

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 600 082**

51 Int. Cl.:

C07D 249/14 (2006.01)

C07D 257/06 (2006.01)

A01N 43/653 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **29.10.2012 PCT/EP2012/071378**

87 Fecha y número de publicación internacional: **10.05.2013 WO13064457**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **29.10.2012 E 12778353 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.08.2016 EP 2773625**

54 Título: **Amidas de ácido N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílico sustituidas con 5-fenilo y su uso como herbicidas**

30 Prioridad:

03.11.2011 EP 11187669

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

07.02.2017

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**BRAUN, RALF;
AHRENS, HARTMUT;
VAN ALMSICK, ANDREAS;
LEHR, STEFAN;
HÄUSER-HAHN, ISOLDE;
DIETRICH, HANSJÖRG;
GATZWEILER, ELMAR;
HEINEMANN, INES y
ROSINGER, CHRISTOPHER, HUGH**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 600 082 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).

C_6)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, heteroarilo, heterociclilo o fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) y halo-alcoxi (C₁-C₆) y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo, o

5 Z también puede significar hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆) si Y es el radical S(O)_nR²,

W significa alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halocicloalquilo (C₃-C₇), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₄), halógeno, nitro, NR³COR³ o ciano,

10 R significa alquilo (C₁-C₈), halo-alquilo (C₁-C₈), alqueno (C₂-C₈), halo-alqueno (C₂-C₈), alquino (C₂-C₈), halo-alquino (C₂-C₈), en los que estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno por s radicales del grupo que consiste en hidroxilo, nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, COOR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, O-alquilo (C₁-C₂)-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, en los que los siete últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo, o

R significa cicloalquilo (C₃-C₇), heteroarilo, heterociclilo o fenilo, cada uno de los cuales está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄), en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,

20 Q significa O, S o NR³,

R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilalquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclilo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que los 21 últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,

30 R² significa alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilalquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclilo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que los 21 últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y donde el heterociclilo porta n grupos oxo,

R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o fenilo,

40 R⁴ significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o fenilo,

R⁵ significa alquilo (C₁-C₄),

n significa 0, 1 o 2;

s significa 0, 1, 2 o 3.

45 En la fórmula (I) y en todas las fórmulas siguientes, los radicales alquilo que tienen más de dos átomos de carbono pueden ser de cadena lineal o ramificada. Radicales alquilo significan, por ejemplo, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, terc- o 2-butilo, pentilo, hexilo tales como n-hexilo, isohexilo y 1,3-dimetilbutilo. De forma análoga, alqueno significa, por ejemplo, alilo, 1-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metilbut-3-en-1-ilo y 1-metilbut-2-en-1-ilo. Alquino significa, por ejemplo, propargilo, but-2-il-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 1-metilbut-3-in-1-ilo. El enlace múltiple puede estar en cualquier posición del radical insaturado. Cicloalquilo significa un sistema de anillo carbocíclico saturado que tiene de tres a seis átomos de carbono, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo. De forma análoga, cicloalqueno significa un grupo alqueno monocíclico que tiene de tres a seis miembros de anillo de carbono, por ejemplo ciclopropeno, ciclobuteno, ciclopenteno y ciclohexeno, en los que el doble enlace puede estar en cualquier posición.

Halógeno representa flúor, cloro, bromo o yodo.

Heterociclilo significa un radical cíclico saturado, semisaturado o completamente insaturado que contiene de 3 a 6 átomos de anillo, de los cuales de 1 a 4 proceden del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre, y que pueden, adicionalmente, estar condensados mediante un anillo benzo. Por ejemplo, heterociclilo representa piperidinilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo y oxetanilo,

Heteroarilo significa un radical cíclico aromático que contiene de 3 a 6 átomos de anillo, de los cuales de 1 a 4 proceden del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre, y que pueden, adicionalmente, estar condensados mediante un anillo benzo. Por ejemplo, heteroarilo representa bencimidazol-2-ilo, furanilo, imidazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, piridinilo, bencisoxazolilo, tiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, tiofenilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,5-triazolilo, 1,3,4-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 2H-1,2,3,4-tetrazolilo, 1H-1,2,3,4-tetrazolilo, 1,2,3,4-oxatriazolilo, 1,2,3,5-oxatriazolilo, 1,2,3,4-tiatriazolil y 1,2,3,5-tiatriazolilo.

Cuando un grupo está sustituido con una pluralidad de radicales significa que este grupo está sustituido con uno o más representantes idénticos o diferentes de los radicales mencionados. Esto se aplica de forma análoga a la construcción de sistemas de anillo de varios átomos y elementos. En el presente documento, los compuestos que los expertos en la técnica saben que son químicamente inestables en condiciones normales están excluidos del alcance de las reivindicaciones.

Dependiendo de la naturaleza y la unión de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula general (I) pueden estar presentes como estereoisómeros. Cuando están presentes, por ejemplo, uno o más átomos de carbono asimétricos, se pueden producir enantiómeros y diaestereómeros. Asimismo, se producen estereoisómeros cuando n es 1 (sulfóxidos). Los estereoisómeros se pueden obtener a partir de mezclas obtenidas en la preparación mediante procedimientos de separación habituales, por ejemplo mediante procedimientos de separación cromatográfica. Es igualmente posible preparar de forma selectiva estereoisómeros usando reacciones estereoselectivas usando materiales de partida y/o sustancias auxiliares ópticamente activos. La invención también se refiere a todos los estereoisómeros y mezclas de los mismos que están abarcados por la fórmula general (I) pero no están definidos específicamente. Debido a la estructura de éter de oxima, los compuestos de acuerdo con la invención también pueden estar presentes como isómeros geométricos (isómeros E/Z). La invención también se refiere a todos los isómeros E/Z y mezclas de los mismos que están abarcados por la fórmula general (I) pero no están definidos específicamente.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales. Las sales pueden formarse mediante la acción de una base sobre dichos compuestos de la fórmula (I) que portan un átomo de hidrógeno ácido, por ejemplo en el caso en el que R¹ contiene un grupo COOH o un grupo sulfonamida -NHSO₂-. Bases adecuadas son, por ejemplo, aminas orgánicas tales como trietilaminas, morfolina, piperidina o piridina, y también hidróxidos de amonio, metales alcalinos o metales alcalinotérreos, carbonatos e hidrogenocarbonatos, especialmente hidróxido sódico y potásico, carbonato sódico y potásico, e hidrogenocarbonato sódico y potásico. Estas sales son compuestos en los que el hidrógeno ácido está sustituido con un catión agrícolamente adecuado, por ejemplo sales metálicas, especialmente sales de metales alcalinos o sales de metales alcalino térreos, especialmente sales de sodio y de potasio o, por otro lado, sales de amonio, sales con aminas orgánicas o sales de amonio cuaternario, por ejemplo con cationes de la fórmula [NRR'R''R''']⁺ en la que de R a R''' son, cada uno de forma independiente, de uno de un radical orgánico, especialmente alquilo, arilo, aralquilo o alquilario. También son útiles las sales de alquilsulfonio y alquilsulfoxonio, tales como trialkilsulfonio (C₁-C₄) y de trialkilsulfoxonio (C₁-C₄).

Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales mediante la adición de un ácido inorgánico u orgánico adecuado, por ejemplo ácidos minerales, por ejemplo HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ o HNO₃, o ácidos orgánicos, por ejemplo ácidos carboxílicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido láctico o ácido salicílico, o ácidos sulfónicos, por ejemplo ácido p-toluenosulfónico, sobre un grupo básico, por ejemplo amino, alquilamino, dialquilamino, piperidino, morfolino o piridino. Estas sales contienen la base conjugada del ácido como anión.

Se da preferencia a los compuestos de la fórmula general (I), en la que

A significa N o CY,

B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹ o alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilo (C₁-C₆)-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-heterociclilo, en los que los dos últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en radicales halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-

C₆), alcoxi (C₁-C₆) y halo-alcoxi (C₁-C₆), y en los que el heterociclo porta n grupos oxo,

Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, COOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilo (C₁-C₆)-fenilo, alquilo (C₁-C₆)-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en los que el grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,

Z significa halógeno, ciano, tiocianato, halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R² o 1,2,4-triazol-1-ilo, o

Z también puede significar hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆) si Y es el radical S(O)_nR²,

W significa alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄), halógeno o ciano,

R significa alquilo (C₁-C₈), halo-alquilo (C₁-C₈), alqueno (C₂-C₈), halo-alqueno (C₂-C₈), alquino (C₂-C₈), halo-alquino (C₂-C₈), en los que estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno por s radicales del grupo que consiste en nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, COOR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, en los que los siete últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo o,

R significa cicloalquilo (C₃-C₇), heteroarilo, heterociclilo o fenilo, cada uno de los cuales está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄),

Q significa O, S o NR³,

R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilo-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclilo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que los dieciséis últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,

R² significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilo-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclilo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que estos dieciséis últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, NR³SO₂R⁴, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,

R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆),

R⁴ significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆),

R⁵ significa metilo o etilo,

n significa 0, 1 o 2;

s significa 0, 1, 2 o 3.

Se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula general (I), en la que

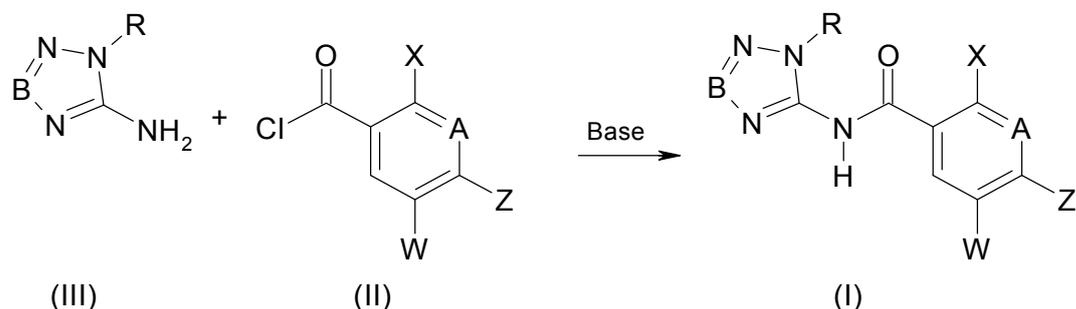
A significa N o CY,

- B significa N o CH,
- X significa nitro, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), OR¹, S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilheteroarilo (C₁-C₆), alquilheterociclilo (C₁-C₆), en los que los dos últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en los radicales halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) y halo-alcoxi (C₁-C₆), y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 5
- Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), OR¹, S(O)_nR², SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilfenilo (C₁-C₆), alquilheteroarilo (C₁-C₆), alquilheterociclilo (C₁-C₆), fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en los que los últimos 6 radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 10
- Z significa halógeno, cuando, haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_nR², 1,2,4-triazol-1-ilo, o Z también puede significar hidrógeno, metilo, metoxi o etoxi si Y es el radical S(O)_nR²,
- 15
- W significa metilo, etilo, metoximetilo, metoxi, flúor, cloro o S(O)_nCH₃,
- R significa alquilo (C₁-C₈), halo-alquilo (C₁-C₈), alqueno (C₂-C₈), halo-alqueno (C₂-C₈), alquino (C₂-C₈), halo-alquino (C₂-C₈), en los que estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno por s radicales del grupo que consiste en ciano, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), COR³, COOR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en los que el heterociclilo porta de 0 a 2 grupos oxo o,
- 20
- R significa fenilo que está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄),
- 25
- R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilo-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclilo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que los dieciséis últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxicarbonilo (C₂-C₆), y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 30
- R² significa alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), cada uno de los cuales está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno y OR³,
- 35
- R³ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆).
- R⁴ significa alquilo (C₁-C₆),
- R⁵ significa metilo o etilo,
- n significa 0, 1 o 2;
- 40 s significa 0, 1, 2 o 3.

En todas las fórmulas especificadas en el presente documento más adelante, los sustituyentes y los símbolos tienen el mismo significado que en la fórmula (I), a menos que se definan de forma diferente.

