera, caña de azúcar, soja, algodón, girasol, cacahuete y cultivos de plantación.

20

Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO y HPPD) como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que ha sido modificado para que sea tolerante, p. ej., a imidazolinonas, tales como imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo es la colza de verano Clearfield® (canola). Los ejemplos de cultivos que se han modificado para que sean tolerantes a herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen, p. ej., variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato, comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®. Las malezas a controlar pueden ser malezas tanto monocotiledóneas como dicotiledóneas tales como, por ejemplo, Stellaria, Nasturtium, Agrostis, Digitaria, Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola y Veronica. El control de malezas monocotiledóneas, en particular *Agrostis*, *Avena*, *Setaria*, *Lolium*, *Echinochloa*, *Bromus*, *Alopecurus* y *Sorghum*, está ampliamente difundido.

30

Los cultivos también se han de entender como los que se han vuelto resistentes a insectos nocivos por métodos de ingeniería genética, por ejemplo maíz Bt (resistente al barrenador del maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo de la cápsula del algodón) y también patatas Bt (resistente al escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos del maíz Bt-176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína producida de manera natural por la bacteria del suelo *Bacillus thuringiensis*. En los documentos EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427 529 se describen ejemplos de toxinas y plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas. Algunos ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican resistencia a un insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y el material de las semillas de estas pueden ser resistentes a herbicidas y al mismo tiempo a insectos que se alimentan de ellas (eventos transgénicos "combinados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 activa como insecticida y al mismo tiempo ser tolerantes a glifosato. El término "cultivos" se debe sobreentender como que incluye también cultivos obtenidos como resultado de métodos convencionales de ingeniería de cultivo o genética que contienen los denominados rasgos de producción (p. ej., sabor mejorado, estabilidad al almacenamiento, contenido nutritivo).

45

Se debe sobreentender que las áreas cultivadas incluyen terrenos en los que las plantas de cultivo ya se han cultivado así como también terrenos destinados al cultivo de tales plantas de cultivo.

50

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también se pueden utilizar en combinación con herbicidas adicionales. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I es uno de los compuestos descritos en las

Tablas 1 a 39 más adelante. Son especialmente importantes las siguientes mezclas del compuesto de fórmula I:

5 compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfén-sodio, compuesto de fórmula I + aclonifén, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopyralid, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de fórmula I + anilofós, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benzazolina, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzofendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafós, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + borax, compuesto de fórmula I + bromacilo, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + butamifós, compuesto de fórmula I + butralina, compuesto de fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + clorflurenol, compuesto de fórmula I + clorflurenol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + clorimurón, compuesto de fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + clortal, compuesto de fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + ortodichlorobenceno, compuesto de fórmula I + para-dichlorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclorprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenicán, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrina, compuesto de fórmula I + dimetenamida, compuesto de fórmula I + dimetenamida-P, compuesto de fórmula I + dimetipina, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarsínico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamida, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diurón, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfuralina, compuesto de fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifeno, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula I + etobenzanida, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fenoxasulfona (CAS RN 639826-16-7), compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop-P, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloralina, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofén, compuesto de fórmula I + fluoroglicofén-etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula I + fomesafén, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amonio, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula I + HC-252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de

fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquina, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofán, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + ioxinilo, compuesto de fórmula I + ipfencarbazona (CAS RN 212201-70-2), compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + isourón, compuesto de fórmula I + isoxabeno, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofeno, compuesto de fórmula I + lenacilo, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metazosulfurona (NC-620, CAS RN 868680-84-6), compuesto de fórmula I + metabenziazurona, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S-metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalina, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazón, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfén, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamida, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafén, compuesto de fórmula I + pinoxadén, compuesto de fórmula I + piperofós, compuesto de fórmula I + arsenito de potasio, compuesto de fórmula I + azida de potasio, compuesto de fórmula I + pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluazol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propirisulfurona (TH-547, CAS RN 570415-88-2), compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraclonilo, compuesto de fórmula I + piraflufén, compuesto de fórmula I + piraflufén-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifén, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piriftalida, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfán, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quinclorac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quincloamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito de sodio, compuesto de fórmula I + azida de sodio, compuesto de fórmula I + clorato de sodio, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio, compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacilo, compuesto de fórmula I + terbumetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + trialato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopír, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético (CAS RN 353292-31-6), compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofeno-3-carboxílico (BAY636), compuesto de fórmula I + BAY747 (CAS RN 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topramezona (CAS RN 210631-68-8), Compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (CAS RN 352010-68-

5), Compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

5 Los componentes de las mezclas que acompañan al compuesto de fórmula I también pueden encontrarse en forma de ésteres o sales, tal como se menciona, p. ej., en The Pesticide Manual, 12.ª Edición (BCPC), 2000.

En concreto, son importantes las siguientes mezclas: compuesto de fórmula (I) + ametrina, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopyralid, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenicán, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + ioxinilo, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + picolinafén, compuesto de fórmula I + pinoxadén, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + pirasulfotol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piroxasulfona (KIH-485), compuesto de fórmula I + piroxsulam, compuesto de fórmula I + sulfosulfurona, compuesto de fórmula I + tembotriona, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tiencarbazona, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + topamezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + trialato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + trinexapac-etilo y compuesto de fórmula I + tritosulfurona, en que las mezclas comprenden compuesto de fórmula (I) + amidosulfurona, compuesto de fórmula (I) + aminopiridina, compuesto de fórmula (I) + beflubutamida, compuesto de fórmula (I) + bromoxinilo, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona, compuesto de fórmula (I) + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula (I) + clorotolurón, compuesto de fórmula (I) + clorsulfurón, compuesto de fórmula (I) + clodinafop, compuesto de fórmula (I) + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula (I) + clopiralida, 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + difenzoquat, compuesto de fórmula (I) + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula (I) + diflufenicán, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de fórmula (I) + flucarbazona, compuesto de fórmula (I) + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula (I) + flufenacet, compuesto de fórmula (I) + flupirsulfurón, compuesto de fórmula (I) + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula (I) + fluroxipir, compuesto de fórmula (I) + flurtamona, compuesto de fórmula (I) + yodosulfurón, compuesto de fórmula (I) + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mesosulfurón, compuesto de fórmula (I) + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + picolinafeno, compuesto de fórmula (I) + pinoxadeno, compuesto de fórmula (I) + prosulfocarb, compuesto de fórmula (I) + pirasulfotol, compuesto de fórmula (I) + piroxasulfona (KIH-485), compuesto de fórmula (I) + piroxsulam, compuesto de fórmula (I) + sulfosulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón, compuesto de fórmula (I) + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + tralkoxidim, compuesto de fórmula (I) + triasulfurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón, compuesto de fórmula (I) + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + trifluralina, compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo y compuesto de (fórmula (I) + tritosulfurona. son particularmente preferidos.

En concreto, son importantes las siguientes mezclas: compuesto de fórmula (I) + ametrina, compuesto de fórmula (I) + bensulfurón, compuesto de fórmula (I) + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + benzobiciclón, compuesto de fórmula (I) + benzofenap, compuesto de fórmula (I) + bispiribac, compuesto de fórmula (I) + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula (I) + butaclor, compuesto de fórmula (I) + cafenstrol, compuesto de fórmula (I) + cinosulfurón, compuesto de fórmula (I) + clomazona, compuesto de fórmula (I) + clomeprop, compuesto de fórmula (I) + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula (I) + cihalofop, compuesto de fórmula (I) + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + daimurona, compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + diquat, compuesto de fórmula (I) + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula (I) + espocarb, compuesto de fórmula (I) + etoxisulfurón, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fenoxasulfona (CAS RN 639826-16-7), compuesto de fórmula (I) + fentrazamida, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de

fórmula (I) + glufosinato-amonio, compuesto de fórmula (I) + glifosato, compuesto de fórmula (I) + halosulfurón, compuesto de fórmula (I) + halosulfurona-metilo, compuesto de fórmula (I) + imazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + ipfencarbazona (CAS RN 212201-70-2), compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mefenacet, compuesto de fórmula (I) + mesotriona, compuesto de fórmula (I) + metamifop, compuesto de fórmula (I) + metazosulfurona (NC-620, CAS RN 868680-84-6), compuesto de fórmula (I) + metsulfurona, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + n-metil-glifosato, compuesto de fórmula (I) + ortosulfamurón, compuesto de fórmula (I) + orizalina, compuesto de fórmula (I) + oxadiargilo, compuesto de fórmula (I) + oxadiazón, compuesto de fórmula (I) + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + penoxsulam, compuesto de fórmula (I) + pretilaclor, compuesto de fórmula (I) + profoxidim, compuesto de fórmula (I) + propanilo, compuesto de fórmula (I) + propirisulfurona (TH-547, CAS RN 570415-88-2), compuesto de fórmula (I) + pirazolinato, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula (I) + pirazoxifeno, compuesto de fórmula (I) + piribenzoxim, compuesto de fórmula (I) + piriftalida, compuesto de fórmula (I) + piriminobac, compuesto de fórmula (I) + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula (I) + pirimisulfán, compuesto de fórmula (I) + quinclorac, compuesto de fórmula (I) + tefuriltriona, compuesto de fórmula (I) + triasulfurón y compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo, en que las mezclas que comprenden compuesto de fórmula (I) + azimsulfurona, compuesto de fórmula (I) + bensulfurón, compuesto de fórmula (I) + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + benzobiciclón, compuesto de fórmula (I) + benzofenap, compuesto de fórmula (I) + bispiribac, compuesto de fórmula (I) + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula (I) + clomazona, compuesto de fórmula (I) + clomeprop, compuesto de fórmula (I) + cihalofop, compuesto de fórmula (I) + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de fórmula (I) + daimurona, compuesto de fórmula (I) + dicamba, compuesto de fórmula (I) + esprocarb, compuesto de fórmula (I) + etoxisulfurón, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula (I) + fenoxasulfona (CAS RN 639826-16-7), compuesto de fórmula (I) + fentrazamida, compuesto de fórmula (I) + florasulam, compuesto de fórmula (I) + halosulfurón, compuesto de fórmula (I) + halosulfurona-metilo, compuesto de fórmula (I) + imazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + ipfencarbazona (CAS RN 212201-70-2), compuesto de fórmula (I) + MCPA, compuesto de fórmula (I) + mefenacet, compuesto de fórmula (I) + mesotriona, compuesto de fórmula (I) + metazosulfurona (NC-620, CAS RN 868680-84-6), compuesto de fórmula (I) + metsulfurona, compuesto de fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula (I) + ortosulfamurón, compuesto de fórmula (I) + oxadiargilo, compuesto de fórmula (I) + oxadiazón, compuesto de fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de fórmula (I) + penoxsulam, compuesto de fórmula (I) + pretilaclor, compuesto de fórmula (I) + propirisulfurona (TH-547, CAS RN 570415-88-2), compuesto de fórmula (I) + pirazolinato, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón, compuesto de fórmula (I) + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula (I) + pirazoxifeno, compuesto de fórmula (I) + piribenzoxim, compuesto de fórmula (I) + piriftalida, compuesto de fórmula (I) + piriminobac, compuesto de fórmula (I) + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula (I) + pirimisulfán, compuesto de fórmula (I) + quinclorac, compuesto de fórmula (I) + tefuriltriona, compuesto de fórmula (I) + triasulfurona y compuesto de fórmula (I) + trinexapac-etilo son particularmente preferidos.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también se pueden utilizar en combinación con protectores. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I es uno de los compuestos descritos en las Tablas 1 a 39 más adelante. Se tienen en cuenta especialmente las siguientes mezclas con protectores:

compuesto de fórmula I + cloquintocet-mexilo, compuesto de fórmula I + ácido cloquintocet y sus sales, compuesto de fórmula I + fenclorazol-etilo, compuesto de fórmula I + ácido fenclorazol y sus sales, compuesto de fórmula I + mefenpir-dietilo, compuesto de fórmula I + mefenpir diácido, compuesto de fórmula I + isoxadifén-etilo, compuesto de fórmula I + ácido isoxadifén, compuesto de fórmula I + furilazol, compuesto de fórmula I + isómero R de furilazol, compuesto de fórmula (I) + N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, compuesto de fórmula I + benoxacor, compuesto de fórmula I + diclormid, compuesto de fórmula I + AD-67, compuesto de fórmula I + oxabetrinilo, compuesto de fórmula I + ciometrinilo, compuesto de fórmula I + isómero Z de ciometrinilo, compuesto de fórmula I + fenclorim, compuesto de fórmula I + ciprosulfamida, compuesto de fórmula I + anhídrido naftálico, compuesto de fórmula I + flurazol, compuesto de fórmula I + CL 304,415, compuesto de fórmula I + diciónona, compuesto de fórmula I + fluxofenim, compuesto de fórmula I + DKA-24, compuesto de fórmula I + R-29148 y compuesto de fórmula I + PPG-1292. También se puede observar un efecto protector para las mezclas del compuesto de fórmula I + dimrón, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + mecoprop y compuesto de fórmula I + mecoprop-P.

Los protectores y herbicidas mencionados anteriormente se describen, por ejemplo, en *The Pesticide Manual*, duodécima edición, Consejo Británico para la Protección de Cultivos, 2000. R-29148 se describe, por ejemplo, por P.B. Goldsbrough *et al.*, *Plant Physiology*, (2002), Vol. 130 págs. 1497-1505 y referencias en ellas, PPG-1292 es conocido del documento WO09211761 y N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida es conocida del documento EP365484.

Se prefieren especialmente benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciprosulfamida, mefenpir-dietil y N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida y es particularmente valioso cloquintocet-mexilo.

La tasa de aplicación del protector respecto al herbicida depende en gran medida del modo de aplicación. En el caso de un tratamiento de campo, en general se aplican entre 0.001 y 5 kg de protector/ha, preferentemente entre 0.001 y 0 kg de protector/ha, y en general entre 0.001 y 2 kg de herbicida/ha, pero preferentemente entre 0.005 y 1 kg/ha.

Las composiciones herbicidas de acuerdo con la invención son adecuadas para todos los métodos de aplicación habituales en agricultura tales como, por ejemplo, aplicación pre-emergencia, aplicación posemergencia y revestimiento

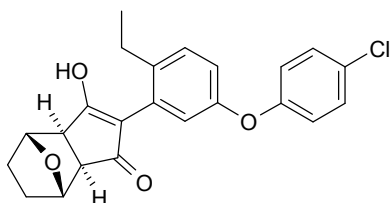
- de semillas. Dependiendo del uso previsto, los protectores pueden utilizarse para pretratar el material seminal de la planta de cultivo (preparación de la semilla o plántulas) o se pueden introducir en el suelo antes o después de la siembra y a continuación aplicar el compuesto (sin protección) de fórmula (I), opcionalmente combinado con un co-herbicida. Sin embargo, también se puede aplicar solo o junto con el herbicida, antes o después de la emergencia de las plantas. Por lo tanto, el tratamiento de las plantas o el material seminal con el protector puede llevarse a cabo, en principio, independientemente del momento en el que se aplique el herbicida. Generalmente se prefiere el tratamiento de la planta mediante la aplicación simultánea del herbicida y el protector (p. ej., en forma de una mezcla en tanque). La tasa de aplicación del protector respecto al herbicida depende en gran medida del modo de aplicación. En el caso del tratamiento en el campo, se aplican generalmente de 0.001 a 5 kg de protector/ha, preferiblemente de 0.001 a 0.5 kg de protector/ha. En el caso de un revestimiento de semillas, en general se aplican entre 0.001 y 10 g de protector/kg de semilla, preferentemente entre 0.05 y 2 g de protector/kg de semilla. Cuando el antídoto se aplica en forma líquida, con remojo de las semillas, poco antes de la siembra, es ventajoso usar soluciones de antídoto que contengan el principio activo en una concentración de 1 a 10 000 ppm, preferiblemente de 100 a 1000 ppm.
- 15 Es preferible aplicar el otro herbicida junto con uno los protectores arriba mencionados. Los siguientes ejemplos ilustran la invención aún más pero sin limitarla.

Ejemplos de preparación:

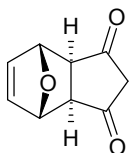
- 20 Los expertos en la técnica apreciarán que determinados compuestos descritos más adelante son β -cetoenoles y como tales pueden existir como un único tautómero o como una mezcla de tautómeros de ceto-enol y dicetona, tal como se describe, por ejemplo, por J. March, *Advanced Organic Chemistry*, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos que se muestran a continuación, y en la Tabla T1, se dibujan como un tautómero de enol único arbitrario, pero debería inferirse que la descripción cubre la forma de dicetona y cualquier enol posible que pudiera derivar por tautomerismo. Cuando se observa más de un tautómero en NMR de protones, los datos mostrados son para la mezcla de tautómeros. Además, algunos de los compuestos mostrados más adelante se representan como enantiómeros sencillos con el fin de simplicidad, pero a menos que se especifiquen como enantiómeros sencillos, estas estructuras deben considerarse como representantes de una mezcla de enantiómeros en cualquier relación. Adicionalmente, algunos de los compuestos pueden existir como diastereoisómeros, y debe inferirse que éstos pueden estar presentes como un diastereoisómero sencillo o como una mezcla de diastereoisómeros en cualquier relación. En la sección experimental detallada, se elige el tautómero dicetónico a efectos de nomenclatura, incluso si el tautómero predominante está en forma enólica.

Ejemplo 1

- 35 Preparación de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-4-[5-(4-clorofenoxi)-2-etilfenil]-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-eno-3,5-diona

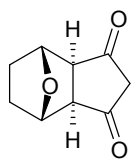


- 40 Etapa 1: Preparación de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-eno-3,5-diona.



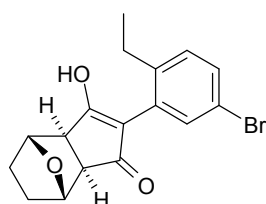
- Se añade furano (13.9 ml, 0.19 mol) a ciclopenten-1,4-diona (18.4 g, 0.19 mol) y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 5 días. La mezcla se diluye con metanol y *meso*-(1R,2S,6R,7S)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-eno-3,5-diona se recoge por filtración, y se utiliza sin purificación ulterior en la siguiente etapa.

- Etapa 2: Preparación de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona.



5 *meso*-(1R,2S,6R,7S)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]dec-8-eno-3,5-diona (2.1 g, 12.8 mmol) se disuelve en metanol caliente (180 ml) y se deja que la mezcla se enfríe a temperatura ambiente. A continuación, la mezcla se hidrogena en presencia de paladio sobre carbón al 5% (aprox. 50 mg) a 3.5 bar durante 4 horas. El catalizador se separa mediante filtración a través de tierra de diatomeas y el filtrado se concentra a presión reducida para proporcionar *meso*-(1R,2S,6R,7S)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona

Etapa 3: Preparación de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-4-[5-bromo-2-etilfenil]-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona.

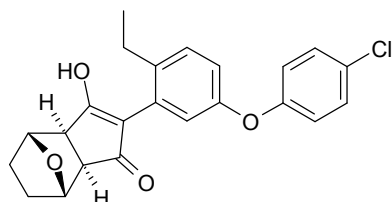


10

15 Triacetato 5-bromo-2-etilfenilado (13.0 g, 9.0 mmol) se añade en porciones, a lo largo de 20 minutos, a una disolución de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona (1.0 g, 6.0 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (3.67 g, 30 mmol) en tolueno (10 ml) y cloroformo (40 ml) y la mezcla se agita a 80°C durante 4 horas. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se añade ácido clorhídrico acuoso 2M (40 ml) y la mezcla se agita vigorosamente durante 15 minutos. La mezcla se filtra a través de tierra de diatomeas y la torta de filtración se lava con diclorometano (40 ml). Se recolecta la fase orgánica y se extrae la fase acuosa con diclorometano. Las disoluciones orgánicas se reúnen, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran y el filtrado se evapora a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar *meso*-(1R,2S,6R,7S)-4-[5-bromo-2-etilfenil]-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona.