- Los compuestos de acuerdo con la invención también se pueden preparar mediante, por ejemplo, el procedimiento mostrado en el esquema 1, mediante reacción catalizada por bases de un cloruro de ácido piridincarbonilo (II) con un 5-amino-1H-1,2,4-triazol o 5-amino-1H-tetrazol (III):
- 45

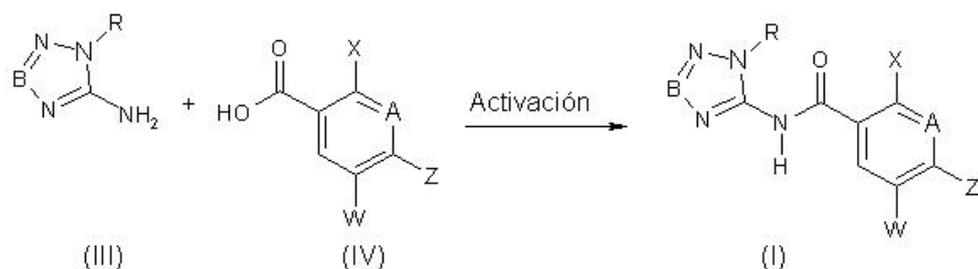
Esquema 1



Los cloruros de benzoilo de la fórmula (II) o los ácidos benzoicos en los que se basan se conocen en principio y se pueden preparar, por ejemplo, mediante los procedimientos descritos en los documentos JP 63122673, WO 99/54328 A1 y WO 97/46530 A1.

- 5 Los compuestos de acuerdo con la invención también se pueden preparar mediante el procedimiento descrito en el esquema 2, mediante reacción de un ácido benzoico de fórmula (IV) con un 5-amino-1H-1,2,4-triazol o 5-amino-1H-tetrazol (III):

Esquema 2

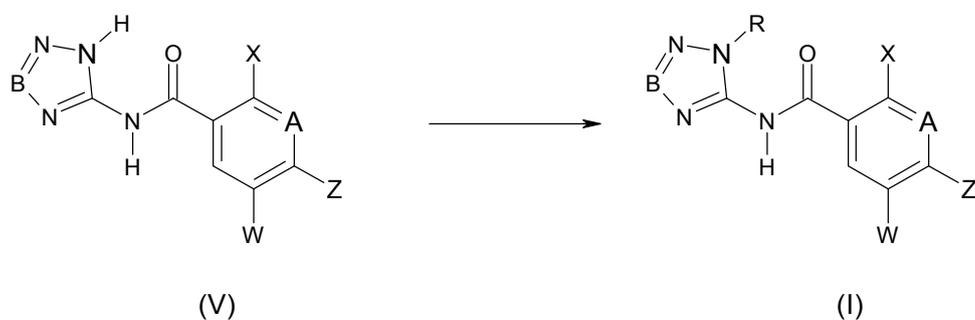


- 10 Para la activación, es posible usar reactivos deshidratantes que normalmente se usan para reacciones de amidación, por ejemplo 1,1'-carbonyldiimidazol (CDI), dicitlohexilcarbodiimida (DCC), 2,4,6-trióxido de 2,4,6-tripropil-1,3,5,2,4,6-trioxatрифосфинано (T3P) etc.

Los compuestos de acuerdo con la invención también se pueden preparar mediante el procedimiento mostrado en el esquema 3 mediante reacción de una N-(1H-1,2,4-triazol-5-il)benzamida, N-(1H-tetrazol-5-il)benzamida, N-(1H-1,2,4-triazol-5-il)nicotinamida o N-(1H-tetrazol-5-il)nicotinamida:

- 15

Esquema 3



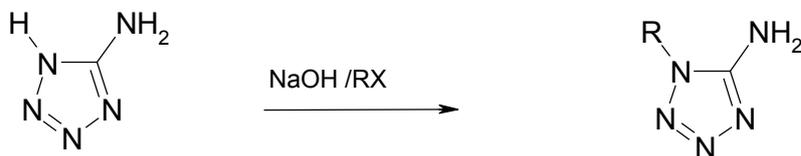
Para esta reacción mostrada en el esquema 3, es posible, por ejemplo, usar agentes alquilantes, por ejemplo haluros de alquilo o sulfonato o sulfatos de dialquilo en presencia de una base.

- 20 Puede ser conveniente cambiar el orden de las etapas de reacción. Por tanto, los ácidos benzoicos portadores de un sulfóxido no se pueden convertir directamente en sus cloruros ácidos. En el presente documento, es aconsejable

preparar inicialmente, en la etapa de tioéter, la amida, y, después, oxidar el tioéter en el sulfóxido.

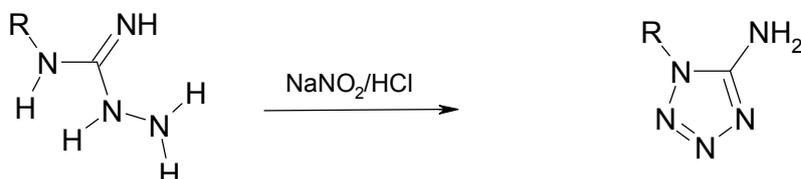
Los 5-amino-1H-tetrazoles de la fórmula (III) están disponibles comercialmente o se pueden preparar de forma análoga en procedimientos conocidos en la literatura. Por ejemplo, los 5-amino-1-R-tetrazoles se pueden preparar a partir de aminotetrazol mediante el procedimiento descrito en el Journal of the American Chemical Society (1954), 76, 923-924:

5



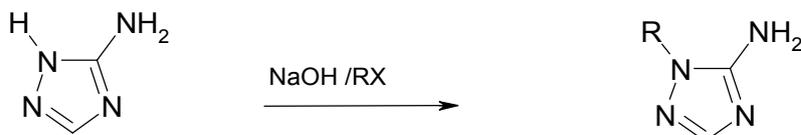
En la fórmula R mencionada anteriormente, R es, por ejemplo, un radical alquilo.

Los 5-amino-1-R-tetrazoles se pueden sintetizar, por ejemplo, como se describe en el Journal of the American Chemical Society (1954), 76, 88-89:

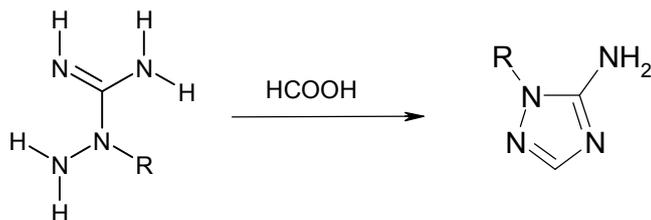


10

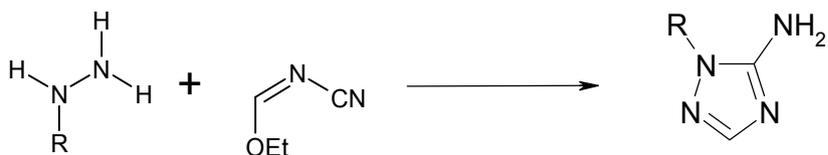
Los 5-amino-1H-triazoles de la fórmula (III) están disponibles comercialmente o se pueden preparar de forma análoga en procedimientos conocidos en la literatura. Por ejemplo, los 5-amino-1-R-triazoles se pueden preparar a partir de aminotriazol mediante el procedimiento descrito en Zeitschrift für Chemie (1990), 30(12), 436 - 437:



15 Los 5-amino-1-R-triazoles también se pueden sintetizar, por ejemplo, como se describe en el Chemische Berichte (1964), 97(2), 396-404:



Los 5-amino-1-R-triazoles también se pueden sintetizar, por ejemplo, como se describe en el Angewandte Chemie (1963), 75, 918:



20

Los grupos de compuestos de la fórmula (I) y/o sales de los mismos que se pueden sintetizar mediante las reacciones mencionadas anteriormente también se pueden preparar de un modo paralelo, en cuyo caso se puede conseguir de un modo manual, parcialmente automático o completamente automático. Es posible, por ejemplo, a este respecto, automatizar la realización de la reacción, el procesamiento o la purificación de los productos y/o intermedios. En general, se entiende que significa un procedimiento como se ha descrito, por ejemplo, mediante D. Tiebes in Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor: Günther Jung), Wiley, 1999, en las páginas 1 a 34.

25

A partir de la realización paralela de la reacción y el procesamiento, es posible usar una serie de instrumentos

disponibles comercialmente, por ejemplo los bloques de la reacción de Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EE.UU. o las estaciones de reacción de Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, Inglaterra o MultiPROBE Automated Workstations de PerkinElmer, Waltham, Massachusetts 02451, EE.UU. Para la purificación paralela de los compuestos de la fórmula general (I) y sales de los mismos o de intermedios que se producen en el curso de la preparación, aparatos disponibles incluyen aparatos de cromatografía, por ejemplo de

5 ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

Los aparatos indicados conducen a un procedimiento modular en el que las etapas de trabajo individuales son automáticas pero se tienen que llevar a cabo operaciones manuales entre las etapas de trabajo. Esto se puede sortear usando sistemas de automatización parcial o completamente integrados en los que los respectivos módulos de automatización son operados, por ejemplo, por robots. Los sistemas de automatización de este tipo se pueden adquirir, por ejemplo, en Caliper, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

10

La implementación de una o más etapas de síntesis puede estar respaldada por el uso de resinas secuestrantes/reactivos soportados en polímero. La bibliografía especialista describe una serie de protocolos experimentales, por ejemplo en ChemFiles, Vol. 4, N° 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

15

Además de los procedimientos descritos en el presente documento, los compuestos de la fórmula general (I) y sales de los mismos se pueden preparar completa o parcialmente mediante procedimientos con soporte en fase sólida. Con este fin, los intermedios individuales o todos los intermedios en la síntesis o una síntesis adaptada para el correspondiente procedimiento están unidos a una resina de síntesis. Los procedimientos de síntesis en soporte de fase sólida se describen adecuadamente en la literatura técnica, por ejemplo Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998 and Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor: Günther Jung), Wiley, 1999. El uso de los procedimientos de síntesis con soporte de fase sólida permite llevar a cabo una serie de protocolos, que se conocen en la literatura y que, por su parte, se pueden realizar manualmente o de un modo automático. Las reacciones se pueden realizar mediante, por ejemplo, tecnología IRORI en microrreactores de Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EE.UU.

20

El procedimiento de una o varias etapas de síntesis puede realizarse en soporte tanto de fase sólida como de fase líquida mediante el uso de tecnología de microondas. La bibliografía especialista describe una serie de protocolos experimentales, por ejemplo en Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor C. O. Kappe and A. Stadler), Wiley, 2005.

30 La preparación mediante los procesos descritos en el presente documento da compuestos de la fórmula (I) y sales de los mismos en forma de grupos de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención también proporciona bibliotecas que comprenden al menos dos compuestos de la fórmula (I) y sales de los mismos.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención (y/o sus sales), en conjunto denominados en el presente documento "compuestos de acuerdo con la invención" tienen una eficacia herbicida excelente contra un amplio espectro de plantas dañinas anuales monocotiledóneas y dicotiledóneas económicamente importantes. Los compuestos activos actúan de forma eficiente incluso sobre plantas dañinas perennes que producen brotes de rizomas, rizomas y otros órganos perennes y que son difíciles de controlar.

35

Por tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento para combatir plantas indeseadas o para regular el crecimiento de las plantas, preferentemente en cultivos de plantas, en los que uno o más compuestos de acuerdo con la invención se aplica/n a las plantas (por ejemplo, plantas dañinas tales como malas hierbas monocotiledóneas o dicotiledóneas o plantas de cultivo no deseadas), a las semillas (por ejemplo, granos, semillas o propágalos vegetativos tales como tubérculos o partes de brotes con yemas) o a la superficie sobre la cual las plantas crecen (por ejemplo, la superficie de cultivo). Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden utilizar, por ejemplo, antes de sembrar (si es adecuado también mediante incorporación en el suelo), antes de la emergencia o después de la emergencia. Ejemplos específicos de algunos representantes de la flora de malas hierbas monocotiledóneas o dicotiledóneas que se pueden combatir mediante los compuestos de acuerdo con la invención son los siguientes, aunque con la numeración no se pretende imponer una restricción a especies concretas:

45

Plantas dañinas monocotiledóneas de los géneros: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

50

Malas hierbas dicotiledóneas de los géneros: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

55

Cuando los compuestos de acuerdo con la invención se aplican a la superficie del suelo antes de la germinación, o se impide que las plántulas de las malas hierbas emerjan completamente o las malas hierbas crecen hasta que alcanzan el estado de cotiledón y en este momento dejan de crecer y, en última instancia, transcurridas de tres a cuatro semanas, mueren completamente.

- 5 Si los compuestos activos se aplican después de la emergencia a las partes verdes de las plantas, el crecimiento se detiene tras el tratamiento y las plantas dañinas permanecen en el mismo estado de crecimiento del momento de la aplicación o mueren completamente después de un tiempo determinado, de modo que la competición por las malas hierbas, que es dañina para las plantas de cultivo, se elimina muy pronto y de un modo duradero.