20

Etapa 5: Preparación de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-4-[5-(4-clorofenoxi)-2-etilfenil]-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona.



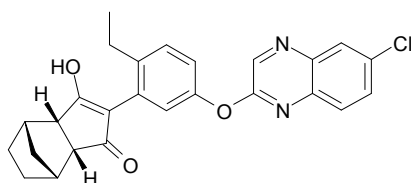
25

30 Una mezcla de *meso*-(1R,2S,6R,7S)-4-[5-bromo-2-etilfenil]-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona (100 mg, 0.29 mmol), 4-clorofenol (44 mg, 0.34 mmol), carbonato de cesio (187 mg, 0.57 mmol) y trifluorometanosulfonato de cobre(II) (5 mg, 0.01 mmol) en 1,2-dimetoxietano (3 ml) se calienta a 150 °C bajo irradiación de microondas durante 30 minutos. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se vierte en ácido clorhídrico acuoso 2M y se extrae con acetato de etilo. El extracto orgánico se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora a presión reducida. El residuo se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativa para dar *meso*-(1R,2S,6R,7S)-4-[5-(4-clorofenoxi)-2-etilfenil]-10-oxatriciclo[5.2.1.0^{2,6}]decano-3,5-diona.

30

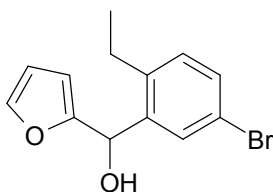
Ejemplo 2

35 Preparación de *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-[5-(6-cloroquinoxalin-2-iloxi)-2-etilfenil]hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona



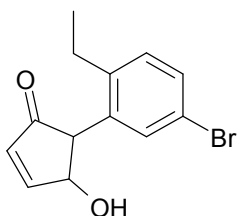
40

Etapa 1: Preparación de (5-bromo-2-etilfenil)furan-2-ilmetanol



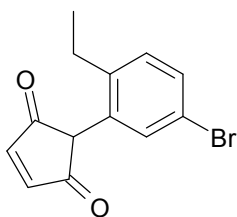
5 4-bromo-2-yodoetil-benceno (50.0 g, 160.8 mmol) se disuelve en tetrahidrofurano anhidro (250 ml) y se enfría a -70°C bajo una atmósfera de nitrógeno. Cloruro de isopropilmagnesio (disolución 2M en THF, 100 ml, 200 mmol) se añade gota a gota con agitación vigorosa a lo largo de 40 minutos, manteniendo la temp. Interna por debajo de -60°C mediante enfriamiento externo. Cuando la adición se ha completado, la reacción se agita a -70°C durante 20 minutos y luego se deja calentar a la temperatura ambiente a lo largo de 1 h 20 minutos. La mezcla de reacción se enfría a continuación a -70°C y una disolución de 2-furaldehído (16 ml, 18.6 g, 190 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) se añade gota a gota a lo largo de 40 minutos. Al completar la adición, se permite que la reacción se caliente hasta temperatura ambiente y se agita a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añade una solución acuosa saturada de cloruro de amonio (~500 ml) y la mezcla se extrae en acetato de etilo. Las soluciones orgánicas se combinan, se lavan con salmuera, se secan con sulfato de magnesio anhidro y se concentran a presión reducida. El residuo se purifica adicionalmente mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (5-bromo-2-etilfenil)furan-2-ilmetanol (40.7 g).

15 Etapa 2: Preparación de 5-(5-bromo-2-etilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona



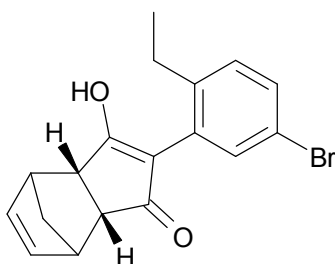
20 Una disolución de (5-bromo-2-etilfenil)furan-2-ilmetanol (40.73 g, 145 mmol) en acetona (1150 ml) y agua (170 ml) se calienta a 55°C y se añaden 30 gotas de ácido polifosfórico. La mezcla se agita a 55 °C durante 44 horas y a continuación se enfría hasta temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentra a presión reducida para eliminar la mayor parte de la acetona, a continuación se añade acetato de etilo (500 ml) y la mezcla de reacción se reparte. La fase acuosa se extrae en acetato de etilo y las soluciones orgánicas se combinan, se lavan con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secan con sulfato de magnesio anhidro, se filtran y se concentra el filtrado a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5-(5-bromo-2-etilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (33.67 g).

25 Etapa 3: Preparación de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona



30 Se añade el reactivo de Jones (75 ml de una solución 1.67 M, 125 mmol) gota a gota durante 30 minutos a una solución enfriada (baño de hielo) de 5-(5-bromo-4-etilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (33 g, 117 mmol) en acetona (400 ml). La mezcla se agita durante 20 minutos, a continuación se retira el baño de refrigeración y la mezcla se agita durante 1 hora a temperatura ambiente. Se añade isopropanol (150 ml) a la suspensión densa de color amarillo y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla se diluye con acetato de etilo y se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora a presión reducida para dar 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona (32.17g).

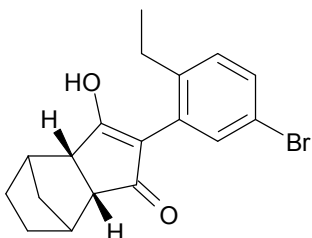
35 Etapa 4: Preparación de *meso*-(3*a*S,7*a*R)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-3*a*,4,7,7*a*-tetrahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona



5 Diciclopentadieno (25 ml) se disgrega mediante calentamiento a 180°C, de acuerdo con procedimientos conocidos (Elements of Organometallic Chemistry, F R Hartley, páginas 92-94) y ciclopentadieno (aproximadamente 10 ml) se destila en un matraz receptor que contiene 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona (2.6 g, 9.2 mmol), enfriado en un baño de sal-hielo. La mezcla de reacción resultante se agita a 0-5°C durante 2 horas y luego a temperatura ambiente durante 18 horas. Se añade iso-hexano (250 mL) a la mezcla de reacción y el sólido blanco resultante se filtra y se lava con iso-hexano para dar *meso*-(3aS,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,7,7a-tetrahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona (2.99 g) que se utiliza sin purificación ulterior en la siguiente etapa.

10

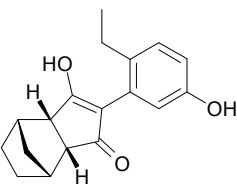
Etapa 5: Preparación de *meso*-(3aS,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-hexahidro-4,7-metano-indeno-1,3-diona



15 *meso*-(3aS,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,7,7a-tetrahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona (2.99 g, 8.67 mmol) se disuelve en metanol (400 ml) y se hidrogena en dos porciones en presencia de paladio al 5% sobre carbono (aprox. 200 mg) a 3.5 bares durante 2 horas. El catalizador se separa mediante filtración a través de tierra de diatomeas y el filtrado se concentra a presión reducida para dar *meso*-(3aS,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-hexahidro-4,7-metano-indeno-1,3-diona (2.98 g).

20

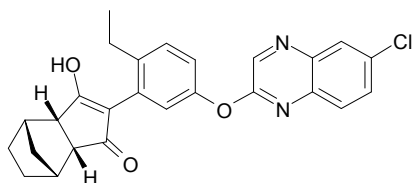
Etapa 6: Preparación de *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-(2-etil-5-hidroxifenil)hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona



25 A una disolución de *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona (1.0 g, 2.9 mmol), yoduro de cobre (I) (108 mg, 0.57 mmol) y L-prolina (33 mg, 0.28 mmol) se añade una disolución de hidróxido de sodio acuoso 1M (8.9 ml, 8.9 mmol) y la mezcla se calienta a 200°C durante 2 horas bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se diluye con acetato de etilo y luego se acidifica con ácido clorhídrico 2M y se filtra a través de tierra de diatomeas (lavando con acetato de etilo adicional). La fase acuosa se extrae adicionalmente en acetato de etilo (x3) y los extractos orgánicos reunidos se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran y el filtrado se concentra a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice (eluyente diclorometano/metanol) para proporcionar *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-(2-etil-5-hidroxyifenil)hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona.

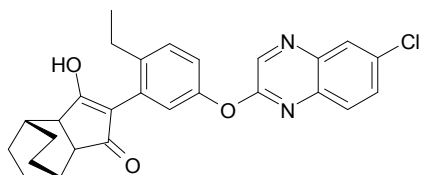
30

35 Preparación de *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-[5-(6-cloroquinoxalin-2-iloxi)-2-etilfenil]hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona



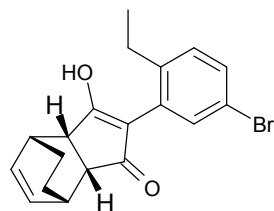
5 A una mezcla de *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-(2-etil-5-hidroxifenil)hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona (80 mg, 0.28 mmol) y carbonato de potasio anhidro (90 mg, 0.56 mmol) se añade una disolución de 2,6-dicloroquinoxalina (67 mg, 0.34 mmol) en *N,N*-dimetilformamida anhidra (2.0 ml), y la mezcla se calienta a 140°C durante 40 minutos bajo irradiación de microondas. Después de la acidificación con ácido clorhídrico 2M, la mezcla se diluye con diclorometano y luego se filtra (lavando con diclorometano adicional). La fase orgánica se concentra a presión reducida y el residuo se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativa para proporcionar *meso*-(3aS,4S,7R,7aR)-2-[5-(6-cloroquinoxalin-2-iloxi)-2-etilfenil]hexahidro-4,7-metanoindeno-1,3-diona.

10

Ejemplo 3**Preparación de 2-[5-(6-cloroquinoxalin-2-iloxi)-2-etilfenil]hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona**

15

Etapa 1: Preparación de *meso*-(3aS,4R,7S,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,7,7a-tetrahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona

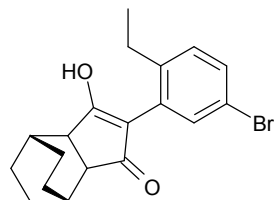


20

Yoduro de magnesio (897 mg, 3.22 mmol) se añade a una disolución de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona (3.00 g, 10.7 mmol) en 1,3-ciclohexadieno (10 ml, 108 mmol) y la mezcla se calienta a 80°C durante 17 horas. La mezcla se enfría a la temperatura ambiente y el disolvente se evapora a presión reducida. La trituración con iso-hexano dio *meso*-(3aS,4R,7S,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,7,7a-tetrahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona (4.638 g) en forma de un sólido blanco.

25

Etapa 2: Preparación de 2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,5,6,7,7a-hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona

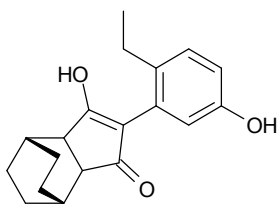


30

meso-(3aS,4R,7S,7aR)-2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,7,7a-tetrahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona (3.87 g, 10.8 mmol) se disuelve en una mezcla de metanol (135 ml) y acetato de etilo (45 ml) y se hidrogena sobre paladio al 10% sobre carbón vegetal a 25°C y 30 bares bajo condiciones de flujo continuo (utilizando un H-cube® suministrado por ThalesNano Nanotechnology Inc. un cartucho CatCart® de paladio al 10% sobre carbón vegetal y un caudal de 1.0 ml/ minuto). El disolvente se evapora y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, para dar 2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,5,6,7,7a-hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona (2.484 g) en forma de un sólido blancuzco.

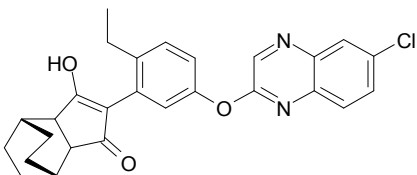
35

Etapa 3: Preparación de 2-(2-etil-5-hidroxifenil)hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona



5 A una disolución de 2-(5-bromo-2-etilfenil)-3a,4,5,6,7,7a-hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona (1.01 g, 2.8 mmol), yoduro de cobre (I) (108 mg, 0.57 mmol) y L-prolina (33 mg, 0.28 mmol) se añade una disolución de hidróxido de sodio acuoso 1M (8.8 mL, 8.8 mmol) y la mezcla se calienta entonces a 200°C durante 150 minutos bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se diluye con acetato de etilo y luego se acidifica con ácido clorhídrico 2M y se filtra a través de tierra de diatomeas (lavando con acetato de etilo adicional). La fase acuosa se extrae en acetato de etilo (x3) y los extractos orgánicos reunidos se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran y el filtrado se concentra a presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice (eluyente acetato de etilo-hexano) para proporcionar 2-(2-etil-5-hidroxifenil)hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona.

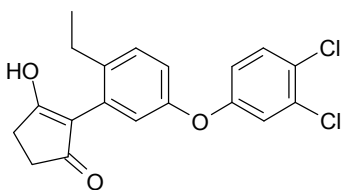
Etapa 4: Preparación de 2-[5-(6-cloroquinoxalin-2-iloxi)-2-etilfenil]hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona



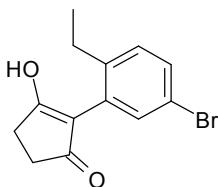
15 A una mezcla de 2-(2-etil-5-hidroxifenil)hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona (83 mg, 0.28 mmol) y carbonato de potasio anhidro (90 mg, 0.56 mmol) se añade una disolución de 2,6-dicloroquinoxalina (67 mg, 0.34 mmol) en dimetilformamida anhidra (2.0 ml), y la mezcla se calienta a 140°C durante 40 minutos bajo irradiación de microondas. La mezcla se acidifica con ácido clorhídrico acuoso 2M y se diluye con diclorometano y luego se filtra. La fase orgánica se concentra a presión reducida y el residuo se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativa para proporcionar 2-[5-(6-cloroquinoxalin-2-iloxi)-2-etilfenil]hexahidro-4,7-etanoindeno-1,3-diona.

Ejemplo 4

25 Preparación de 2-[5-(3,4-diclorofenoxi)-2-etilfenil]ciclopentano-1,3-diona

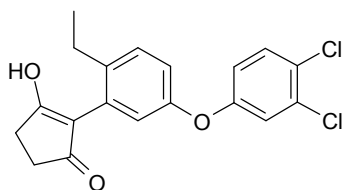


30 Etapa 1: Preparación de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopentano-1,3-diona



35 A una suspensión de polvo espolvoreable de zinc (13.9 g, 214 mmol) en ácido acético (270 ml) se añade una disolución de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopentano-1,3-diona (8.544 g, 31 mmol) en ácido acético (70 ml). La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 18 horas, luego se filtra a través de tierra de diatomeas y se lava con ácido acético y se concentra a presión reducida. El aceite bruto se azeotropa con tolueno (x 2), luego se concentra *in vacuo* y se purifica mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice para proporcionar 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopentano-1,3-diona.

40 Etapa 2: Preparación de 2-[5-(3,4-diclorofenoxi)-2-etilfenil]ciclopentano-1,3-diona

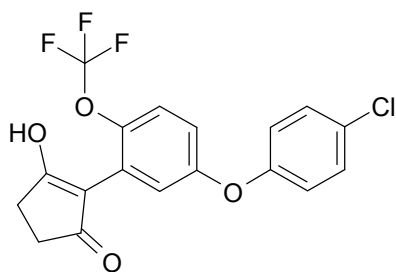


5 A una mezcla de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclopentano-1,3-diona (0.200 g, 0.71 mmol), 3,4-diclorofenol (0.577 g, 3.56 mmol), carbonato de cesio (0.502 g, 1.42 mmol), triflato de cobre (13 mg, 0.04 mmol) y tamices moleculares de 5Å activados (en polvo) (0.400 g) se añade tolueno anhidro (2.5 ml). La mezcla de reacción se barre con nitrógeno y luego se calienta a 160°C durante 1 hora bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añade diclorometano y la mezcla se enfría bruscamente con ácido clorhídrico acuoso 2M y luego se filtra. La fase orgánica se concentra a presión reducida para dar un aceite bruto que se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativa para proporcionar 2-[5-(3,4-diclorofenoxi)-2-etilfenil]ciclopentano-1,3-diona.

10

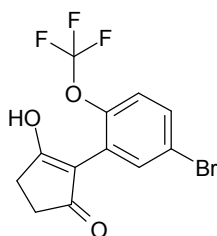
Ejemplo 5

Preparación de 2-[5-(4-clorofenoxi)-2-trifluorometoxifenil]ciclopentano-1,3-diona



15

Etapas 1: Preparación de 2-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)ciclopentano-1,3-diona

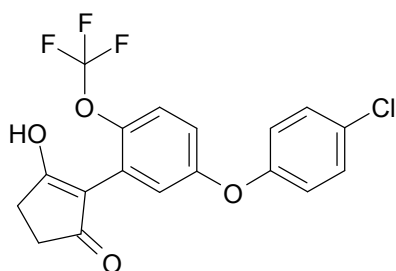


20

25 A una disolución de 5-bromo-2-trifluorometoxibenzaldehído (2.0 g, 7.43 mmol) en diclorometano anhidro (40 ml) a temperatura ambiente se añade trifluoruro de boro eterato (1.13 ml, 8.92 mmol) y luego 1,2-bis(trimetilsiloxi)ciclobuteno (2.86 ml, 11.2 mmol). La mezcla se agita a temperatura ambiente durante 23 horas, seguido de la adición de agua destilada (1.2 ml) y trifluoruro de boro eterato adicional (14.1 ml, 112 mmol). Después de agitar durante 24 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se enfría después bruscamente con disolución acuosa saturada de cloruro de amonio (50 ml) y se extrae con diclorometano (2 x 50 ml). El producto bruto se extrae en disolución acuosa de carbonato de potasio 0.5 M (x3), después la fase acuosa se acidifica a pH 1 con ácido clorhídrico concentrado. La extracción final con diclorometano (x3) es seguida de lavado con salmuera y luego secado sobre sulfato de magnesio. La filtración y luego la concentración *in vacuo* da un producto bruto que se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativa para proporcionar 2-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)ciclopentano-1,3-diona.

30

Etapas 2: Preparación de 2-[5-(4-clorofenoxi)-2-trifluorometoxifenil]ciclopentano-1,3-diona

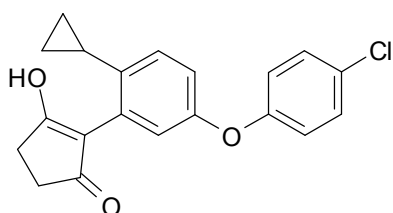


5 A una mezcla de 4-clorofenol (0.473 g, 3.69 mmol), carbonato de cesio (0.521 g, 1.48 mmol), triflato de cobre (0.013 g, 0.04 mmol) y tamices moleculares de 5 Å en polvo (0.400 g) se añade una disolución de 2-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)ciclopentano-1,3-diona (0.249 g, 0.74 mmol) en tolueno anhidro (3.5 ml). La mezcla se anega con nitrógeno y se calienta a 160°C durante 1 hora bajo radiación de microondas y después durante 1 h adicional a 170°C,. Después de enfriar a temperatura ambiente, el producto bruto se reparte entre diclorometano (5 ml) y ácido clorhídrico 2M (5 ml), y la fase orgánica se separa y después se concentra *in vacuo*. El residuo se purifica después mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice (eluyente acetato de etilo-hexano) para proporcionar 2-[5-(4-clorofenoxy)-2-trifluorometoxifenil]ciclopentano-1,3-diona en forma de un sólido blanco.

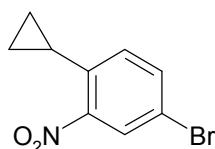
Ejemplo 6

Preparación de 2-[5-(4-clorofenoxy)-2-ciclopropilfenil]ciclopentano-1,3-diona

15



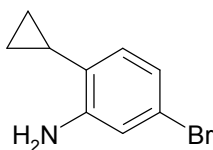
20 Etapa 1: Preparación de 5-bromo-2-ciclopropilnitrobenceno



25 A una mezcla de 4-bromo-1-yodo-2-nitrobenceno (21.1g, 0.064mol) (descrita en Synthesis, (2008), (13), 2039-2044), ácido ciclopropil-borónico (7.2g, 0.083mol), triciclohexil-fosfina (1.7g, 0.0064mol) y fosfato de potasio (50.0g, 0.24mol) se añade tolueno (255ml) y agua destilada (23ml). La mezcla agitada se desgasifica se barre con nitrógeno (ciclo repetido x3), seguido de la adición de acetato de paladio (II) (0.70g, 0.0032mol) y se calienta a 100°C durante la noche. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se enfría bruscamente con agua destilada y se extrae con acetato de etilo (x 3). Todas las fracciones orgánicas se reúnen, se lavan con agua destilada y luego con salmuera y se secan sobre sulfato de magnesio. La concentración *in vacuo* proporciona una mezcla aproximada 6:4 de 5-bromo-2-ciclopropilnitrobenceno y 4-bromo-1-yodo-2-nitrobenceno (11.9g) en forma de un aceite pardo. A esta mezcla bruta se añade entonces ácido ciclopropil-borónico adicional (1.8g, 0.021mol), triciclohexilfosfina (0.43g, 0.0016mol), acetato de paladio (0.18g, 0.0008mol), fosfato de potasio (12.5g, 0.06mol), tolueno (65ml) y agua (6ml). Después de calentar a 100°C durante la noche, la suspensión se deja enfriar a temperatura ambiente y la mezcla se enfría bruscamente con agua destilada y se extrae con acetato de etilo (x 3). Todas las fracciones orgánicas se reúnen, se lavan con agua destilada y luego con salmuera y se secan sobre sulfato de magnesio. La concentración *in vacuo* proporciona un producto bruto que se purifica mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice para dar una mezcla de 5-bromo-2-ciclopropilnitrobenceno, 3-bromo-nitrobenceno y 2,5-diciclopropil-nitrobenceno, la cual se utiliza en la siguiente etapa sin purificación adicional.

40

Etapa 2: Preparación de 5-bromo-2-ciclopropilnitrobenceno



Cloruro de estaño (II) (16.0g, 0.10mol) se añade en una porción a una disolución de 5-bromo-2-ciclopropilnitrobenzono bruto (8.68g) en etanol (190ml) y agua (1.9ml).

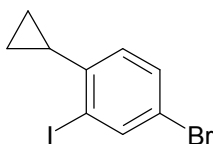
5

La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante la noche, seguido de la adición de cloruro de estaño (II) adicional (28 g, 0.175 mmol) y de la agitación adicional durante la noche. Después de la concentración *in vacuo* se añade hielo y la disolución se basifica con hidróxido de sodio acuoso 2M. Después de la extracción con acetato de etilo (x 2), la fase orgánica se lava de nuevo con hidróxido de sodio acuoso 2M, después también con agua destilada y salmuera. Después de secar sobre sulfato de magnesio, la disolución se concentra *in vacuo* para dar un aceite pardo que se purifica mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice (9:1, isohexano/acetato de etilo) para proporcionar 5-bromo-2-ciclopropilfenilamina en forma de un aceite pardo.

10

Etapas 4: Preparación de 5-bromo-2-ciclopropiliodobenceno

15



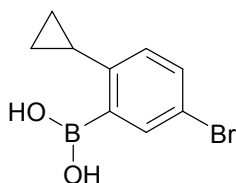
5-bromo-2-ciclopropilfenilamina (4.74g) se añade a una disolución de ácido *para*-toluenosulfónico monohidrato (12.2g, 0.064mol) en acetonitrilo (130ml), seguido de agitación durante 10 minutos a temperatura ambiente. La suspensión se enfría a continuación a 10°C y una disolución mixta de nitrito de sodio (8.9g, 0.054mol) y yoduro de potasio (3.1g, 0.044mol) en agua (16ml) se añade gota a gota a lo largo de 30 minutos. Una vez que se ha completado la adición, se deja que la mezcla de reacción se agite a 10°C durante 20 minutos y luego a temperatura ambiente durante 4 horas. La mezcla de reacción se basifica a pH 9-10 con bicarbonato de sodio acuoso, seguido de la adición de acetato de etilo y metabisulfito sódico acuoso al 10%. Las fases se separan y la capa acuosa se extrae de nuevo con acetato de etilo (x 2). Los componentes orgánicos se reúnen, se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio y luego se concentran *in vacuo* para dar el producto bruto, el cual se purifica mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice (eluyente isohexano) para proporcionar 5-bromo-2-ciclopropiliodobenceno en forma de un aceite incoloro.

20

25

Etapas 5: Preparación de ácido 5-bromo-2-ciclopropilfenilborónico

30



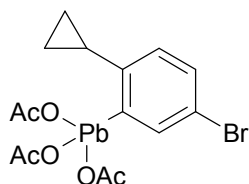
A una disolución de 5-bromo-2-ciclopropiliodobenceno (5.67 g, 0.018 mol) en tetrahidrofurano anhidro (32 ml) a -78°C se añade cloruro de isopropilmagnesio 9.5ml, 0.019mol, disolución 2M en THF) a una tasa tal que se mantenga una temperatura por debajo de -60°C. Una vez que se ha completado la adición, la mezcla de reacción se agita durante 20 minutos a esta temperatura y luego se deja calentar a temperatura ambiente y se agita durante 2 horas adicionales. La disolución se enfría después de nuevo a -78°C y se añade gota a gota borato de triisopropilo (8.3ml, 0.036mol). Después de agitar a esta temperatura durante 10 minutos, se deja que la disolución se caliente a temperatura ambiente y se agita durante 2 horas adicionales. Después de enfriar bruscamente con ácido clorhídrico 2M (20 ml) la mezcla de reacción se diluye con agua destilada y luego se extrae con acetato de etilo (x 3). Las fracciones orgánicas se reúnen, se lavan con agua destilada y con salmuera, después se secan sobre sulfato de magnesio y se concentran *in vacuo*. El sólido bruto se azeotropa con tolueno (x 3) y luego se tritura con isohexano para proporcionar ácido 5-bromo-2-ciclopropilfenilborónico en forma de un sólido crema.

35

40

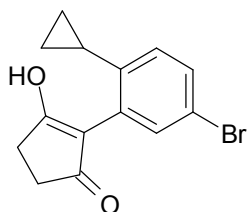
45

Etapas 6: Triacetato de 5-bromo-2-ciclopropilfenilplomo



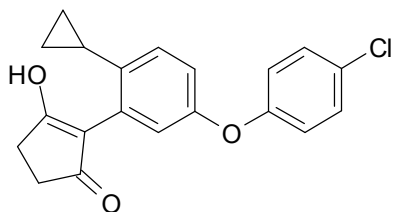
5 A una disolución de acetato de plomo (IV) (4.0g, 0.0089mol) y acetato de mercurio (II) (139mg, 0.45mmol) en cloroformo (12ml) a 50°C se añade ácido 5-bromo-2-ciclopropilfenil-borónico (2.0g, 0.0083mol), y la disolución se calienta a esta temperatura durante 5 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la suspensión se enfría adicionalmente a 0°C y se añade carbonato de potasio anhidro (1.8 g) con rápida agitación durante 2 minutos. La mezcla de reacción se filtra después (lavando con cloroformo adicional) y el filtrado se concentra hasta la mitad de su volumen original y el producto bruto se precipita con hexanos. La concentración ulterior y la filtración proporcionan triacetato de 5-bromo-2-ciclopropilfenil-plomo en forma de un sólido beige.

10 Etapa 7: Preparación de 2-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)ciclopentano-1,3-diona



15 A una disolución de ciclopentano-1,3-diona (0.57g, 0.0058mol) y *N,N*-dimetilaminopiridina (3.64g, 0.030mol) en cloroformo (33ml) se añade tolueno (9 ml) y luego triacetato de 5-bromo-2-ciclopropilfenil-plomo (3.77g, 0.0065mol). Esta disolución se calienta a 80°C durante 20 horas, luego se enfría a temperatura ambiente y se diluye con diclorometano y ácido clorhídrico acuoso 2M. La suspensión bifásica resultante se filtra a través de tierra de diatomeas y las dos fases se separan. La capa orgánica se lava adicionalmente con ácido clorhídrico acuoso 2M y la fase acuosa se extrae de nuevo con diclorometano. Las fracciones orgánicas se reúnen, se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio y se concentran *in vacuo*. El producto bruto se purifica finalmente mediante cromatografía en columna de resolución instantánea sobre gel de sílice (eluyente isohexano/acetato de etilo) para proporcionar 2-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)ciclopentano-1,3-diona en forma de un sólido amarillo pálido.

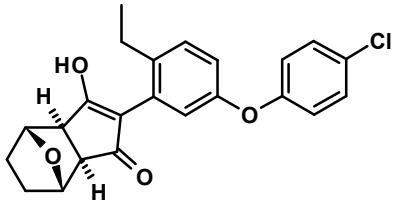
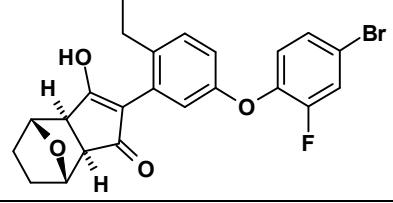
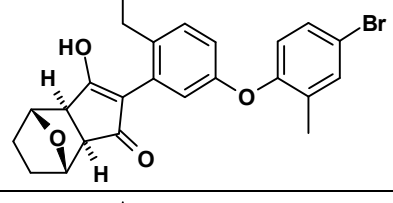
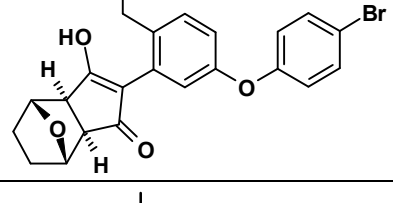
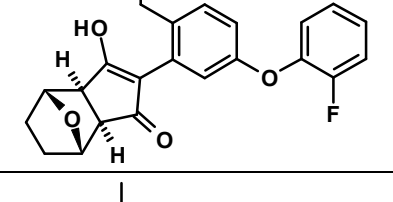
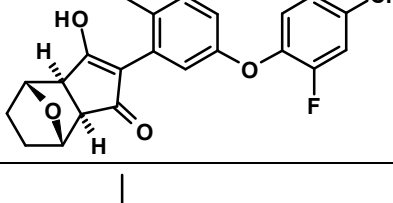
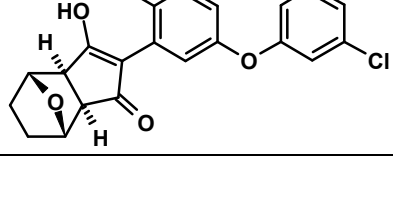
25 Etapa 8: Preparación de 2-[5-(4-clorofenoxi)-2-ciclopropilfenil]ciclopentano-1,3-diona

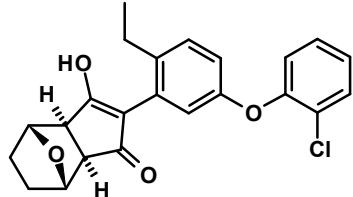
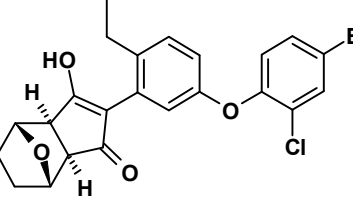
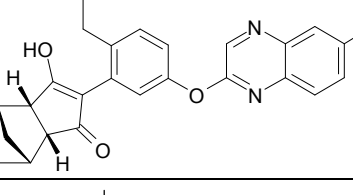
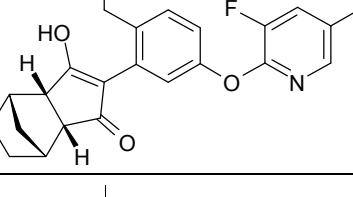
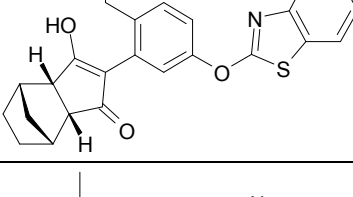
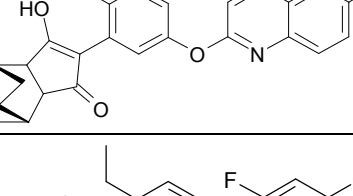
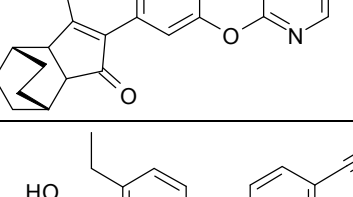
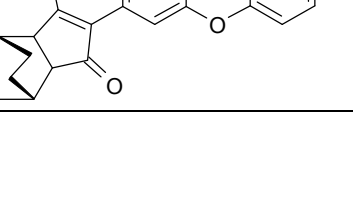


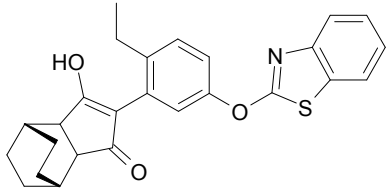
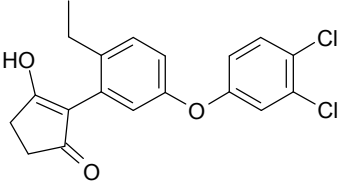
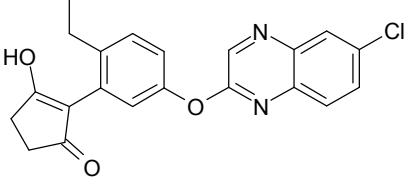
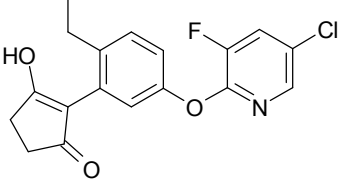
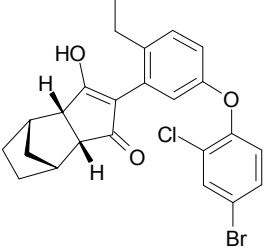
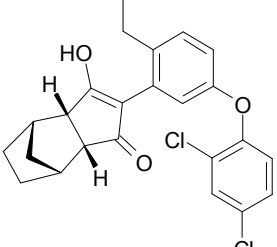
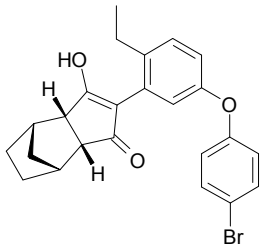
30 A una mezcla de 2-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)ciclopentano-1,3-diona (0.254g, 0.062mmol), 4-clorofenol (0.400g, 3.11mmol), fluoruro de cesio (0.440g, 1.25mmol) y triflato de cobre (II) (11mg, 0.03mmol) se añaden tamices moleculares de 4Å en polvo (0.40g) y tolueno anhidro (3.5ml). La mezcla se calienta después a 160°C durante 1 hora bajo irradiación de microondas, se deja enfriar a temperatura ambiente y luego se enfría bruscamente con ácido clorhídrico 2M. La mezcla de reacción se extrae con diclorometano (x 3), y luego los componentes orgánicos reunidos se lavan con salmuera, se secan sobre sulfato de magnesio y se concentran *in vacuo*. El producto bruto se purifica mediante HPLC de fase inversa para proporcionar 2-[5-(4-clorofenoxi)-2-ciclopropilfenil]ciclopentano-1,3-diona en forma de un sólido blanco.

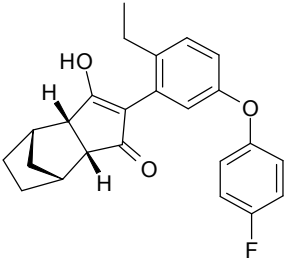
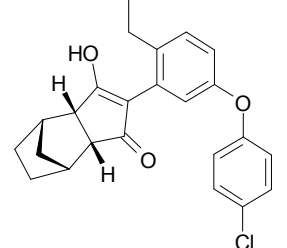
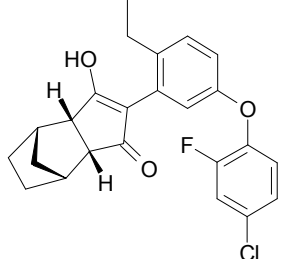
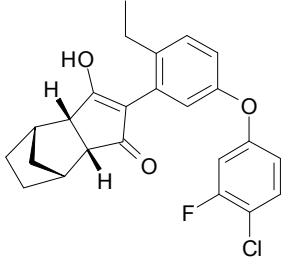
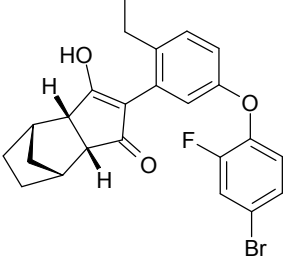
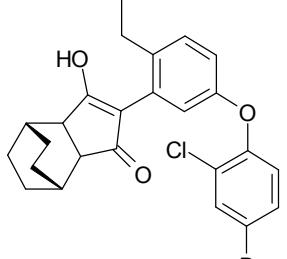
40 Compuestos adicionales en la Tabla T1 que figura a continuación se prepararon por métodos similares utilizando materiales de partida apropiados.

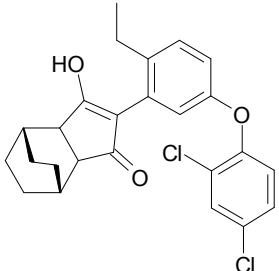
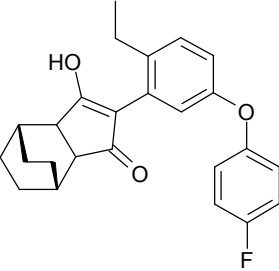
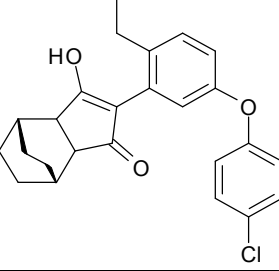
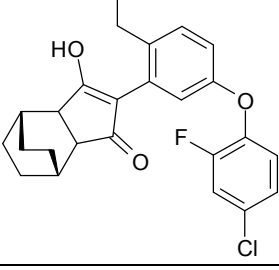
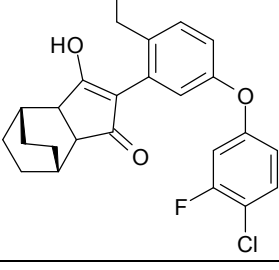
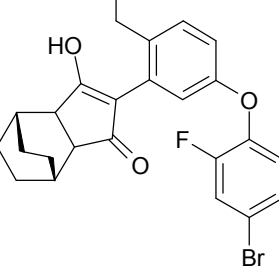
Tabla T1

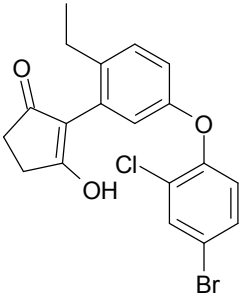
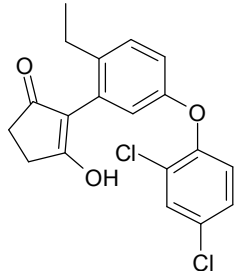
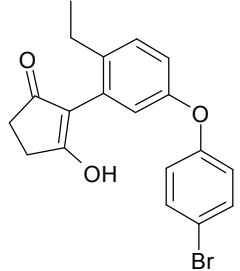
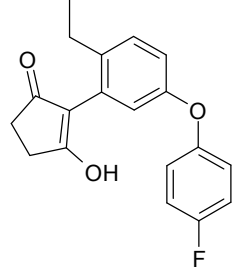
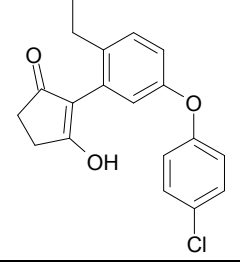
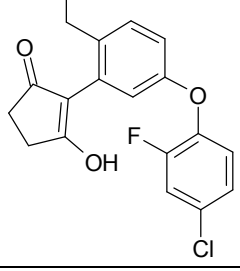
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-1		CDCl ₃ + 2 gotas d ₆ -DMSO δ 7,23 (m, 3H), 6,94 (m, 2H), 6,88 (dd, 1H), 6,73-6,80 (m a, 1H), 4,68 (m, 2H), 2,73 (m a, 2H), 2,50 (c, 2H), 1,82 (m, 2H), 1,56 (m, 2H), 1,12 (t, 3H).
A-2		CDCl ₃ + 2 gotas d ₆ -DMSO δ 7,31 (m, 1H), 7,20 (m, 2H), 6,95 (m, 1H), 6,86 (dd, 1H), 6,79-6,71 (m a, 1H), 4,68 (m, 2H), 2,92-2,54 (m a, 2H), 2,49 (c, 2H), 1,88-1,75 (m, 2H), 1,56 (dd, 2H), 1,11 (t, 3H).
A-3		d ₄ -MeOH δ 7,39 (m, 1H), 7,25 (dd, 1H), 7,21 (d, 1H), 6,79 (m, 2H), 6,56-6,52 (m a, 1H), 4,58 (t, 2H), 2,81 (s, 2H), 2,43 (c, 2H), 2,22 (s, 3H), 1,83-1,76 (m, 2H), 1,64 (m, 2H), 1,06 (t, 3H).
A-4		d ₄ -MeOH δ 7,43 (m, 2H), 7,25 (dd, 1H), 6,93-6,86 (m, 3H), 6,65 (d, 1H), 4,58 (t, 2H), 2,82 (s, 2H), 2,43 (c, 2H), 1,83-1,76 (m, 2H), 1,64 (m, 2H), 1,08 (t, 3H).
A-5		d ₄ -MeOH δ 7,25-7,14 (m, 2H), 7,14-7,03 (m, 3H), 6,84 (dd, 1H), 6,60 (s a, 1H), 4,58 (m, 2H), 2,81 (s, 2H), 2,43 (c, 2H), 1,83-1,75 (m, 2H), 1,64 (m, 2H), 1,06 (t, 3H).
A-6		d ₄ -MeOH δ 7,30 (m, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,13 (m, 1H), 7,06 (t, 1H), 6,87 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,58 (m, 2H), 2,82 (s, 2H), 2,44 (c, 2H), 1,85-1,75 (m, 2H), 1,64 (m, 2H), 1,07 (t, 3H).
A-7		d ₄ -MeOH δ 7,37-7,27 (m, 2H), 7,08 (m, 1H), 7,01 (m, 1H), 6,94 (m, 2H), 6,71 (m, 1H), 4,62 (t, 2H), 2,86 (s, 2H), 2,49 (c, 2H), 1,87-1,78 (m, 2H), 1,67 (m, 2H), 1,12 (t, 3H).