- 10 Aunque los compuestos de acuerdo con la invención muestran una actividad herbicida sobresaliente contra malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas, las plantas de cultivo de cultivos económicamente importantes, por ejemplo cultivos dicotiledóneos de los géneros *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*, o cultivos de monocotiledóneas de los géneros *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, en particular *Zea* y *Triticum*, solo se ven dañados en una
15 medida insignificante o nada, en función de la estructura del correspondiente compuesto de acuerdo con la invención y su tasa de aplicación. Esta es la razón por la cual los presentes compuestos son muy adecuados para el control selectivo del crecimiento de plantas indeseadas en cultivos de plantas, tales como plantas agrícolamente útiles o decorativas.

- 20 Además, los compuestos de acuerdo con la invención (en función de su estructura concreta y la tasa de aplicación usada) poseen extraordinarias propiedades de regulación del crecimiento en plantas de cultivo. Se introducen en el metabolismo de la planta de un modo regulador y, por tanto, pueden usarse para influir, de un modo dirigido, sobre los constituyentes de las plantas y para facilitar la recolección, tal como, por ejemplo, desencadenando desecación y detención del crecimiento. Además, también son adecuados para controlar en general e inhibir el crecimiento de
25 vegetación indeseada sin destruir las plantas en el proceso. La inhibición del crecimiento de la vegetación desempeña un papel principal para muchos cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneas ya que, por ejemplo, esto puede reducir o evitar completamente el encamado.

- En virtud de sus propiedades herbicidas y de regulación del crecimiento de plantas, los compuestos activos también se pueden usar para controlar plantas dañinas en cultivos de plantas modificadas genéticamente o plantas
30 modificadas mediante mutagénesis convencionales. En general, las plantas transgénicas se distinguen por sus propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por sus resistencias a determinados plaguicidas, principalmente determinados herbicidas, resistencias a enfermedades de plantas u organismos causales de enfermedades de plantas, tales como determinados insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades concretas se refieren a, por ejemplo, el material recolectado con respecto a la cantidad, calidad, almacenabilidad, composición y constituyentes específicos. Por ejemplo, existen plantas transgénicas conocidas con
35 un contenido elevado en almidón o una calidad alterada de almidón o con una composición diferente de ácidos grasos en el material recolectado.

- Se prefiere, con respecto a los cultivos transgénicos, usar los compuestos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y decorativas, por ejemplo de cereales tales como trigo,
40 cebada, centeno, avena, mijo/sorgo, arroz y maíz u otros cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisantes y otros vegetales. Se prefiere usar los compuestos de acuerdo con la invención como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes, o se han hecho resistentes por medios recombinantes, a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

- Se da preferencia al uso de los compuestos de acuerdo con la invención, o sales de los mismos, en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y decorativas, por ejemplo de cereales tales como trigo,
45 cebada, centeno, avena, mijo/sorgo, arroz, yuca y maíz, u otros cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisantes y otros vegetales. Preferentemente, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes, o se han hecho resistentes por medios recombinantes, a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

- 50 Procedimientos convencionales de generar plantas nuevas que tienen propiedades modificadas en comparación con las plantas existentes hasta la fecha consisten en, por ejemplo, procedimientos de cultivo tradicionales y la generación de mutantes. Como alternativa, se pueden generar plantas nuevas con propiedades alteradas con la ayuda de procedimientos recombinantes (véase, por ejemplo, los documentos EP-A-0221 044, EP-A-0131624). Por ejemplo, se han realizado muchas descripciones de:

- 55 - modificaciones genéticas de plantas de cultivo con el objetivo de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),
- plantas de cultivos transgénicos que son resistentes a herbicidas concretos del tipo glifosinato (véanse, por ejemplo, los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o de tipo glifosato (documento WO 92/00377) o del tipo sulfonilurea (documentos EP-A-0257993, US-A-5013659),

- plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad para producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen que las plantas sean resistentes a plaga concretas (documento EP-A-0142924, EP-A-0193259),
- 5 - plantas de cultivo transgénicas con una composición modificada de ácidos grasos (documento WO 91/13972).
- plantas de cultivo codificadas genéticamente con nuevos constituyentes o metabolitos secundarios, por ejemplo nuevas fitoalexinas, que producen una resistencia incrementada a la enfermedad (documento EPA 309862, EPA0464461),
- 10 - plantas modificadas genéticamente con fotorespiración reducida que proporcionan rendimientos mayores y mayor tolerancia al estrés (documento EPA 0305398),
- plantas de cultivo transgénicas que producen proteínas farmacéutica o diagnósticamente importantes ("farmacéutica molecular"),
- plantas de cultivo transgénicas que se distinguen por rendimientos mayores o mejor calidad,
- 15 - plantas cultivo transgénicas que se distinguen por una combinación de, por ejemplo, las nuevas propiedades mencionadas anteriormente ("apilamiento de genes").

En principio se conoce un gran número de técnicas moleculares-biológicas por medio de las cuales se pueden generar nuevas plantas transgénicas con propiedades modificadas, véase, por ejemplo, I. Potrykus y G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg, o Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431.

- 20 Para llevar a cabo dichas manipulaciones recombinantes se pueden introducir en plásmidos moléculas de ácido nucleico que permiten la mutagénesis o cambios de secuencia mediante recombinación de secuencias de ADN. Con la ayuda de procedimientos estándar, es posible, por ejemplo, realizar intercambios de bases, eliminar partes de secuencias o añadir secuencias naturales o sintéticas. Para la unión de los fragmentos de ADN entre sí se pueden fijar a los fragmentos adaptadores o ligadores; véase, por ejemplo, Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2ª ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene und Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim 2ª edición 1996.
- 25

- La producción de células vegetales con una actividad reducida de un producto génico se puede conseguir, por ejemplo, mediante la expresión de al menos un ARN antisentido adecuado, o de un ARN sentido para alcanzar un efecto de cosupresión, o mediante la expresión de al menos una ribozima construida adecuadamente que escinda específicamente los transcritos del producto génico mencionado en lo que antecede. A este respecto, en primer lugar es posible usar moléculas de ADN que comprendan la secuencia de codificación completa de un producto génico, incluida cualquier secuencia flanqueante presente u otras moléculas de ADN que solo comprendan partes de la secuencia de codificación, en cuyo caso estas partes deben ser lo bastante largas producir un efecto antisentido en las células. El uso de secuencias de ADN que tengan un alto grado de homología con las secuencias de codificación de un producto génico, pero que no sean completamente idénticas a ellas, también es posible.
- 30
- 35

- A la hora de expresar moléculas de ácido nucleico en plantas, la proteína sintetizada se puede localizar en cualquier compartimento de la célula vegetal. No obstante, para alcanzar una localización en un compartimento concreto, es posible, por ejemplo, unir la secuencia de codificación con secuencias de ADN que garanticen la localización en un compartimento concreto. Los expertos en la técnica conocen dichas secuencias (véase, por ejemplo, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). Las moléculas de ácido nucleico también se pueden expresar en los orgánulos de las células vegetales.
- 40

- Las células de plantas transgénicas se pueden regenerar mediante técnicas conocidas para dar lugar a plantas completas. En principio, las plantas transgénicas pueden ser plantas de cualquier especie de planta deseada, es decir no solo plantas monocotiledóneas sino también dicotiledóneas.
- 45

Por tanto, es posible obtener plantas transgénicas cuyas propiedades estén alteradas por sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias génicas homólogas (= naturales) o la expresión de genes o secuencias génicas heterólogas (= extrañas).

- Preferentemente, los compuestos de la invención se pueden usar en cultivos transgénicos que son resistentes a reguladores del crecimiento por ejemplo dicamba, o a herbicidas que inhiben las enzimas vegetales esenciales, por ejemplo acetolactato sintasas (ALS), EPSP sintasas, glutamina sintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD) o a herbicidas del grupo de las sulfonilureas, los glifosatos, glufosinatos o benzoilisoxazoles e ingredientes activos análogos.
- 50

Un uso de los compuestos activos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos no solo da lugar a los

- efectos sobre las plantas dañinas observados en otros cultivos sino que a menudo también da lugar a efectos que son específicos de la aplicación en el cultivo transgénico concreto, por ejemplo un espectro alterado o específicamente ampliado de malas hierbas que se puede controlar, tasas de aplicación alteradas que se pueden usar para la aplicación, preferentemente buena capacidad de combinación con los herbicidas a los que el cultivo transgénico es resistente, e influencia del crecimiento y rendimiento de las plantas de cultivo transgénicos.
- 5 Por tanto, un objeto de la invención es el uso de los compuestos de la invención como herbicidas para controlar plantas dañinas en plantas de cultivo transgénicos.
- Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden aplicar en forma de polvos humectables, concentrados emulsionables, soluciones pulverizables, productos en polvo o gránulos en las formulaciones habituales. Por tanto, la invención también proporciona composiciones herbicidas y de regulación del crecimiento de plantas que comprenden los compuestos de acuerdo con la invención.
- 10 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden formular de varios modos, de acuerdo con los parámetros biológicos y/o fisicoquímicos requeridos. Ejemplos de posibles formulaciones incluyen: polvos humectables (PH), polvos hidrosolubles (PS), concentrados hidrosolubles, concentrados emulsionables (CE), emulsiones (EW) tales como emulsiones de aceite en agua y de agua en aceite, soluciones pulverizables, concentrados en suspensión (CS), dispersiones basadas en aceite o agua, soluciones miscibles en aceite, suspensiones en cápsulas (SC), productos en polvo (PP), productos de recubrimiento de semillas, gránulos para aplicación por dispersión y en suelo, gránulos (GR) en forma de microgránulos, gránulos en pulverización, gránulos recubiertos y gránulos de adsorción, gránulos dispersables en agua (GA), gránulos hidrosolubles (GS), formulaciones ULV, microcápsulas y ceras.
- 15 Estos tipos individuales de formulación se conocen en principio y se describen en, por ejemplo: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª ed. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.
- Los necesarios auxiliares de formulación, tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos, también se conocen y se describen en, por ejemplo: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2ª ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2ª ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Engineering], volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª ed. 1986.
- 25 En base a estas formulaciones, también es posible producir combinaciones con otros compuestos con actividad plaguicida, tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, y también con protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en forma de una formulación terminada o una mezcla en tanque. Los protectores adecuados son, por ejemplo, mefenpir-dietilo, ciprosulfamida, isoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo y diclormid.
- 30 Los polvos humectables son preparaciones que se pueden dispersar de forma uniforme en agua y, además del ingrediente activo, aparte de un diluyente o sustancia inerte, también comprenden tensioactivos del tipo iónico y/o no iónico (agentes humectantes, dispersantes), por ejemplo alquilfenoles polioxietilados, alcoholes grasos polioxietilados, aminas grasas polioxietilados, poliglicoletersulfatos de alcohol graso, alcanosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, lignosulfonato sódico, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato sódico, dibutilnaftalenosulfonato sódico o también oleilmetilaurato sódico. Para producir los polvos humectables, los compuestos activos herbicidas se muelen finamente, por ejemplo en aparatos habituales tales como molinos de martillos, molinos para soplado y molinos de chorro de aire y, de forma simultánea o posteriormente, se mezclan con los auxiliares de formulación.
- 40 Los concentrados emulsionables se producen disolviendo el ingrediente activo en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también aromáticos de alta ebullición o hidrocarburos o mezclas de los disolventes orgánicos, con adición de uno o más tensioactivos iónicos y/o no iónicos (emulsionantes). Los emulsionantes usados pueden ser, por ejemplo: alquilarilsulfonatos de calcio, tal como dodecilbendenosulfonato de calcio, o emulsionantes no iónicos tales como poliglicolésteres de ácido graso, alquilarilpoliglicoléteres, poliglicoléteres de alcohol graso, productos de condensación óxido de propileno-óxido de etileno, poliéteres de alquilo, ésteres de sorbitán, por ejemplo ésteres de sorbitán de ácido graso o ésteres de polioxietileno de sorbitán, por ejemplo ésteres de polioxietileno de sorbitán de ácido graso.
- 45 Los polvos se obtienen moliendo el compuesto activo con sustancias sólidas finamente distribuidas, por ejemplo talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierras de diatomeas.
- 50 Los concentrados de suspensión pueden estar basados en agua o en aceite. Se pueden preparar, por ejemplo, mediante molturación en húmedo por medio de molinos de esferas comerciales y adición opcional de tensioactivos como, por ejemplo, ya se ha indicado anteriormente para los otros tipos de formulación.