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-8		d ₄ -MeOH δ7,48 (m, 1H), 7,31-7,23 (m, 2H), 7,11 (m, 1H), 7,04 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 6,63 (s a, 1H), 4,62 (m, 2H), 2,85 (s, 2H), 2,48 (c, 2H), 1,86-1,78 (m, 2H), 1,67 (m, 2H), 1,10 (t, 3H).
A-9		d ₆ -DMSO δ7,79 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,90 (d, 1H), 6,81 (dd, 1H), 6,47 (d, 1H), 4,43 (s, 2H), 2,67 (s, 2H), 2,33 (c, 2H), 1,59 (m, 2H), 1,47 (m, 2H), 0,96 (t, 3H).
A-10		d ₄ -MeOH δ8,72 (s, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,73 – 7,66 (m, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,19 (dd, 1H), 6,93 (d, 1H), 3,05 (s, 2H), 2,63 – 2,57 (m, 4H), 1,77 – 1,75 (m, 1H), 1,68 – 1,66 (m, 1H), 1,53 – 1,47 (m a, 2H), 1,42 – 1,32 (m a, 2H), 1,18 (t, 3H).
A-11		d ₄ -MeOH δ7,86 (d, 1H), 7,82 (dd, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,04 (dd, 1H), 6,77 (d, 1H), 3,04 (s, 2H), 2,62 (s, 2H), 2,56 – 2,54 (m, 2H), 1,77 – 1,74 (m, 1H), 1,68 – 1,65 (m, 1H), 1,53 – 1,51 (m a, 2H), 1,36 – 1,35 (m a, 2H), 1,14 (t, 3H).
A-12		d ₄ -MeOH δ7,74 (d, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,41 – 7,37 (m, 2H), 7,30 – 7,24 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 3,04 (s, 2H), 2,62 – 2,57 (m, 4H), 1,76 – 1,73 (m, 1H), 1,67 – 1,64 (m, 1H), 1,52 (d a, 2H), 1,37 (d a, 2H), 1,67 (t, 3H).
A-13		d ₄ -MeOH δ8,74 (s, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,24 – 7,68 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 6,97 (d, 1H), 2,79 (s, 2H), 2,60 (c, 2H), 2,09 (s, 2H), 1,78 – 1,71 (m, 4H), 1,61 – 1,59 (m a, 2H), 1,45 – 1,43 (m a, 2H), 1,19 (t, 3H).
A-14		d ₄ -MeOH δ7,89 (d, 1H), 7,83 (dd, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,07 (dd, 1H), 6,82 (d, 1H), 2,79 (s, 2H), 2,56 (c, 2H), 2,09 (s, 2H), 1,80 – 1,69 (m, 4H), 1,59 (d a, 2H), 1,45 (d a, 2H), 1,15 (t, 3H).
A-15		d ₄ -MeOH δ7,73 – 7,67 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,14 – 7,10 (m, 2H), 7,04 – 6,99 (m, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,04 (s a, 1H), 2,79 (s, 2H), 2,57 (c, 2H), 2,09 (s, 2H), 1,78 – 1,71 (m a, 4H), 1,59 – 1,57 (m a, 2H), 1,45 – 1,42 (m a, 2H), 1,15 (t, 3H).

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-16		d ₄ -MeOH δ7,78 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,44 – 7,40 (m, 2H), 7,33 – 7,28 (m, 2H), 7,03 (s, 1H), 2,80 (s, 2H), 2,57 (c, 2H), 2,10 (s, 2H), 1,78 – 1,71 (m a, 4H), 1,60 (d a, 2H), 1,45 (d a, 2H), 1,18 (t, 3H).
A-17		δ7,33 (d, 1H), 7,25 (s, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,92 (dd, 1H), 6,85 (dd, 1H), 6,74 (d, 1H), 2,63 (s, 4H), 2,48 (c, 2H), 1,12 (t, 3H).
A-18		δ8,71 (d, 1H), 8,03 (t, 1H), 7,67 – 7,58 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,12 – 7,09 (m, 1H), 6,92 (d, 1H), 2,61 (s, 4H), 2,56 – 2,50 (m, 2H), 1,15 (td, 3H).
A-19		δ 7,74 (d, 1H), 7,53 (dd, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,03 (dd, 1H), 6,84 (d, 1H), 2,61 (s, 4H), 2,49 (c, 2H), 1,12 (t, 3H).
A-20		LCMS (Método B): t _r = 1,80 min, MH ⁺ = 473,0
A-21		LCMS (Método B): t _r = 1,76 min, MH ⁺ = 429,1
A-22		LCMS (Método B): t _r = 1,71 min, MH ⁺ = 439,1

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-23		LCMS (Método B): t _r = 1,59 min, MH ⁺ = 379,2
A-24		LCMS (Método B): t _r = 1,68 min, MH ⁺ = 395,1
A-25		LCMS (Método B): t _r = 1,68 min, MH ⁺ = 413,1
A-26		LCMS (Método B): t _r = 1,71 min, MH ⁺ = 413,1
A-27		LCMS (Método B): t _r = 1,71 min, MH ⁺ = 457,1
A-28		δ7,61 – 7,59 (m, 1H), 7,35 – 7,28 (m, 2H), 6,95 – 6,83 (m, 3H), 6,71 (s a, 1H), 2,51 (c, 2H), 2,15 (s a, 1H), 1,74 – 1,54 (m, 8H), 1,14 (t, 3H).

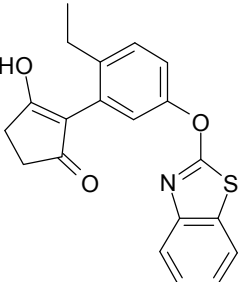
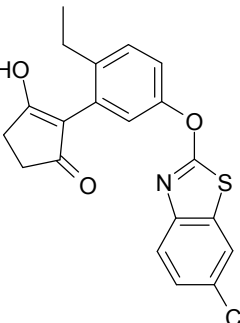
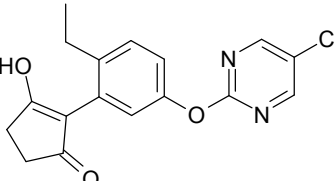
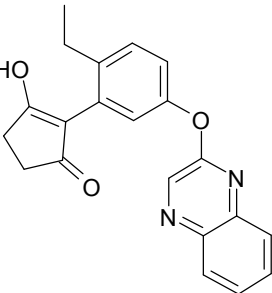
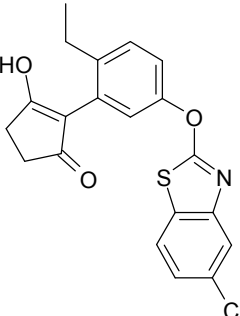
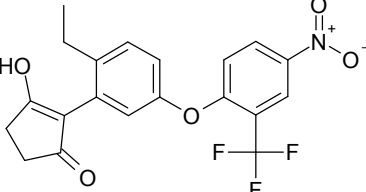
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-29		LCMS (Método B): t _r = 1,86 min, MH ⁺ = 443,1
A-30		LCMS (Método B): t _r = 1,67 min, MH ⁺ = 393,2
A-31		LCMS (Método B): t _r = 1,76 min, MH ⁺ = 409,1
A-32		LCMS (Método B): t _r = 1,77 min, MH ⁺ = 427,1
A-33		LCMS (Método B): t _r = 1,80 min, MH ⁺ = 427,1
A-34		LCMS (Método B): t _r = 1,80 min, MH ⁺ = 471,1

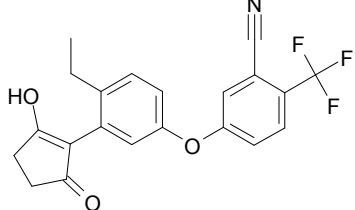
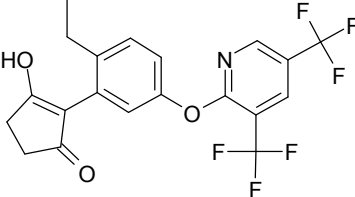
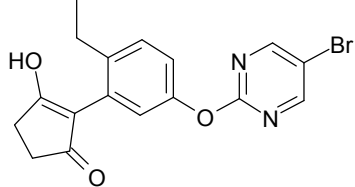
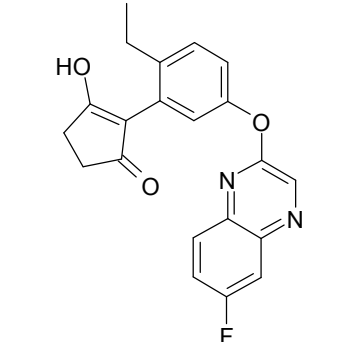
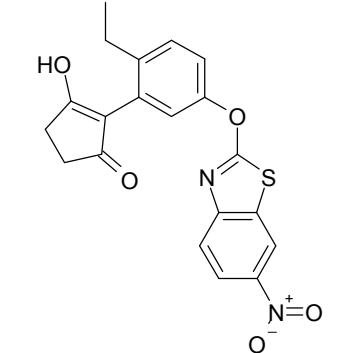
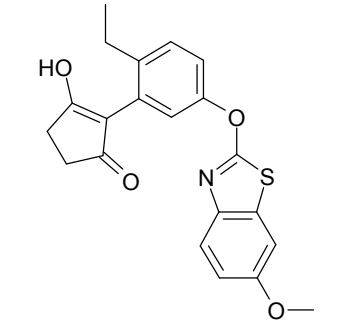
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-35		LCMS (Método B): t _r = 1,63 min, MH ⁺ = 409,0
A-36		LCMS (Método B): t _r = 1,60 min, MH ⁺ = 363,0
A-37		LCMS (Método B): t _r = 1,63 min, MH ⁺ = 373,0
A-38		LCMS (Método B): t _r = 1,44 min, MH ⁺ = 313,1
A-39		LCMS (Método B): t _r = 1,52 min, MH ⁺ = 329,1
A-40		LCMS (Método B): t _r = 1,54 min, MH ⁺ = 347,1

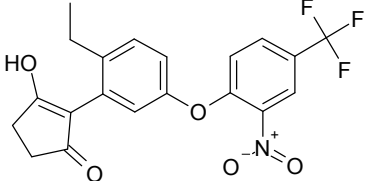
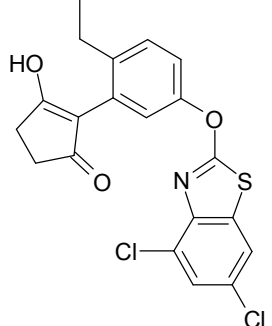
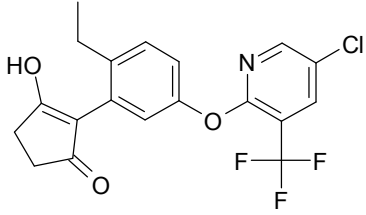
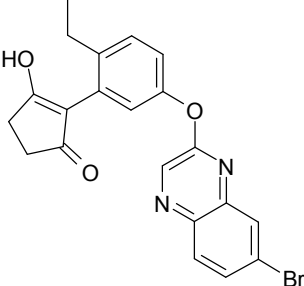
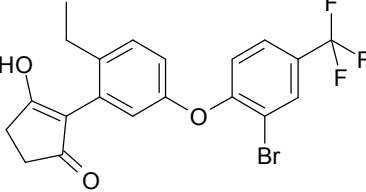
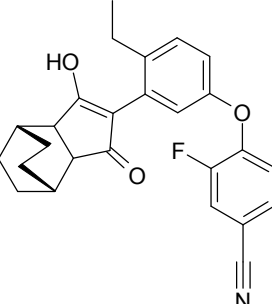
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-41		LCMS (Método B): t _r = 1,56 min, MH ⁺ = 347,1
A-42		LCMS (Método B): t _r = 1,56 min, MH ⁺ = 391,0
A-43		d ₄ -MeOH δ 8,25 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,61 (dd, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,12 (dd, 1H), 6,90 (d, 1H), 2,65 (s, 4H), 2,54 (c, 2H), 1,15 (t, 3H).
A-44		d ₄ -MeOH δ 7,52 (d, 1H), 7,28 – 7,24 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 6,86 (dd, 1H), 6,62 (d, 1H), 4,60 – 4,59 (m, 2H), 2,84 (s, 2H), 2,46 (c, 2H), 1,82 – 1,80 (m, 2H), 1,68 – 1,64 (m, 2H), 1,08 (t, 3H).
A-45		δ 7,30 – 7,25 (m, 2H), 6,95 (dd, 1H), 6,79 (dd, 1H), 6,72 (dt, 2H), 4,68 – 4,67 (m, 2H), 2,78 (s, 2H), 2,46 (c, 2H), 1,85 – 1,82 (m, 2H), 1,59 – 1,55 (m, 2H), 1,11 (t, 3H).
A-46		δ 7,25 (d, 1H), 7,03 – 6,89 (m, 5H), 6,66 (s a, 1H), 4,70 – 4,68 (m, 2H), 2,79 (s a, 2H), 2,45 (c, 2H), 1,86 – 1,83 (m, 2H), 1,58 – 1,57 (m, 2H), 1,10 (t, 3H).
A-47		δ 7,25 – 7,12 (m, 3H), 6,95 – 6,89 (m, 2H), 6,75 – 6,70 (m, 1H), 4,67 – 4,66 (m, 2H), 2,77 (s, 2H), 2,46 (c, 2H), 1,84 – 1,81 (m, 2H), 1,56 – 1,54 (m, 2H), 1,11 (t, 3H).
A-48		LCMS (Método A): t _r = 1,71 min, MH ⁺ = 475

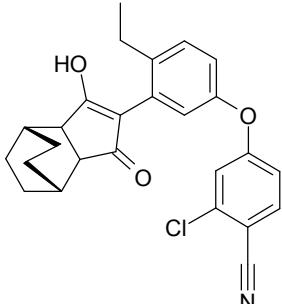
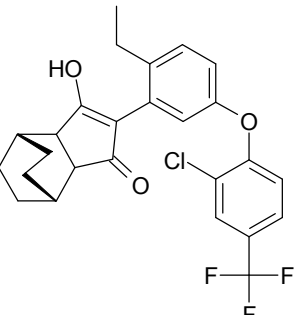
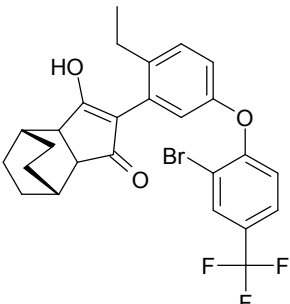
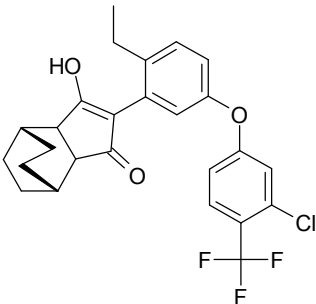
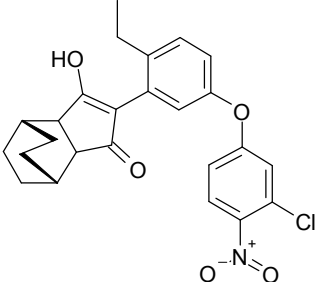
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-49		δ7,28 – 7,25 (m, 1H), 7,08 – 7,04 (m, 2H), 6,93 – 6,90 (m, 1H), 6,88 – 6,83 (m, 1H), 6,69 – 6,67 (m, 1H), 4,69 – 4,68 (m, 2H), 2,79 (s a, 1H), 2,45 (c, 2H), 1,85 – 1,83 (m, 2H), 1,58 – 1,56 (m, 2H), 1,11 (t, 3H).
A-50		δ7,30 – 7,28 (m, 1H), 7,17 (d, 2H), 7,00 (d, 2H), 6,96 (dd, 1H), 6,74 – 6,71 (m, 1H), 4,72 – 4,71 (m, 2H), 2,82 (s a, 2H), 2,47 (c, 2H), 1,87 – 1,85 (m, 2H), 1,60 – 1,56 (m, 2H), 1,12 (t, 3H).
A-51		δ8,73 (s, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,61 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,12 (dd, 1H), 4,74 – 4,71 (m a, 2H), 2,68 – 2,57 (m a, 4H), 1,84 (s a aparente s, 2H), 1,61 – 1,59 (m a, 2H), 1,17 (t, 3H).
A-52		δ7,33 – 7,29 (m, 3H), 7,13 (d, 1H), 7,00 – 6,95 (m, 3H), 2,68 (s, 4H).
A-53		d ₄ -MeOH δ8,26 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,63 – 7,60 (m, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,15 (dd, 1H), 6,90 (d, 1H), 2,79 (s a, 2H), 2,59 (c, 2H), 2,09 (s a, 2H), 1,78 – 1,71 (m, 4H), 1,63 – 1,55 (m a, 2H), 1,48 – 1,40 (m a, 2H), 1,19 (t, 3H).
A-54		CDCl ₃ + 2 gotas d ₆ -DMSO: δ7,24(d, 2H), 6,98-6,91(m, 3H), 6,82(dd, 1H), 6,78(s, 1H), 2,65-2,56(m, 4H), 1,89-1,80(m, 1H), 0,84-0,76(m, 2H), 0,58-0,52(m, 2H).
A-55		LCMS (Método B): t _r = 1,45 min, MH ⁺ = 338,1

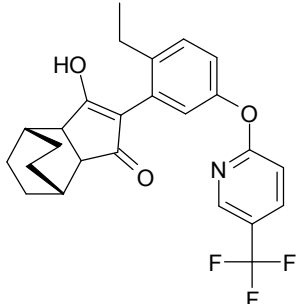
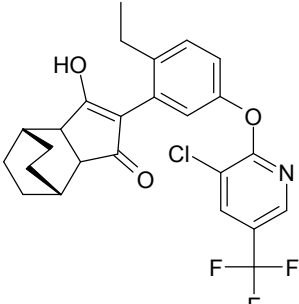
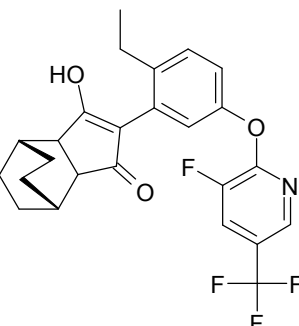
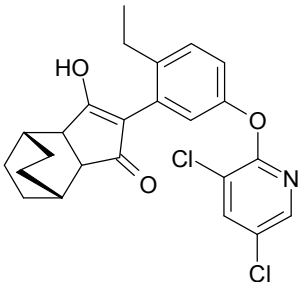
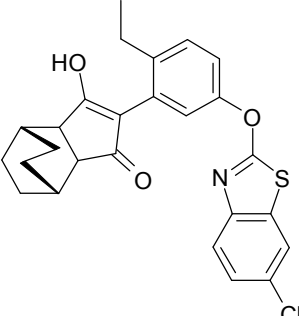
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-56		LCMS (Método B): t _r = 1,48 min, MH ⁺ = 354,1
A-57		LCMS (Método B): t _r = 1,66 min, MH ⁺ = 397,1
A-58		LCMS (Método B): t _r = 1,70 min, MH ⁺ = 397,1
A-59		LCMS (Método B): t _r = 1,53 min, MH ⁺ = 374,1
A-60		LCMS (Método B): t _r = 1,46 min, MH ⁺ = 364,1
A-61		LCMS (Método B): t _r = 1,52 min, MH ⁺ = 398,1
A-62		LCMS (Método B): t _r = 1,51 min, MH ⁺ = 382,1
A-63		δ 7,86 (d, 1H), 7,72 – 7,72 (m, 1H), 7,25 (d, 1H), 6,99 (dd, 1H), 6,82 (d, 1H), 2,56 (s, 4H), 2,47 (c, 2H), 1,10 (t, 3H).