Las emulsiones, por ejemplo emulsiones de aceite en agua (EA), se pueden producir, por ejemplo, por medio de agitadores, molinos coloides y/o mezcladores estáticos usando disolventes orgánicos acuosos y, opcionalmente, tensioactivos como ya se ha indicado anteriormente, por ejemplo para los otros tipos de formulación.

5 Los gránulos se pueden preparar pulverizando el compuesto activo sobre material inerte granulado capaz de adsorción o aplicando concentrados del compuesto activo a la superficie de las sustancias vehículo, tales como arena, caolinitas o material inerte granulado, por medio de adhesivos, por ejemplo poli(alcohol vinílico), poli(acrilato sódico) o aceites minerales. Compuestos activos adecuados también se pueden granular del modo habitual para la producción de gránulos fertilizantes, si se desea como una mezcla con fertilizantes.

10 Los gránulos dispersables en agua se preparan, en general, mediante los procedimientos habituales tales como desecación por pulverización, granulación en lecho fluidizado, granulación en cazuela, mezclado con mezcladores de alta velocidad y extrusión sin materiales inertes sólidos.

15 Para la producción de gránulos en cazuela, gránulos en lecho fluidizado, gránulos por extrusión y gránulos por pulverización véanse, por ejemplo, procedimientos en "Spray-Drying Handbook" 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57.

Para detalles adicionales sobre la formulación de composiciones para protección de cultivos véase, por ejemplo, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, páginas 81-96 y J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

20 Las formulaciones agroquímicas contienen, en general, de 0,1 a 99% en peso, especialmente de 0,1 a 95% en peso, de los compuestos de acuerdo con la invención.

25 En polvos humectables, la concentración del compuesto activo es, por ejemplo, de aproximadamente el 10 al 90% en peso, consistiendo el resto hasta el 100% en peso en los componentes de la formulación adicional. En el caso de los concentrados emulsionables, la concentración del compuesto activo puede ser de aproximadamente el 1 al 90, preferentemente del 5 al 80% en peso. Las formulaciones en forma de polvos comprenden del 1 al 30% en peso del ingrediente activo, preferentemente normalmente del 5 al 20% en peso del ingrediente activo; las soluciones pulverizables contienen de aproximadamente el 0,05 al 80, preferentemente del 2 al 50, % en peso del ingrediente activo. En el caso de gránulos dispersables en agua, el contenido en ingrediente activo depende parcialmente de si el compuesto activo está presente en forma líquida o sólida o de qué auxiliares de granulación, cargas etc., se usan.

30 En los gránulos dispersables en agua, el contenido del compuesto activo está, por ejemplo, entre el 1 y el 95% en peso, preferentemente entre el 10 y el 80% en peso.

35 Además, las formulaciones del compuesto activo mencionadas comprende, opcionalmente, los respectivos fijadores, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, agentes anticongelantes y disolventes, cargas, vehículos y tintes, desespumantes, inhibidores de la evaporación y agentes que afectan al pH y a la viscosidad habituales.

En base a estas formulaciones, también es posible producir combinaciones con otros compuestos con actividad plaguicida, tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, y también con protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en forma de una formulación terminada o una mezcla en tanque.

40 Los compuestos activos que se pueden usar en combinación con los compuestos de acuerdo con la invención en formulaciones mixtas o en la mezcla en tanque son, por ejemplo, compuestos activos conocidos que se basan en la inhibición de, por ejemplo, acetolactato sintasa, acetil-CoA carboxilasa, celulosa sintasa, enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa, glutamina sintetasa, p-hidroxifenilpiruvato dioxigenasa, fitoeno desaturasa, fotosistema I, fotosistema II, protoporfirinógeno oxidasa, como se describe en, por ejemplo, Weed Research 26 (1986) 441-445 o "The Pesticide Manual", 15ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2009 y la literatura citada en los mismos. Ejemplos de herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas conocidos que se pueden combinar con los compuestos de la invención incluyen los ingredientes activos siguientes (los compuestos se designan con el "nombre común" de acuerdo con la Organización Internacional para la Normalización (ISO) o con el nombre químico o con el código numérico) y siempre abarcan todas las formas de uso, tales como ácidos, sales, ésteres e isómeros, tales como estereoisómeros e isómeros ópticos. En el presente documento, a modo de ejemplo,

45 se menciona una y, en algunos casos, una pluralidad de formas de uso:

50

acetoclor, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, acifluorfen, acifluorfen-sodio, aclonifen, alaclor, allidoclor, aloxidim, aloxidim-sodio, ametrina, amicarbazona, amidoclor, amidosulfuron, aminociclopiraclor, aminopirialid, amitrol, sulfamato amónico, ancimidol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidin, azimsulfuron, aziprotrina, beflubutamid, benazolina, benazolina-etilo, bencarbazona, benfluralina, benfuresato, bensulida, bensulfurón, bensulfurón-metilo, bentazona, benzfendizona, benzobiciclon, benzofenap, benzofluór, benzoilprop, biciclopirona, bifenox, bilanafos, bilanafos-sodio, bispiribac, bispiribac-sodio, bromacilo, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinil, bromurón, buminafos, busoxinona, butaclor, butafenacilo, butamifos, butenaclor, butralina, butroxidim, butilato, cafenstrol,

55

carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etilo, clometoxifen, cloramben, clorazifop, clorazifop-butilo, clorbromuron, clorbufam, clorfenac, clorfenac-sodio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metilo, cloridazon, clorimuron, clorimuron-etilo, cloromequat-cloruro, clornitrofen, cloroftalim, clortal-dimetilo, clortoluron, clorsulfuron, cinidon, cinidon-etilo, cinmetilin, cinosulfuron, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clofencet, clomazona, clomeprop, cloprop,

5 clopiralid, cloransulam, cloransulam-metilo, cumilurón, cianamida, cianazina, ciclanilida, cicloato, ciclosulfamurón, cicloxidim, cicluron, cihalofop, cihalofop-butilo, ciperquat, ciprazina, ciprazol, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron/dimron, dalapon, daminozida, dazomet, n-decanol, desmedifam, desmetrina, detosil-pirazolato (DTP), dialato, dicamba,