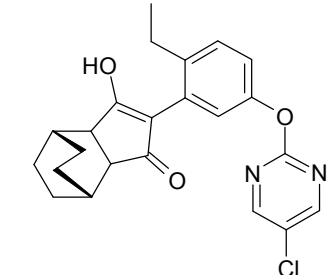
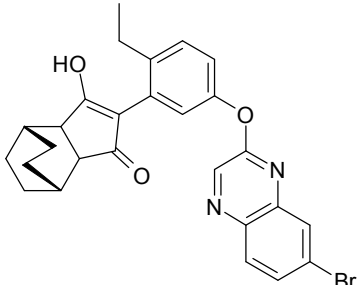
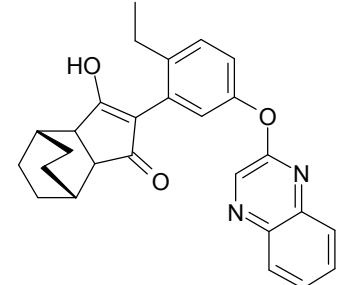
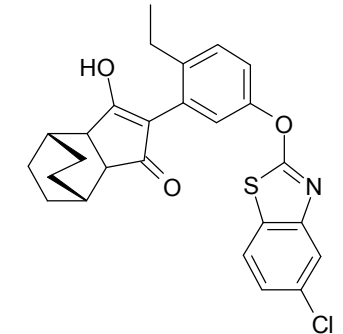
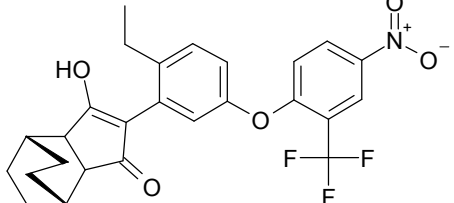
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-64		LCMS (Método B): t _r = 1,46 min, MH ⁺ = 352,1
A-65		LCMS (Método B): t _r = 1,60 min, MH ⁺ = 386,1
A-66		LCMS (Método B): t _r = 1,25 min, MH ⁺ = 331,1
A-67		LCMS (Método B): t _r = 1,36 min, MH ⁺ = 347,1
A-68		LCMS (Método B): t _r = 1,54 min, MH ⁺ = 386,1
A-69		LCMS (Método B): t _r = 1,54 min, MH ⁺ = 408,1

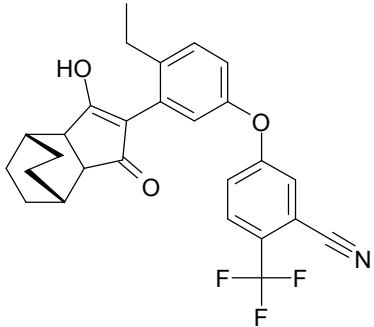
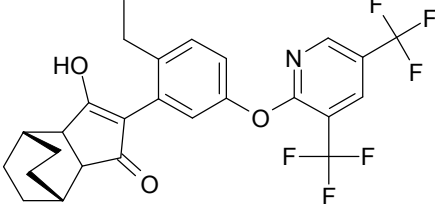
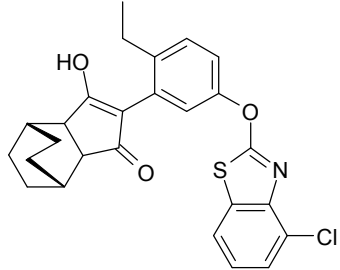
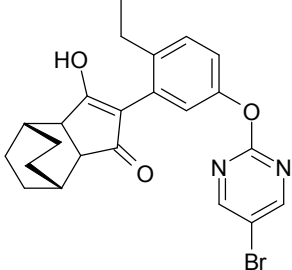
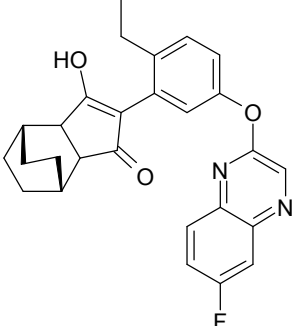
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-70		LCMS (Método B): t _r = 1,56 min, MH ⁺ = 388,1
A-71		LCMS (Método B): t _r = 1,63 min, MH ⁺ = 432,1
A-72		LCMS (Método B): t _r = 1,26 min, MH ⁺ = 375,0
A-73		LCMS (Método B): t _r = 1,41 min, MH ⁺ = 365,1
A-74		LCMS (Método B): t _r = 1,46 min, MH ⁺ = 397,1
A-75		LCMS (Método B): t _r = 1,48 min, MH ⁺ = 382,1

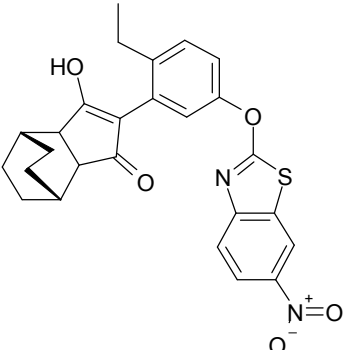
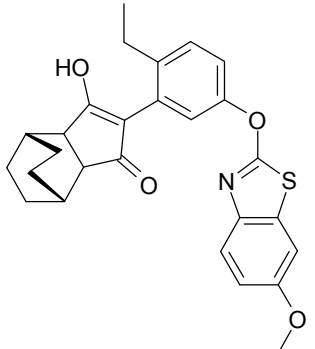
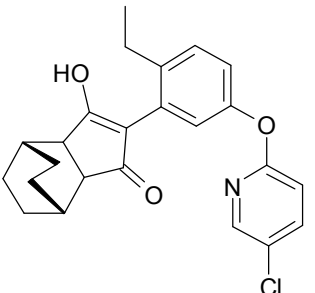
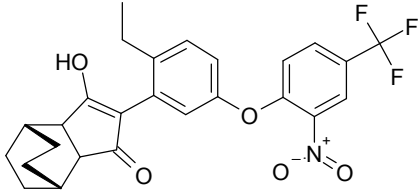
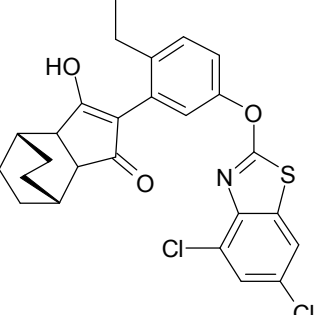
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-76		LCMS (Método B): t _r = 1,52 min, MH ⁺ = 408,1
A-77		LCMS (Método B): t _r = 1,64 min, MH ⁺ = 420,0
A-78		LCMS (Método B): t _r = 1,56 min, MH ⁺ = 398,1
A-79		LCMS (Método B): t _r = 1,47 min, MH ⁺ = 427,0
A-80		LCMS (Método B): t _r = 1,64 min, MH ⁺ = 441,0
A-81		LCMS (Método B): t _r = 1,78 min, MH ⁺ = 418,2

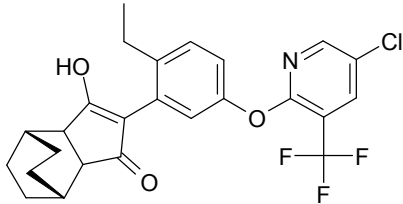
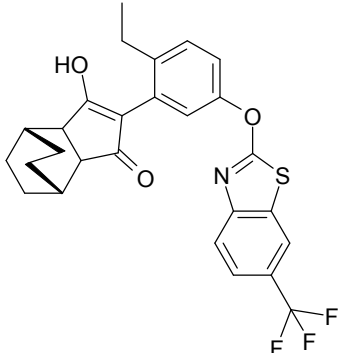
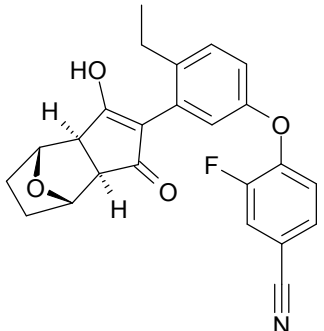
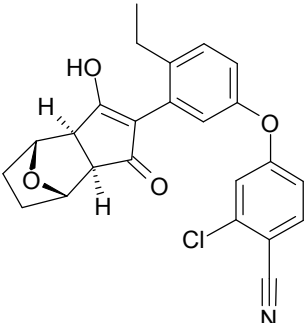
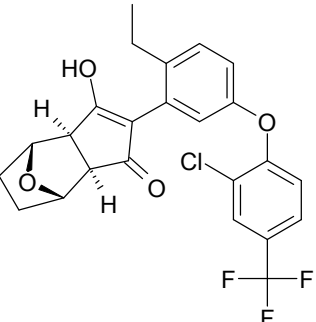
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-82		LCMS (Método B): t _r = 1,71 min, MH ⁺ = 434,1
A-83		LCMS (Método B): t _r = 1,87 min, MH ⁺ = 477,1
A-84		LCMS (Método B): t _r = 1,89 min, MH ⁺ = 521,1
A-85		LCMS (Método B): t _r = 1,89 min, MH ⁺ = 477,1
A-86		LCMS (Método B): t _r = 1,74 min, MH ⁺ = 454,1

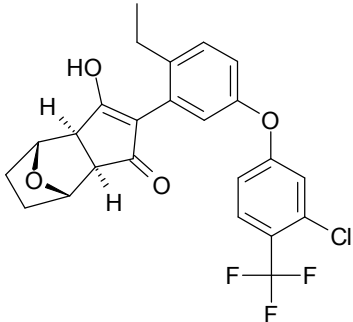
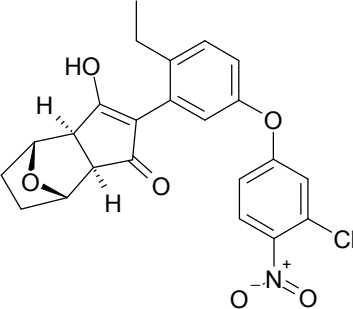
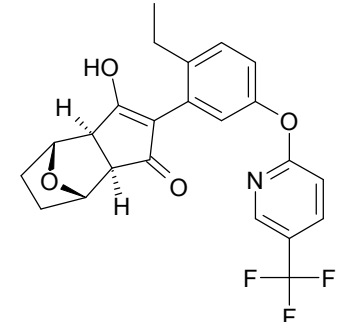
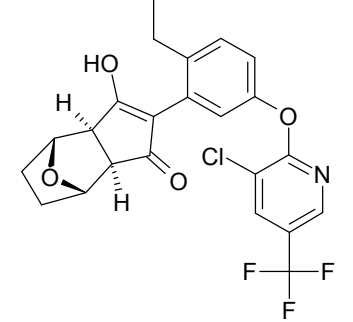
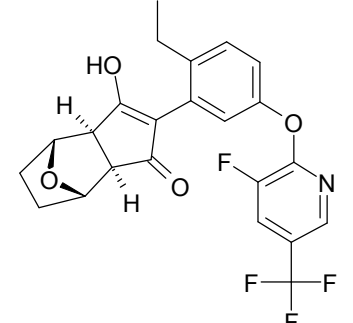
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-87		LCMS (Método B): t _r = 1,69 min, MH ⁺ = 444,2
A-88		LCMS (Método B): t _r = 1,73 min, MH ⁺ = 478,1
A-89		LCMS (Método B): t _r = 1,72 min, MH ⁺ = 462,2
A-90		LCMS (Método B): t _r = 1,74 min, MH ⁺ = 444,1
A-91		LCMS (Método B): t _r = 1,82 min, MH ⁺ = 466,1

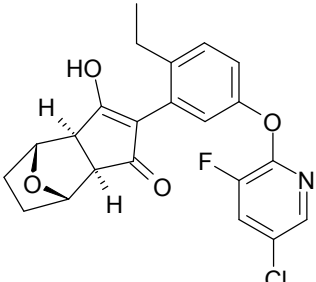
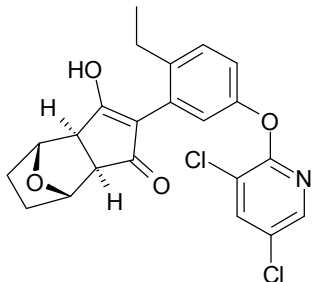
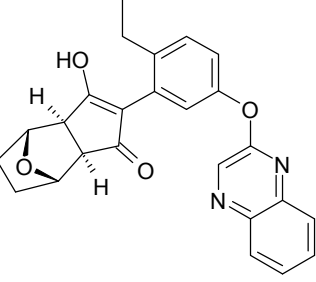
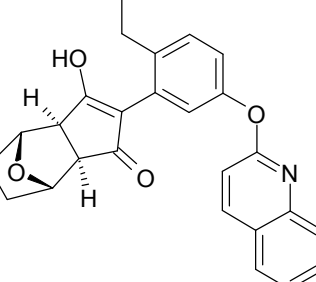
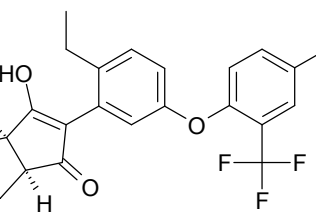
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-92		LCMS (Método B): t _r = 1,51 min, MH ⁺ = 411,1
A-93		LCMS (Método B): t _r = 1,76 min, MH ⁺ = 505,1
A-94		LCMS (Método B): t _r = 1,72 min, MH ⁺ = 468,2
A-95		LCMS (Método B): t _r = 1,61 min, MH ⁺ = 427,2
A-96		LCMS (Método B): t _r = 1,82 min, MH ⁺ = 466,1

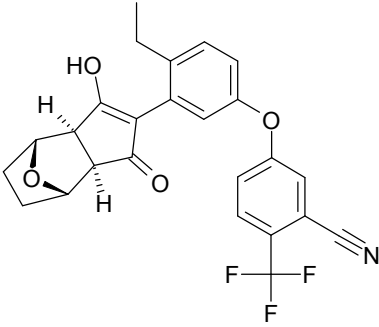
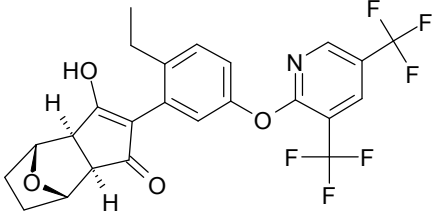
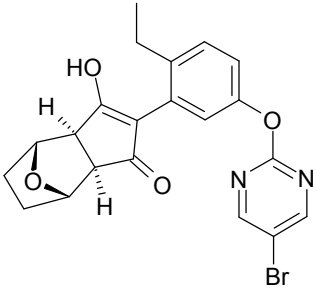
CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-97		LCMS (Método B): t _r = 1,77 min, MH ⁺ = 488,2
A-98		LCMS (Método B): t _r = 1,76 min, MH ⁺ = 468,2
A-99		LCMS (Método B): t _r = 1,81 min, MH ⁺ = 512,2
A-100		LCMS (Método B): t _r = 1,76 min, MH ⁺ = 466,1
A-101		LCMS (Método B): t _r = 1,52 min, MH ⁺ = 455,1

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-102		LCMS (Método B): t _r = 1,66 min, MH ⁺ = 445,2
A-103		LCMS (Método B): t _r = 1,72 min, MH ⁺ = 477,1
A-104		LCMS (Método B): t _r = 1,71 min, MH ⁺ = 462,2
A-105		LCMS (Método B): t _r = 1,77 min, MH ⁺ = 488,2
A-106		LCMS (Método B): t _r = 1,91 min, MH ⁺ = 500,1

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-107		LCMS (Método B): t _r = 1,77 min, MH ⁺ = 478,1
A-108		LCMS (Método B): t _r = 1,84 min, MH ⁺ = 500,1
A-109		LCMS (Método B): t _r = 1,31 min, MH ⁺ = 406,1
A-110		LCMS (Método B): t _r = 1,37 min, MH ⁺ = 422,1
A-111		LCMS (Método B): t _r = 1,52 min, MH ⁺ = 465,1

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-112		LCMS (Método B): t _r = 1,54 min, MH ⁺ = 465,1
A-113		LCMS (Método B): t _r = 1,41 min, MH ⁺ = 442,1
A-114		LCMS (Método B): t _r = 1,34 min, MH ⁺ = 432,1
A-115		LCMS (Método B): t _r = 1,44 min, MH ⁺ = 466,1
A-116		LCMS (Método B): t _r = 1,37 min, MH ⁺ = 450,1

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-117		LCMS (Método B): t _r = 1,32 min, MH ⁺ = 416,1
A-118		LCMS (Método B): t _r = 1,39 min, MH ⁺ = 432,1
A-119		LCMS (Método B): t _r = 1,24 min, MH ⁺ = 415,2
A-120		LCMS (Método B): t _r = 1,31 min, MH ⁺ = 414,2
A-121		LCMS (Método B): t _r = 1,46 min, MH ⁺ = 476,1

CompoundNumber	Estructura	¹ H RMN (CDCl ₃ , a menos que se establezca) u otros datos físicos
A-122		LCMS (Método B): t _r = 1,42 min, MH ⁺ = 456,1
A-123		LCMS (Método B): t _r = 1,49 min, MH ⁺ = 500,1
A-124		LCMS (Método B): t _r = 1,16 min, MH ⁺ = 443,1

5 Debe señalarse que determinados compuestos de la invención existen como una mezcla en cualquier relación de isómeros, incluyendo atropisómeros, arriba señalados, bajo las condiciones utilizadas para obtener los datos de ¹H RMN. En los casos en los que esto ha sucedido, los datos de caracterización se proporcionan para todos los isómeros presentes a temperatura ambiente en el disolvente especificado. A menos que se indique lo contrario, los espectros de protón de RMN se registraron a temperatura ambiente. Compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron utilizando uno de dos métodos descritos a continuación.

10 Método A

Compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron utilizando un Waters 2795 HPLC equipado con una columna Waters Atlantis dC18 (longitud de la columna 20 mm, diámetro interno de la columna 3 mm, tamaño de las partículas 3 micras, temperatura 40 °C), matriz de fotodiodos Waters y Micromass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo utilizando un tiempo de análisis de tres minutos, de acuerdo con la siguiente tabla de gradientes:

15

Tiempo (min)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	90,0	10,0	2,00
0,25	90,0	100	2,00
2,00	10,0	90,0	2,00
2,50	10,0	90,0	2,00

Tiempo (min)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
2,60	90,0	10,0	2,00
3,0	90,0	10,0	2,00

Disolvente A: H₂O que contiene 0.1% de HCOOH
 Disolvente B: CH₃CN que contiene 0.1% de HCOOH

Método B

5 Compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron utilizando un inyector Waters 2777 con una microbomba 1525 de HPLC equipada con una columna Waters Atlantis dC18 IS (longitud de la columna 20 mm, diámetro interno de la columna 3 mm, tamaño de las partículas 3 micras), matriz de fotodiodos Waters 2996, Waters 2420 ELSD y Micromass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo utilizando un tiempo de análisis de tres minutos, de acuerdo con la siguiente tabla de gradientes:

10

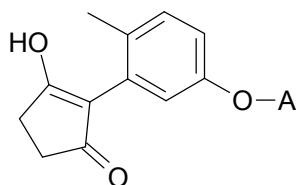
Tiempo (min)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	95,0	5	1,300
2,50	0,0	100	1,300
2,80	0,00	100	1,300
2,90	95,0	5	1,300

Disolvente A: H₂O con un 0.05% de TFA
 Disolvente B: CH₃CN con un 0.05% de TFA

15 Los valores característicos obtenidos para cada uno de los compuestos eran el tiempo de retención (rt registrado en minutos) y el ion molecular (típicamente el catión MH⁺), tal como se enumera en la Tabla T1.

Los compuestos de las siguientes Tablas 1 a 39 se pueden obtener de manera análoga.

La Tabla 1 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



20

en donde A es como se define en la Tabla 1.

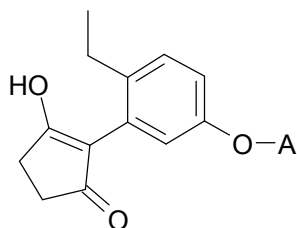
Tabla 1

Compuesto Número	A	Compuesto Número	A
1.001	fenilo	1.002	2-bromofenilo
1.003	2-clorofenilo	1.004	2-cianofenilo
1.005	2-difluorometoxifenilo	1.006	2-fluorofenilo
1.007	2-metoxifenilo	1.008	2-metilfenilo
1.009	2-nitrofenilo	1.010	2-trifluorometoxifenilo
1.011	2-trifluorometilfenilo	1.012	3-bromofenilo
1.013	3-clorofenilo	1.014	3-cianofenilo
1.015	3-difluorometoxifenilo	1.016	3-fluorofenilo
1.017	3-metoxifenilo	1.018	3-metilfenilo
1.019	3-nitrofenilo	1.020	3-trifluorometoxifenilo
1.021	3-trifluorometilfenilo	1.022	4-bromofenilo
1.023	4-clorofenilo	1.024	4-cianofenilo
1.025	4-difluorometoxifenilo	1.026	4-fluorofenilo
1.027	4-metanosulfonilo	1.028	4-metoxifenilo
1.029	4-metilfenilo	1.030	4-nitrofenilo

Compuesto Número	A	Compuesto Número	A
1.031	4-trifluorometoxifenilo	1.032	4-trifluorometilfenilo
1.033	4-bromo-2-clorofenilo	1.034	2,4-diclorofenilo
1.035	2-cloro-4-cianofenilo	1.036	2-cloro-4-difluorometoxifenilo
1.037	2-cloro-4-fluorofenilo	1.038	2-cloro-4-metoxifenilo
1.039	2-cloro-4-metilfenilo	1.040	2-cloro-4-nitrofenilo
1.041	2-cloro-4-trifluorometoxifenilo	1.042	2-cloro-4-trifluorometilfenilo
1.043	4-bromo-3-clorofenilo	1.044	3,4-diclorofenilo
1.045	3-cloro-4-cianofenilo	1.046	3-cloro-4-difluorometoxifenilo
1.047	3-cloro-4-fluorofenilo	1.048	3-cloro-4-metoxifenilo
1.049	3-cloro-4-metilfenilo	1.050	3-cloro-4-nitrofenilo
1.051	3-cloro-4-trifluorometoxifenilo	1.052	3-cloro-4-trifluorometilfenilo
1.053	2-bromo-4-clorofenilo	1.054	4-cloro-2-difluorometoxifenilo
1.055	4-cloro-2-cianofenilo	1.056	4-cloro-2-metoxifenilo
1.057	4-cloro-2-fluorofenilo	1.058	4-cloro-2-nitrofenilo
1.059	4-cloro-2-metilfenilo	1.060	4-cloro-2-trifluorometilfenilo
1.061	4-cloro-2-trifluorometoxifenilo	1.062	4-cloro-3-trifluorometoxifenilo
1.063	3-bromo-4-clorofenilo	1.064	4-cloro-3-difluorometoxifenilo
1.065	4-cloro-3-cianofenilo	1.066	4-cloro-3-metoxifenilo
1.067	4-cloro-3-fluorofenilo	1.068	4-cloro-3-nitrofenilo
1.069	4-cloro-3-metilfenilo	1.070	4-cloro-3-trifluorometilfenilo
1.071	4-bromo-2-fluorofenilo	1.072	2-difluoro-4-difluorometoxifenilo
1.073	4-ciano-2-fluorofenilo	1.074	2-fluoro-4-metoxifenilo
1.075	2,4-fluorofenilo	1.076	2-fluoro-4-nitrofenilo
1.077	2-fluoro-4-metilfenilo	1.078	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo
1.079	2-fluoro-4-trifluorometoxifenilo	1.080	4-bromo-3-fluorofenilo
1.081	4-ciano-3-fluorofenilo	1.082	3-difluoro-4-difluorometoxifenilo
1.083	3,4-fluorofenilo	1.084	3-fluoro-4-metoxifenilo
1.085	3-fluoro-4-metilfenilo	1.086	3-fluoro-4-nitrofenilo
1.087	3-fluoro-4-trifluorometoxifenilo	1.088	3-fluoro-4-trifluorometilfenilo
1.089	4-cloro-2,3-difluorofenilo	1.090	4-cloro-2,5-difluorofenilo
1.091	4-cloro-2,6-difluorofenilo	1.092	4-cloro-3,5-difluorofenilo
1.093	2,4-dicloro-3-fluorofenilo	1.094	2,4-dicloro-5-fluorofenilo
1.095	2,4-dicloro-6-fluorofenilo	1.096	2,3,4-trifluorofenilo
1.097	2,4,6-trifluorofenilo	1.098	2,4,5-trifluorofenilo
1.099	3,4,5-trifluorofenilo	1.100	pentafluorofenilo
1.101	2-bromo-4-cianofenilo	1.102	3-bromo-4-cianofenilo
1.103	4-bromo-2-cianofenilo	1.104	4-bromo-3-cianofenilo
1.105	2-ciano-4-nitrofenilo	1.106	3-ciano-4-nitrofenilo
1.107	2-ciano-4-trifluorometilfenilo	1.108	3-ciano-4-trifluorometilfenilo
1.109	2,4-dicianofenilo	1.110	3,4-dicianofenilo
1.111	3-cloropiridin-2-ilo	1.112	4-cloropiridin-2-ilo
1.113	5-cloropiridin-2-ilo	1.114	6-cloropiridin-2-ilo
1.115	2-cloropiridin-3-ilo	1.116	4-cloropiridin-3-ilo
1.117	5-cloropiridin-3-ilo	1.118	6-cloropiridin-3-ilo
1.119	2-cloropiridin-4-ilo	1.120	3-cloropiridin-4-ilo
1.121	3,4-dicloropiridin-2-ilo	1.122	3,5-dicloropiridin-2-ilo
1.123	3,6-dicloropiridin-2-ilo	1.124	2,5-dicloropiridin-3-ilo
1.125	2,6-dicloropiridin-3-ilo	1.126	2,3-dicloropiridin-4-ilo
1.127	2,5-dicloropiridin-4-ilo	1.128	3,5,6-tricloropiridin-2-ilo
1.129	3-fluoropiridin-2-ilo	1.130	4-fluoropiridin-2-ilo
1.131	5-fluoropiridin-2-ilo	1.132	6-fluoropiridin-2-ilo
1.133	2-fluoropiridin-3-ilo	1.134	4-fluoropiridin-3-ilo
1.135	5-fluoropiridin-3-ilo	1.136	6-fluoropiridin-3-ilo
1.137	2-fluoropiridin-4-ilo	1.138	3-fluoropiridin-4-ilo
1.139	3,4-difluoropiridin-2-ilo	1.140	3,5-difluoropiridin-2-ilo
1.141	3,6-difluoropiridin-2-ilo	1.142	2,5-difluoropiridin-3-ilo
1.143	2,6-difluoropiridin-3-ilo	1.144	2,3-difluoropiridin-4-ilo
1.145	2,5-difluoropiridin-4-ilo	1.146	3,5,6-trifluoropiridin-2-ilo
1.147	3-trifluorometilpiridin-2-ilo	1.148	4-trifluorometilpiridin-2-ilo
1.149	5-trifluorometilpiridin-2-ilo	1.150	6-trifluorometilpiridin-2-ilo
1.151	2-trifluorometilpiridin-3-ilo	1.152	4-trifluorometilpiridin-3-ilo

Compuesto Número	A	Compuesto Número	A
1.153	5-trifluorometilpiridin-3-ilo	1.154	6-trifluorometilpiridin-3-ilo
1.155	2-trifluorometilpiridin-4-ilo	1.156	3-trifluorometilpiridin-4-ilo
1.157	4-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo	1.158	5-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo
1.159	6-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo	1.160	3-cloro-4-fluoropiridin-2-ilo
1.161	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ilo	1.162	3-cloro-6-fluoropiridin-2-ilo
1.163	3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo	1.164	3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo
1.165	6-fluoro-3,4,5-tricloropiridin-2-ilo	1.166	4-metil-3,5,6-trifluoropiridin-2-ilo
1.167	pirimidin-2-ilo	1.168	5-fluoropirimidin-2-ilo
1.169	5-cloropirimidin-2-ilo	1.170	5-bromopirimidin-2-ilo
1.171	6-cloropiridazin-3-ilo	1.172	6-bromopiridazin-3-ilo
1.173	quinolin-2-ilo	1.174	6-fluoroquinolin-2-ilo
1.175	7-fluoroquinolin-2-ilo	1.176	6-cloroquinolin-2-ilo
1.177	7-cloroquinolin-2-ilo	1.178	6-bromoquinolin-2-ilo
1.179	7-bromoquinolin-2-ilo	1.180	6-trifluorometilquinolin-2-ilo
1.181	7-trifluorometilquinolin-2-ilo	1.182	quinoxalin-2-ilo
1.183	6-fluoroquinoxalin-2-ilo	1.184	7-fluoroquinoxalin-2-ilo
1.185	6-cloroquinoxalin-2-ilo	1.186	7-cloroquinoxalin-2-ilo
1.187	6-bromoquinoxalin-2-ilo	1.188	7-bromoquinoxalin-2-ilo
1.189	6-trifluorometilquinoxalin-2-ilo	1.190	7-trifluorometilquinoxalin-2-ilo
1.191	quinazolin-2-ilo	1.192	6-fluoroquinazolin-2-ilo
1.193	7-fluoroquinazolin-2-ilo	1.194	6-cloroquinazolin-2-ilo
1.195	7-cloroquinazolin-2-ilo	1.196	6-bromoquinazolin-2-ilo
1.197	7-bromoquinazolin-2-ilo	1.198	6-trifluorometilquinazolin-2-ilo
1.199	7-trifluorometilquinazolin-2-ilo	1.200	benzoxazol-2-ilo
1.201	5-fluorobenzoxazol-2-ilo	1.202	6-fluorobenzoxazol-2-ilo
1.203	5-clorobenzoxazol-2-ilo	1.204	6-clorobenzoxazol-2-ilo
1.205	5-bromobenzoxazol-2-ilo	1.206	6-bromobenzoxazol-2-ilo
1.207	5-trifluorometilbenzoxazol-2-ilo	1.208	6-trifluorometilbenzoxazol-2-ilo
1.209	benzotiazol-2-ilo	1.210	5-fluorobenzotiazol-2-ilo
1.211	6-fluorobenzotiazol-2-ilo	1.212	5-clorobenzotiazol-2-ilo
1.213	6-clorobenzotiazol-2-ilo	1.214	5-bromobenzotiazol-2-ilo
1.215	6-bromobenzotiazol-2-ilo	1.216	5-trifluorometilbenzotiazol-2-ilo
1.217	6-trifluorometilbenzotiazol-2-ilo	1.218	benzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.219	6-fluorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo	1.220	7-fluorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.221	6-clorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo	1.222	7-clorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.223	6-bromobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo	1.224	7-bromobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.225	6-trifluorometilbenzo[1,2,4]-triazin-3-ilo	1.226	7-trifluorometilbenzo[1,2,4]-triazin-3-ilo

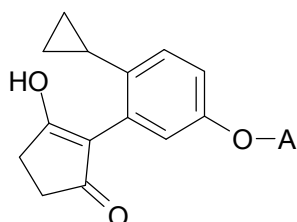
La Tabla 2 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

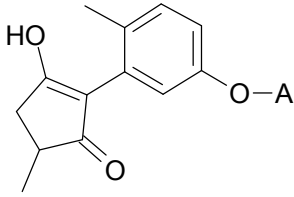
5

La Tabla 3 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



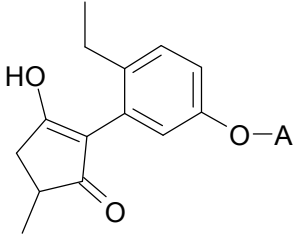
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 4 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



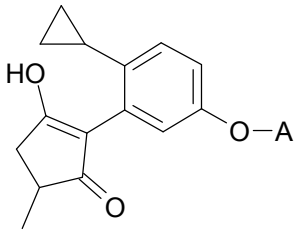
en donde A es como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla 5 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



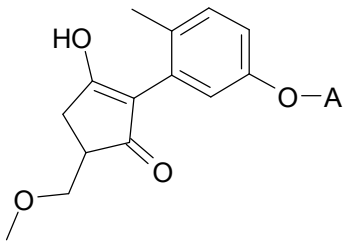
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 6 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



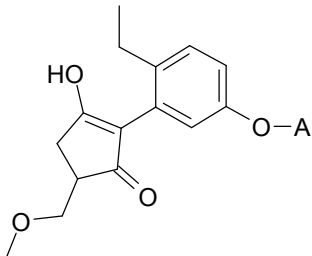
10 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 7 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



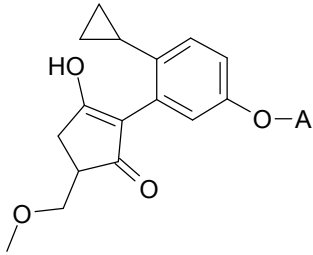
15 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 8 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



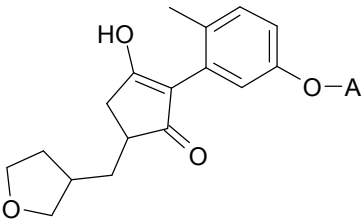
20 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 9 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

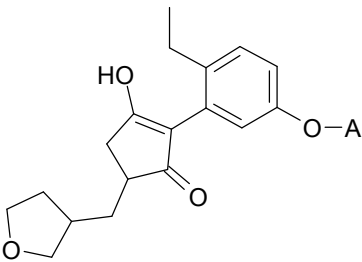
La Tabla 10 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



5

en donde A es como se define en la Tabla 1.

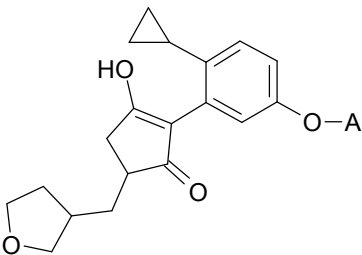
La Tabla 11 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

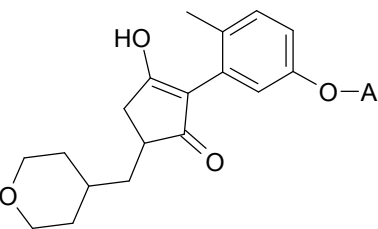
La Tabla 12 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



15

en donde A es como se define en la Tabla 1.

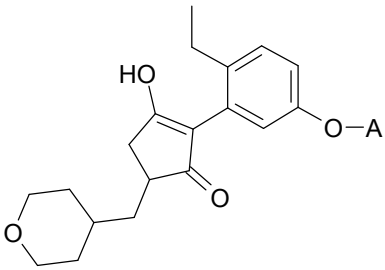
La Tabla 13 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

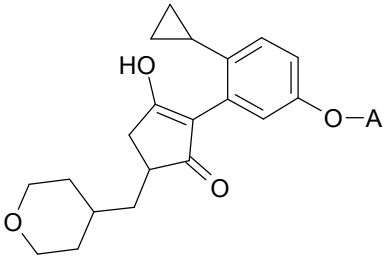
20

La Tabla 14 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

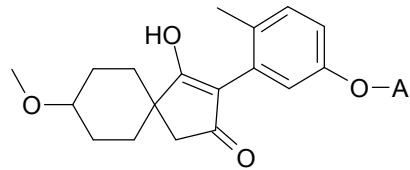
La Tabla 15 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



5

en donde A es como se define en la Tabla 1.

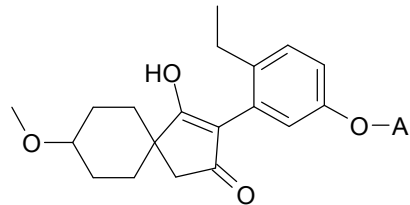
La Tabla 16 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

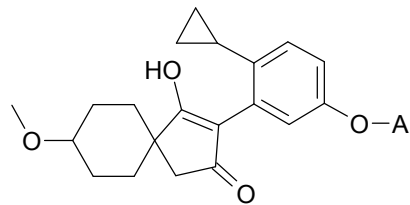
La Tabla 17 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



15

en donde A es como se define en la Tabla 1.

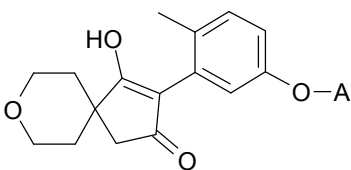
La Tabla 18 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

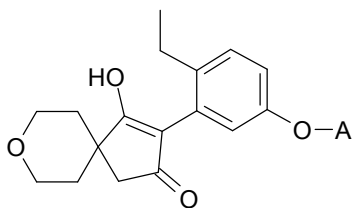
20

La Tabla 19 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



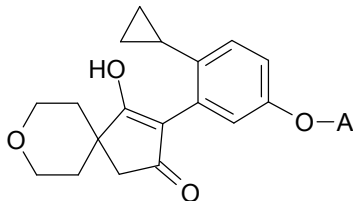
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 20 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



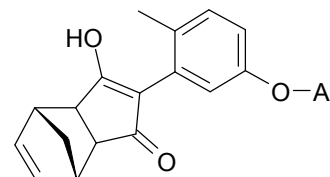
en donde A es como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla 21 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



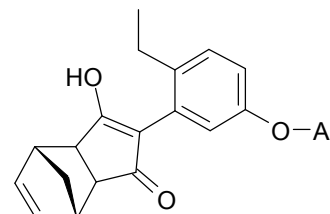
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 22 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



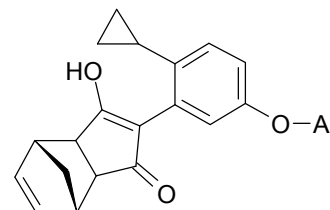
10 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 23 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



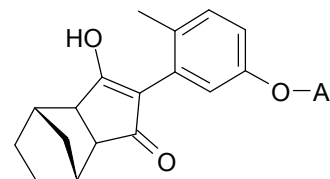
15 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 24 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



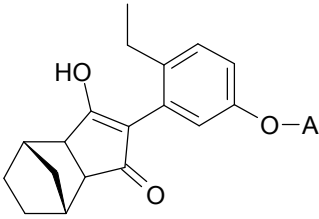
20 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 25 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



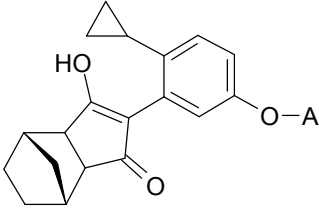
en donde A es como se define en la Tabla 1.

25 La Tabla 26 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

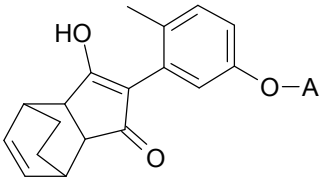
La Tabla 27 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



5

en donde A es como se define en la Tabla 1.

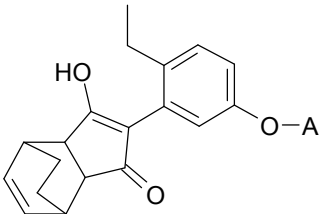
La Tabla 28 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

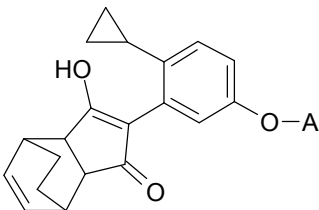
La Tabla 29 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



15

en donde A es como se define en la Tabla 1.

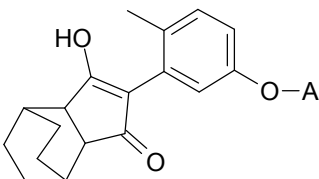
La Tabla 30 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

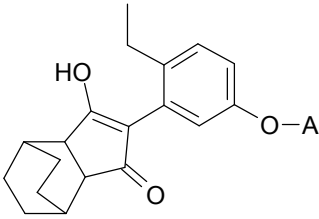
20

La Tabla 31 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



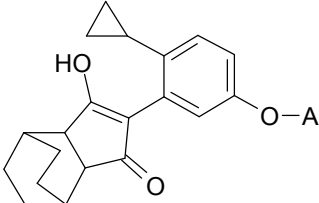
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 32 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

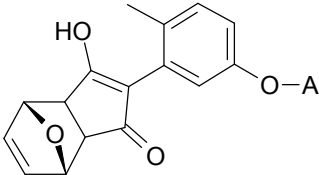
La Tabla 33 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



5

en donde A es como se define en la Tabla 1.

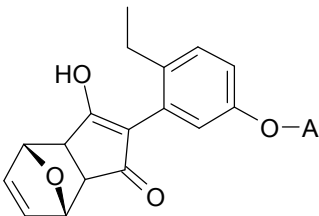
La Tabla 34 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

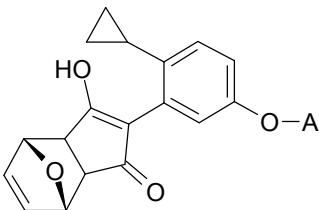
La Tabla 35 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



15

en donde A es como se define en la Tabla 1.

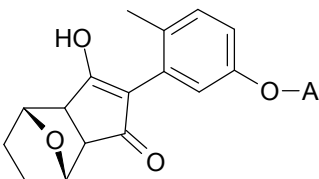
La Tabla 36 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

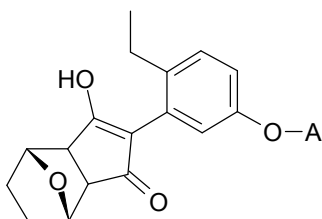
20

La Tabla 37 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



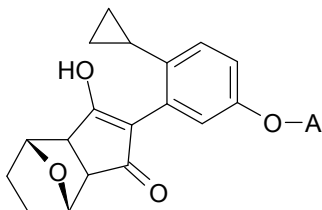
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 38 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 39 se refiere a los compuestos del siguiente tipo



5

en donde A es como se define en la Tabla 1.

Ejemplos Biológicos:

10

Se sembraron semillas de varias especies de prueba en suelo estándar en macetas. Después del cultivo durante un día (pre-emergencia) o después de 8 días de cultivo (post-emergencia) bajo condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche, 14 horas de luz, 65% de humedad), las plantas se pulverizaron con una disolución de pulverización acuosa derivada de la formulación del ingrediente activo técnico en disolución de acetona / agua (50:50) que contiene Tween 20 al 0.5% (monolaurato de polioxietilen-sorbitán, CAS RN 9005-64-5). Posteriormente, las plantas de prueba se cultivaron en un invernadero en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se regaron dos veces al día. Se evaluó la prueba después de 13 días para la pre- y la posemergencia (100 = daño total en la planta; 0 = sin daño en la planta).

15

Plantas de prueba:

20

Lolium perenne (LOLPE), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG) y *Avena fatua* (AVEFA).
Actividad pre-emergencia

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-1	250	70	70	70	70
A-2	250	60	60	60	30
A-3	250	70	60	90	30
A-4	250	90	80	100	90
A-5	250	40	30	80	0

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-6	250	100	100	100	90
A-7	250	60	60	70	50
A-8	250	40	0	40	0
A-9	250	100	80	70	90
A-10	250	30	40	60	20
A-11	250	80	30	100	50
A-12	250	70	60	70	30
A-13	250	60	50	80	20
A-14	250	90	60	100	60
A-15	250	10	30	100	0
A-16	250	70	40	90	30
A-17	250	10	10	30	20
A-18	250	70	50	80	50
A-19	250	90	90	90	80
A-20	250	50	50	60	10

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-21	250	30	20	40	0
A-22	250	80	40	90	30
A-23	250	30	0	80	0
A-24	250	40	10	50	30
A-25	250	70	20	70	30
A-26	250	20	0	80	0
A-27	250	40	20	60	0
A-28	250	0	0	20	0
A-29	250	0	0	50	0
A-30	250	70	30	80	20
A-31	250	50	20	90	0
A-32	250	40	0	60	0
A-33	250	50	20	50	0
A-34	250	50	20	70	30
A-35	250	60	30	20	10

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-37	250	10	10	20	0
A-39	250	0	20	40	30
A-40	250	10	0	40	0
A-41	250	0	0	30	0
A-42	250	0	0	30	0
A-43	250	50	40	60	10
A-44	250	90	80	80	80
A-45	250	90	90	100	90
A-46	250	80	80	100	60
A-47	250	70	60	90	30
A-48	250	80	80	90	80
A-49	250	100	90	100	90
A-50	250	100	100	100	100
A-51	250	100	100	90	90
A-52	250	0	0	0	0

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-53	250	80	80	100	0
A-54	250	0	0	0	0
A-56	250	50	30	60	20
A-60	250	80	80	100	70
A-67	250	100	60	100	40
A-70	250	20	0	60	10
A-71	250	100	90	100	80
A-72	250	70	40	100	30
A-75	250	80	30	100	20
A-76	250	50	20	100	0
A-77	250	20	20	90	0
A-78	250	100	70	100	70
A-79	250	70	40	90	20
A-80	250	50	0	80	10
A-86	250	20	0	20	0

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-87	250	90	80	100	30
A-88	250	100	90	100	40
A-89	250	100	50	100	70
A-90	250	100	70	100	70
A-93	250	60	10	100	0
A-94	250	20	0	50	0
A-95	250	100	70	100	30
A-96	250	90	30	90	0
A-97	250	30	0	70	0
A-98	250	40	0	40	0
A-99	250	90	70	100	50
A-100	250	40	10	80	0
A-104	250	60	0	90	0
A-105	250	40	10	60	0
A-108	250	50	30	80	10

ES 2 640 592 T3

Actividad post-emergencia

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-1	250	80	100	100	80
A-2	250	100	100	100	100
A-3	250	70	90	100	90
A-4	250	90	100	100	100
A-5	250	30	30	80	10
A-6	250	90	80	100	90
A-7	250	60	60	100	80
A-8	250	20	20	70	20
A-9	250	70	90	90	100
A-10	250	90	90	90	100
A-11	250	70	80	100	90
A-12	250	70	100	100	50
A-13	250	90	90	100	100
A-14	250	90	100	100	100

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-15	250	30	30	80	30
A-16	250	70	70	100	90
A-17	250	30	10	70	10
A-18	250	70	90	100	90
A-19	250	50	80	100	60
A-20	250	20	30	70	0
A-21	250	20	40	70	0
A-22	250	40	50	100	80
A-23	250	20	50	60	0
A-24	250	60	60	100	70
A-25	250	60	50	90	40
A-26	250	30	60	80	80
A-27	250	80	60	80	70
A-28	250	0	0	80	0
A-29	250	0	60	100	0

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-30	250	10	60	100	20
A-31	250	40	100	100	80
A-32	250	30	90	100	90
A-33	250	0	90	100	90
A-34	250	40	80	90	90
A-35	250	20	10	30	20
A-37	250	30	20	80	20
A-39	250	10	10	60	0
A-40	250	10	10	30	10
A-41	250	20	0	70	10
A-42	250	10	0	70	0
A-43	250	30	60	100	30
A-44	250	90	80	80	80
A-45	250	90	90	100	90
A-46	250	80	80	100	60

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-47	250	70	60	90	30
A-48	250	80	80	90	80
A-49	250	100	90	100	90
A-50	250	100	100	100	100
A-51	250	100	100	90	90
A-52	250	0	0	50	0
A-53	250	90	80	90	80
A-54	250	0	0	80	10
A-56	250	20	20	70	0
A-60	250	80	90	100	80
A-67	250	80	70	100	20
A-70	250	10	0	60	0
A-71	250	100	100	100	100
A-72	250	30	50	100	30
A-75	250	20	10	40	0

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-76	250	30	50	80	80
A-77	250	30	20	80	0
A-78	250	90	100	100	90
A-79	250	20	0	50	0
A-80	250	30	40	80	50
A-86	250	10	10	100	10
A-87	250	90	90	100	100
A-88	250	90	90	100	100
A-89	250	100	100	100	100
A-90	250	100	90	100	100
A-93	250	50	60	100	60
A-94	250	20	30	80	0
A-95	250	90	80	100	90
A-96	250	50	90	100	90
A-97	250	10	10	60	10

ES 2 640 592 T3

CompoundNumber	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-98	250	30	30	90	20
A-99	250	80	100	100	100
A-100	250	30	30	90	10
A-104	250	40	30	100	30
A-105	250	30	40	90	40
A-108	250	70	90	100	90

C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅amino o dialquil C₂-C₈amino; o benciloxi o fenoxi, en donde los grupos bencilo y fenilo pueden estar a su vez sustituidos con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y Rⁿ es alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₃-C₁₀, alquinilo C₃-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅amino-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈amino-alquilo (C₁-C₅), cicloalquil C₃-C₇-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅-alquilo (C₁-C₅), alqueniil C₃-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquiniil C₃-C₅oxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅tio-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfinil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅sulfonil-alquilo (C₂-C₈, alquiliden C₁-C₅aminoxi-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅carbonil-alquilo (C₁-C₅), aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), dialquil C₂-C₈aminocarbonil-alquilo (C₁-C₅), alquil C₁-C₅carbonilamino-alquilo (C₁-C₅), N-alquil (C₁-C₅)carbonil-N-alquil (C₁-C₅)amino-alquilo (C₁-C₅), trialquil C₃-C₆silil-alquilo (C₁-C₅), fenil-alquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxialquilo (C₁-C₅), (en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi-alquilo (C₁-C₅) (en donde el heterarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃tio, alquil C₁-C₃sulfinilo, alquil C₁-C₃sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₆; fenilo o fenilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro; y en donde:

"arilo" significa fenilo o naftilo;
 "carbociclilo" significa arilo, cicloalquilo o cicloalquenilo;
 "heteroarilo" significa un sistema de anillo aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un anillo sencillo o en dos anillos condensados; y

«heterociclilo» significa un sistema de anillo no aromático, monocíclico o bicíclico que contiene hasta 7 átomos, incluyendo uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N; y en donde:

cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto alquilo son uno o más de halógeno, nitro, ciano, cicloalquilo C₃-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo C₅-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), hidroxilo, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), trialquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiloxi C₃-C₇ (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alqueniiloxi C₃-C₁₀, alquiniiloxi C₃-C₁₀, mercapto, alquil C₁-C₁₀tio, haloalquil C₁-C₁₀tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃-C₇tio (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)silil-(alquil C₁-C₆)tio, ariltio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, arilsulfinilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), trialquil (C₁-C₄)sililo, arildialquil (C₁-C₄)sililo, alquil (C₁-C₄)diarilsililo, triarilsililo, aril-(alquil C₁-C₄)tio-alquilo (C₁-C₄), ariloxi-alquilo (C₁-C₄), formilo, alquil C₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, alcoxi C₁-C₁₀carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, N-(alquil C₁-C₃)-N-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil(C₁-C₆)aminocarboniloxi, alquil C₁-C₆iminooxi, alqueniil C₃-C₆oxiimino, ariloxiimino, arilo (por sí mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (por sí mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi (en donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterocicliloxi (en donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆amino, dialquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆carbonilamino, N-alquil (C₁-C₆)carbonil-N-alquil (C₁-C₆)amino, alqueniil C₂-C₆carbonilo, alquiniil C₂-C₆carbonilo, alqueniil C₃-C₆oxicarbonilo, alquiniil C₃-C₆oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), o arilcarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido);

cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo son los sustituyentes opcionales tal como se definen para un resto alquilo; cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo son alquilo C₁-C₃ o son los sustituyentes opcionales tal como se definen para un resto alquilo; y, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclilo se seleccionan independientemente de halógeno, nitro, ciano, tiocianógeno, isotiocianato, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo (C₁-C₆), alqueniil C₂-C₆, haloalqueniil C₂-C₆, alquiniil C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alcoxi (C₁-C₁₀), trialquil (C₁-C₄)silil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi C₁-C₆-carbonil-alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, aril-alcoxi (C₁-C₄) (en que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆), cicloalquil C₃-C₇oxi (en que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alqueniil C₃-C₁₀oxi, alquiniil C₃-C₁₀oxi, mercapto, alquil C₁-C₁₀tio, haloalquil C₁-C₁₀tio, aril-alquil (C₁-C₄)tio, cicloalquil C₃-C₇tio (en que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquil (C₁-C₄)silil-alquil (C₁-C₆)tio, ariltio, alquil C₁-C₆sulfinilol, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, arilsulfinilo, trialquil (C₁-C₄)sililo, arildialquil (C₁-C₄)sililo, alquil C₁-C₄diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, C₁-C₁₀alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁-C₆aminocarbonilo, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, N-(alquil C₁-C₃)-N-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquil C₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil (C₁-C₆)aminocarboniloxi,

arilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroarilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterociclilo (por sí mismo opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en que el arilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroariloxi (en que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloxi (en que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), amino, alquil C₁-C₆amino, dialquil (C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆carbonilamino, *N*-alquil (C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil (C₁-C₆)amino y arilcarbonilo (en que el grupo arilo está por sí mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆); o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo están cicladas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, por sí mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆;

10 y en donde grupos heterociclilo sustituidos están sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆tio, alquil C₁-C₆sulfinilo, alquil C₁-C₆sulfonilo, nitro y ciano.

15 2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R¹ es etilo.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, heterociclilo de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido o heterociclil-alquilo C₁-C₂ de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido; o R⁴ y R⁵, o R⁶ y R⁷, junto con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo o heterociclilo de cinco o seis miembros, saturado o insaturado, opcionalmente sustituido, en donde el heterociclo contiene uno o dos átomos de oxígeno; o R⁵ y R⁶, con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo de cinco o seis miembros, saturado o insaturado, opcionalmente sustituido, que está opcionalmente puentado por alquil C₁-C₂diilo o con oxígeno.

25 4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R⁴ y R⁷ son hidrógeno; y R⁵ y R⁶, con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo de seis miembros, saturado o insaturado, que está puentado con alquil C₁-C₂diilo o con oxígeno.

30 5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde "arilo".significa fenilo.

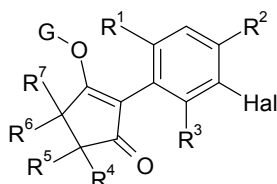
6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde, cuando G es un grupo latenciador, entonces G es -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b, y los significados de X^a, Ra, X^b, X^c y R^b son como se definen en la reivindicación 1.

35 7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde G es hidrógeno, un metal alcalino o un metal alcalinotérreo.

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde:
 R¹ es etilo o ciclopropilo;
 R² y R³ son hidrógeno; y
 R⁴, R⁷, R⁵ y R⁶ son hidrógeno o R⁴ y R⁷ son hidrógeno y R⁵ y R⁶, con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo de seis miembros, saturado, que está puentado por alquil C₁-C₂diilo o por oxígeno; y
 A es fenilo sustituido con fluoro, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, ciano o nitro;
 45 o A es piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, benzotiazolilo, quinolinilo, en cada caso sustituido con fluoro, cloro, bromo, trifluorometilo, metoxi o nitro; y
 G es hidrógeno.

9. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en el que G es hidrógeno, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (BB)

50

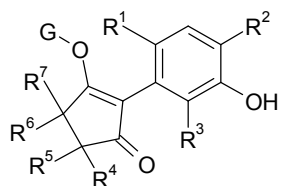


(BB),

en donde Hal es bromo o yodo y R¹ a R⁷ son como se define en la reivindicación 1, con un compuesto A-OH, en donde A es como se define en la reivindicación 1, en presencia de un catalizador, un ligando o aditivo, una base y un disolvente.

55

10. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en el que G es hidrógeno, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (CC)



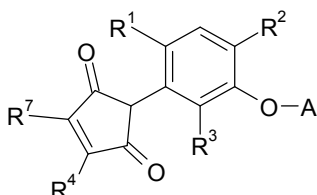
(CC),

5

en donde R¹ a R⁷ son como se define en la reivindicación 1, con un compuesto A,-Hal, en donde A es como se define en la reivindicación 1 y Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, en presencia de una base y un disolvente, y en presencia o ausencia de un catalizador y un ligando.

10

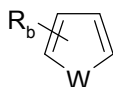
11. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde G es hidrógeno y R⁵ y R⁶, junto con los átomos a los que están unidos, forman un carbociclilo insaturado, opcionalmente sustituido, que está puenteado adicionalmente por alquil C₁-C₂diilo u oxígeno, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (M)



(M),

15

en donde A, R¹ a R⁴ y R⁷ son como se define en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (O),



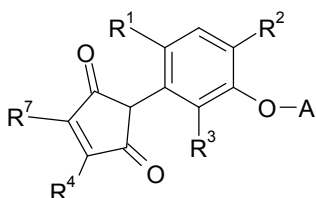
(O),

20

en donde W es alquil C₁-C₂ diilo u oxígeno y R_b es hidrógeno o un sustituyente adecuado para preparar el compuesto de fórmula I, en presencia de un catalizador y un disolvente.

25

12. Un compuesto de fórmula (M)



(M),

en donde A, R¹ a R⁴ y R⁷ son como se define en la reivindicación 1.

30

13. Una composición herbicida que, además de comprender adyuvantes de la formulación, comprende una cantidad efectiva como herbicida de un compuesto de fórmula I según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8.

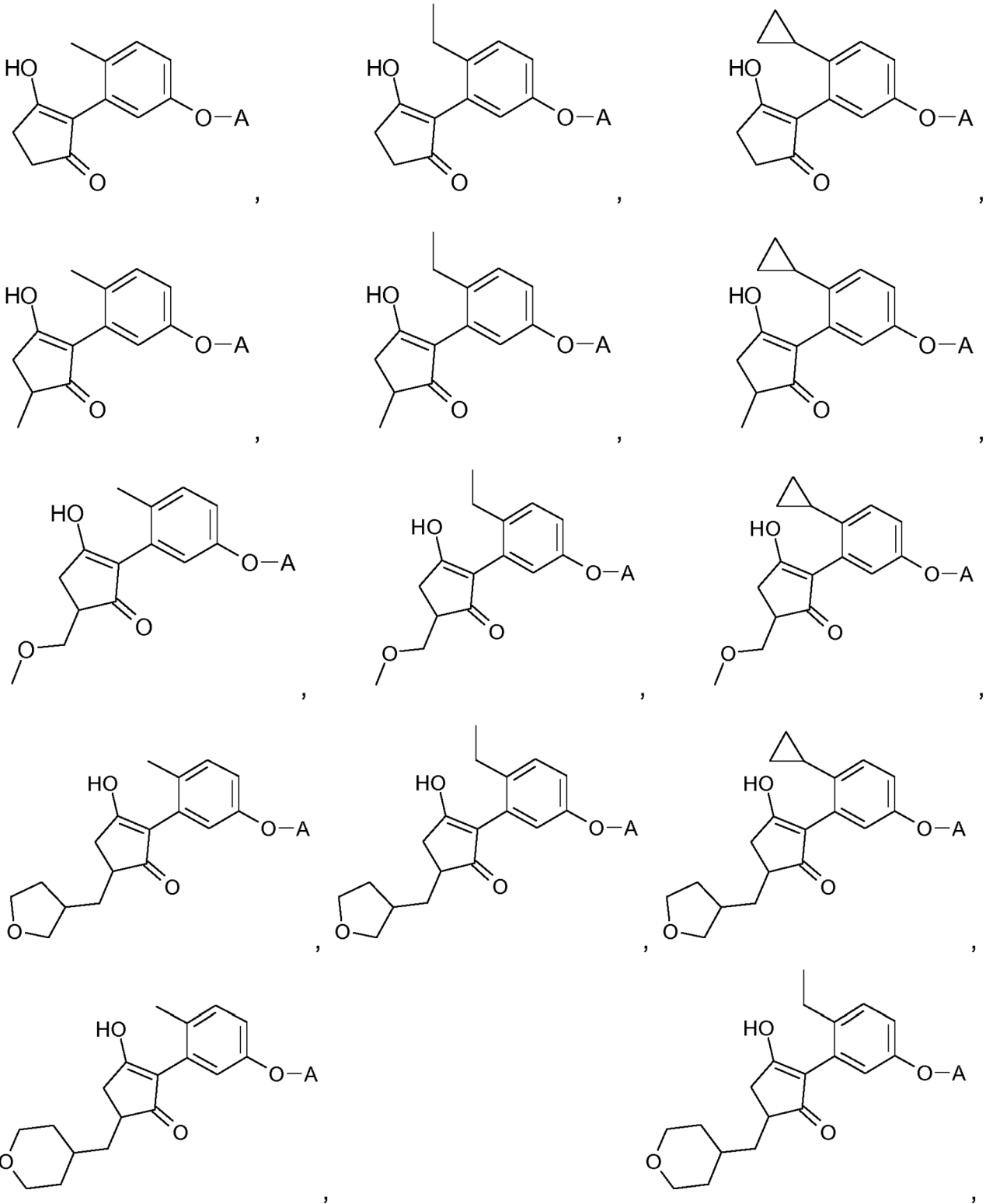
35

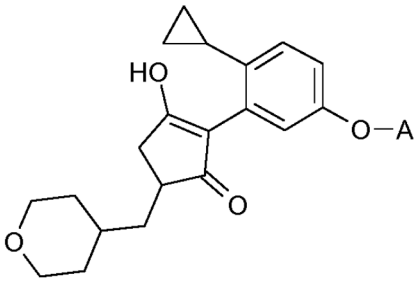
14. Un método para controlar gramíneas y malezas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad eficaz como herbicida de un compuesto de fórmula I según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, o de una composición que comprende tal compuesto, a las plantas o al emplazamiento de estas.

15. Un método de acuerdo con la reivindicación 14, que comprende aplicar una cantidad eficaz como herbicida de la composición que comprende el compuesto a las plantas o al lugar de las mismas, y en el que los cultivos de plantas útiles son trigo, cebada, arroz, maíz, colza, remolacha azucarera, caña de azúcar, soja, algodón, girasol o cacahuate.

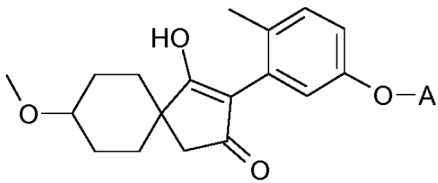
5

16. Un compuesto, que es uno de los siguientes tipos:

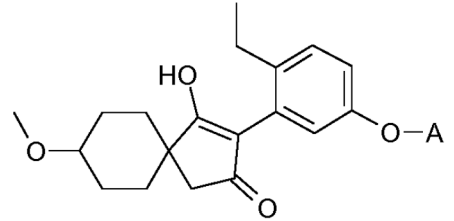




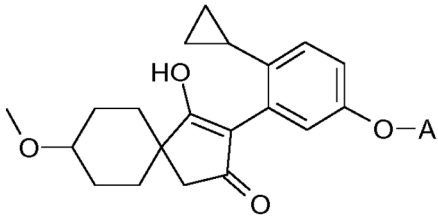
,



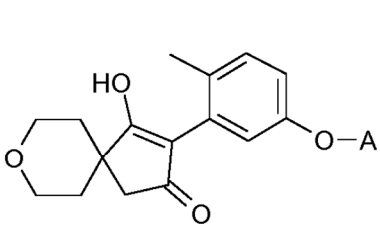
,



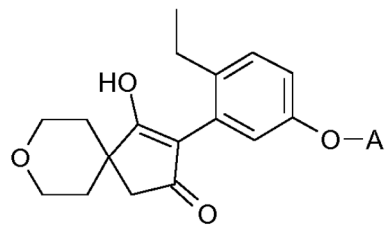
,



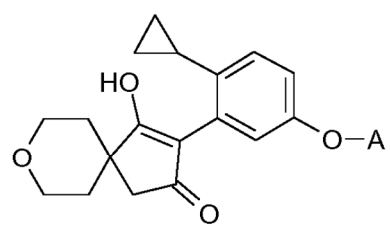
,



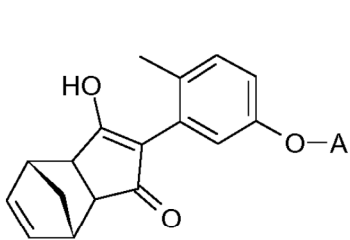
,



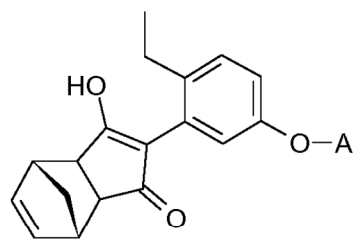
,



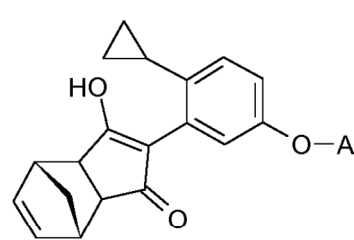
,



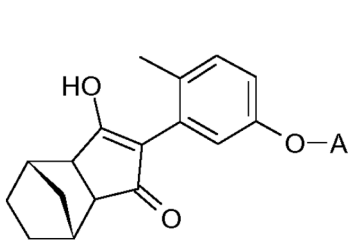
,



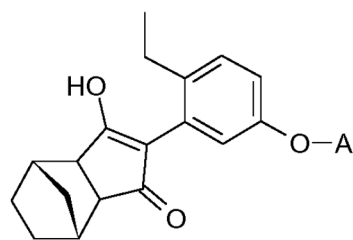
,



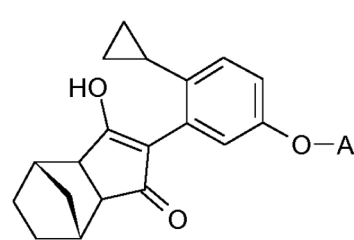
,



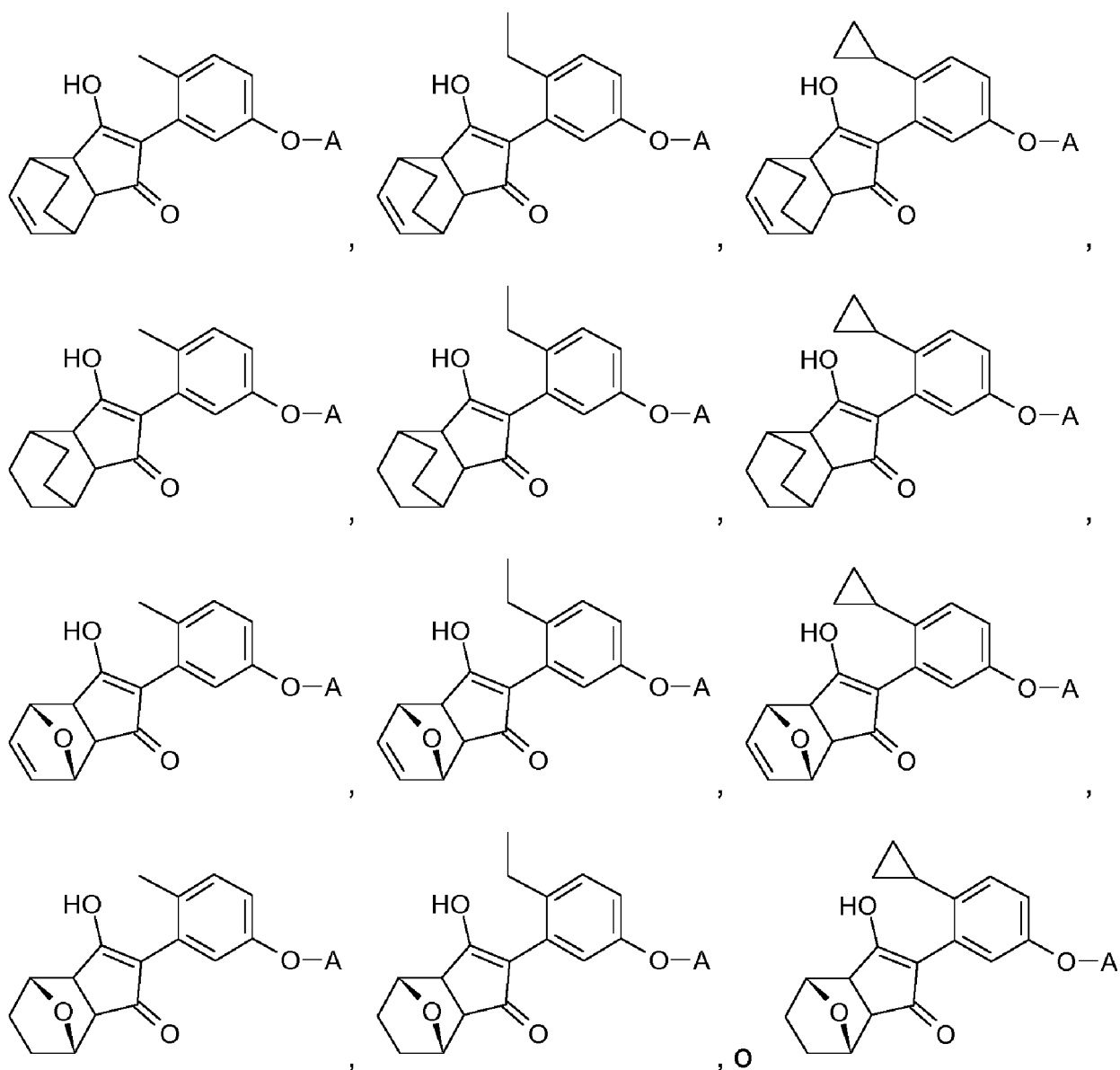
,



,



,



5 y en donde A es fenilo, 2-bromofenilo, 2-clorofenilo, 2-cianofenilo, 2-difluorometoxifenilo, 2-fluorofenilo, 2-metoxifenilo, 2-
 metilfenilo, 2-nitrofenilo, 2-trifluorometoxifenilo, 2-trifluorometilfenilo, 3-bromofenilo, 3-clorofenilo, 3-cianofenilo, 3-
 difluorometoxifenilo, 3-fluorofenilo, 3-metoxifenilo, 3-metilfenilo, 3-nitrofenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 3-
 10 trifluorometilfenilo, 4-bromofenilo, 4-clorofenilo, 4-cianofenilo, 4-difluorometoxifenilo, 4-fluorofenilo, 4-metanosulfonilo, 4-
 metoxifenilo, 4-metilfenilo, 4-nitrofenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometilfenilo, 4-bromo-2-clorofenilo, 2,4-
 diclorofenilo, 2-cloro-4-cianofenilo, 2-cloro-4-difluorometoxifenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 2-cloro-4-metoxifenilo, 2-cloro-4-
 metilfenilo, 2-cloro-4-nitrofenilo, 2-cloro-4-trifluorometoxifenilo, 2-cloro-4-trifluorometilfenilo, 4-bromo-3-clorofenilo, 3,4-
 15 diclorofenilo, 3-cloro-4-cianofenilo, 3-cloro-4-difluorometoxifenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 3-cloro-4-metoxifenilo, 3-cloro-4-
 metilfenilo, 3-cloro-4-nitrofenilo, 3-cloro-4-trifluorometoxifenilo, 3-cloro-4-trifluorometilfenilo, 2-bromo-4-clorofenilo, 4-
 cloro-2-difluorometoxifenilo, 4-cloro-2-cianofenilo, 4-cloro-2-metoxifenilo, 4-cloro-2-fluorofenilo, 4-cloro-2-nitrofenilo, 4-
 cloro-2-metilfenilo, 4-cloro-2-trifluorometilfenilo, 4-cloro-2-trifluorometoxifenilo, 4-cloro-3-trifluorometoxifenilo, 3-bromo-4-
 clorofenilo, 4-cloro-3-difluorometoxifenilo, 4-cloro-3-cianofenilo, 4-cloro-3-metoxifenilo, 4-cloro-3-fluorofenilo, 4-cloro-3-
 20 nitrofenilo, 4-cloro-3-metilfenilo, 4-cloro-3-trifluorometilfenilo, 4-bromo-2-fluorofenilo, 2-difluoro-4-difluorometoxifenilo, 4-
 ciano-2-fluorofenilo, 2-fluoro-4-metoxifenilo, 2,4-fluorofenilo, 2-fluoro-4-nitrofenilo, 2-fluoro-4-metilfenilo, 2-fluoro-4-
 trifluorometilfenilo, 2-fluoro-4-trifluorometoxifenilo, 4-bromo-3-fluorofenilo, 4-ciano-3-fluorofenilo, 3-difluoro-4-
 difluorometoxifenilo, 3,4-fluorofenilo, 3-fluoro-4-metoxifenilo, 3-fluoro-4-metilfenilo, 3-fluoro-4-nitrofenilo, 3-fluoro-4-
 trifluorometoxifenilo, 3-fluoro-4-trifluorometilfenilo, 4-cloro-2,3-difluorofenilo, 4-cloro-2,5-difluorofenilo, 4-cloro-2,6-
 difluorofenilo, 4-cloro-3,5-difluorofenilo, 2,4-dicloro-3-fluorofenilo, 2,4-dicloro-5-fluorofenilo, 2,4-dicloro-6-fluorofenilo,
 2,3,4-trifluorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2,4,5-trifluorofenilo, 3,4,5-trifluorofenilo, pentafluorofenilo, 2-bromo-4-cianofenilo,
 3-bromo-4-cianofenilo, 4-bromo-2-cianofenilo, 4-bromo-3-cianofenilo, 2-ciano-4-nitrofenilo, 3-ciano-4-nitrofenilo, 2-
 ciano-4-trifluorometilfenilo, 3-ciano-4-trifluorometilfenilo, 2,4-dicianofenilo, 3,4-dicianofenilo, 3-cloropiridin-2-ilo, 4-
 cloropiridin-2-ilo, 5-cloropiridin-2-ilo, 6-cloropiridin-2-ilo, 2-cloropiridin-3-ilo, 4-cloropiridin-3-ilo, 5-cloropiridin-3-ilo, 6-

5 cloropiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 3-cloropiridin-4-ilo, 3,4-dicloropiridin-2-ilo, 3,5-dicloropiridin-2-ilo, 3,6-dicloropiridin-2-ilo, 2,5-dicloropiridin-3-ilo, 2,6-dicloropiridin-3-ilo, 2,3-dicloropiridin-4-ilo, 2,5-dicloropiridin-4-ilo, 3,5,6-tricloropiridin-2-ilo, 3-fluoropiridin-2-ilo, 4-fluoropiridin-2-ilo, 5-fluoropiridin-2-ilo, 6-fluoropiridin-2-ilo, 2-fluoropiridin-3-ilo, 4-fluoropiridin-3-ilo, 5-fluoropyridin-3-ilo, 6-fluoropiridin-3-ilo, 2-fluoropiridin-4-ilo, 3-fluoropiridin-4-ilo, 3,4-difluoropiridin-2-ilo, 3,5-difluoropiridin-2-ilo, 3,6-difluoropiridin-2-ilo, 2,5-difluoropiridin-3-ilo, 2,6-difluoropiridin-3-ilo, 2,3-difluoropiridin-4-ilo, 2,5-difluoropiridin-4-ilo, 3,5,6-trifluoropiridin-2-ilo, 3-trifluorometilpiridin-2-ilo, 4-trifluorometilpiridin-2-ilo, 5-trifluorometilpiridin-2-ilo, 6-trifluorometilpiridin-2-ilo, 2-trifluorometilpiridin-3-ilo, 4-trifluorometilpiridin-3-ilo, 5-trifluorometilpiridin-3-ilo, 6-trifluorometilpiridin-3-ilo, 2-trifluorometilpiridin-4-ilo, 3-trifluorometilpiridin-4-ilo, 4-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo, 5-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo, 6-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo, 3-cloro-4-fluoropiridin-2-ilo, 3-cloro-5-fluoropiridin-2-ilo, 3-cloro-6-fluoropiridin-2-ilo, 3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo, 3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo, 6-fluoro-3,4,5-tricloropiridin-2-ilo, 4-metil-3,5,6-trifluoropiridin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, 5-fluoropirimidin-2-ilo, 5-cloropirimidin-2-ilo, 5-bromopirimidin-2-ilo, 6-cloropiridazin-3-ilo, 6-bromopiridazin-3-ilo, quinolina-2-ilo, 6-fluoroquinolin-2-ilo, 7-fluoroquinolin-2-ilo, 6-cloroquinolin-2-ilo, 7-cloroquinolin-2-ilo, 6-bromoquinolin-2-ilo, 7-bromoquinolin-2-ilo, 6-trifluorometilquinolin-2-ilo, 7-trifluorometilquinolin-2-ilo, quinoxalin-2-ilo, 6-fluoroquinoxalin-2-ilo, 7-fluoroquinoxalin-2-ilo, 6-cloroquinoxalin-2-ilo, 7-cloroquinoxalin-2-ilo, 6-bromoquinoxalin-2-ilo, 7-bromoquinoxalin-2-ilo, 6-trifluorometilquinoxalin-2-ilo, 7-trifluorometilquinoxalin-2-ilo, quinazolin-2-ilo, 6-fluoroquinazolin-2-ilo, 7-fluoroquinazolin-2-ilo, 6-cloroquinazolin-2-ilo, 7-choroquinazolin-2-ilo, 6-bromoquinazolin-2-ilo, 7-bromoquinazolin-2-ilo, 6-trifluorometilquinazolin-2-ilo, 7-trifluorometilquinazolin-2-ilo, benzoxazol-2-ilo, 5-fluorobenzoxazol-2-ilo, 6-fluorobenzoxazol-2-ilo, 5-clorobenzoxazol-2-ilo, 6-clorobenzoxazol-2-ilo, 5-bromobenzoxazol-2-ilo, 6-bromobenzoxazol-2-ilo, 5-trifluorometilbenzoxazol-2-ilo, 6-trifluorometilbenzoxazol-2-ilo, benzotiazol-2-ilo, 5-fluorobenzotiazol-2-ilo, 6-fluorobenzotiazol-2-ilo, 5-clorobenzotiazol-2-ilo-clorobenzotiazol-2-ilo, 5-bromobenzotiazol-2-ilo, 6-bromobenzotiazol-2-ilo, 5-trifluorometilbenzotiazol-2-ilo, 6-trifluorometilbenzotiazol-2-ilo, benzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 6-fluorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 7-fluorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 6-clorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 7-clorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 6-bromobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 7-bromo benzo[1,2,4]triazin-3-ilo, 6-trifluorometilbenzo[1,2,4]triazin-3-ilo o 7-trifluorometilbenzo-[1,2,4]triazin-3-ilo.