10 diclobenil, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulam, dietatilo, dietatil-etilo, difenoxurón, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, dimefurón, dikegulac-sodio, dimefurón, dimepiperato, dimethaclor, dimetametrina, dimetenamid, dimetenamid-P, dimetipin, dimetrasulfurón, dinitramina, dinoseb, dinoterb, difenamid, dipropetrin, diquat, diquat-dibromuro, ditiopir, diuron, DNOC, eglinazina-etilo, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralin, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etefón, etidimurón, etiozin, etofumesato, etoxifen, etoxifen-etilo, etoxisulfurón, etobenzanid, F-5331, es decir N-[2-cloro-4-flúor-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]fenil]etanosulfonamida, F-7967, es decir 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-bencimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fenoxasulfona, fentrazamida, fenurón, flamprop, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurón, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, fluazolato, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucetosulfurón, flucloralina, flufenacet (tiafluamida), flufenpir, flufenpir-etilo, flumetralina, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumioxazin, flumipropina, fluometurón, fluorodifeno, fluoroglocofeno,

20 fluoroglicofen-etilo, flupoxam, flupropacilo, flupropanato, flupirsulfurón, flupirsulfurón-metilo-sodio, flurenol, flurenol-butilo, fluridona, fluorocloridona, fluroxipir, fluroxipir-meptilo, flurprimidol, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metilo, flutiamida, fomesafen, foramsulfurón, forclorfenurón, fosamina, furiloxifen, ácido giberélico, glufosinato, glufosinato-amonio, glufosinato-P, glufosinato-P-amonio, glufosinato-P-sodio, glifosato, glifosato-isopropilamonio, H-9201, es decir O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil) O-etilisopropilfosforamidato, halosafen, halosulfurón, halosulfurón-metilo,

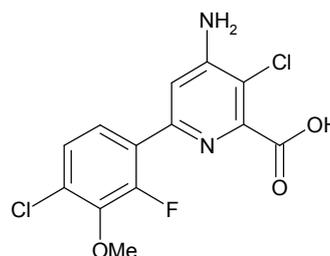
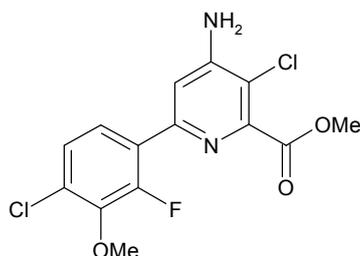
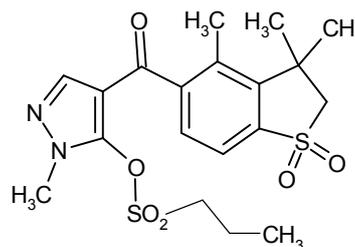
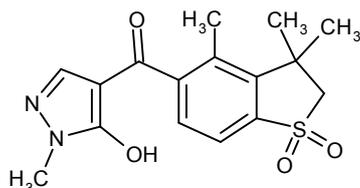
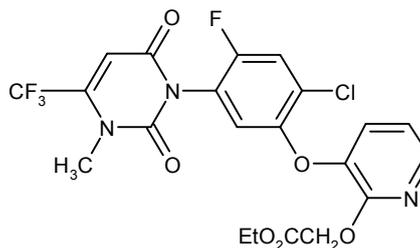
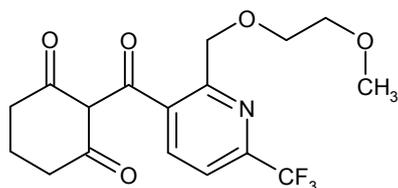
25 haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HW-02, es decir 1-(dimetoxifosforil)etilo (2,4-diclorofenoxi)acetato, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazamox-amonio, imazapic, imazapir, imazapir-isopropilamonio, imazaquin, imazaquin-amonio, imazetapir, imazetapir-amonio, imazosulfurón, inabenfida, indanofan, indaziflam, ácido indolacético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico (IBA), yodosulfurón, yodosulfurón-metilo-sodio, ioxinilo, ipfencarbazona, isocarbamid, isopropalina, isoproturón, isourón, isoxaben, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, KUH-043, es decir 3-([5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-5,5-dimetil-4,5-dihidro-1,2-oxazol, karbutilato, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, hidrazida maleica, MCPA, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y -sodio, mecoprop, mecoprop-sodio, mecoprop-butotilo, mecoprop-P-butotilo, mecoprop-P-dimetilamonio, mecoprop-P-2-etilhexilo, mecoprop-P-potasio, mefenacet, mefluidida, mepiquat-cloruro, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, metabenztiaturón, metam,

35 metamifop, metamitron, metazaclor, metazasulfurón, metazol, metiopiropir, metiozolina, metoxifenona, metildimiron, 1-metilciclopropeno, isotiocianato de metilo, metobenzurón, metoblaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxurón, metribuzina, metsulfurón, metsulfurón-metilo, molinato, monalida, monocarbamida, monocarbamida dihidrogenosulfato, monolinurón, monosulfurón, monosulfurón éster, monurón, MT-128, es decir 6-cloro-N-[(2E)-3-cloroprop-2-en-1-il]-5-metil-N-fenilpiridazin-3-amina, MT-5950, es decir N-[3-cloro-4-(1-metiletil)fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, naproanilida, napropamida, naptalam, NC-310, es decir 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benziloxipirazol, neburón, nicosulfurón, nipiraclorfen, nitalina, nitrofen, nitrofenolato-sodio (mezcla de isómeros), nitrofluorfen, ácido nonanoico, norflurazón, orbencarb, ortosulfamurón, orizalina, oxadiargilo, oxadiazón, oxasulfurón, oxaziclomefona, oxifluorfen, paclobutrazol, paraquat, paraquat dicloruro, ácido pelargónico (ácido nonanoico), pendimetalina, pendralina, penoxsulam, pentanoclor, pentoxazona, perfluidona, petoxamid, fenisofam,

45 fenmedifam, fenmedifam-etilo, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofos, pirifenop, pirifenop-butilo, pretilaclor, primisulfurón, primisulfuron-metilo, probenazol, profluzol, prociazina, prodiamina, prifluralina, profoxidim, prohexadiona, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, prometón, prometrina, propaclor, propanilo, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, propirisulfurón, propizamida, prosulfalina, prosulfocarb, prosulfurón, prinaclor, piraclonilo, piraflufen, piraflufen-etilo, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfurón, pirazosulfuron-etilo, pirazoxifen, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, pirifalid, piriminobac, piriminobac-metilo, pirimisulfan, piritiobac, piritiobac-sodio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, rimsulfurón, saflufenacilo, secbumetón, setoxidim, sidurón, simazina, simetrina, SN-106279, es decir (2R)-2-([7-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-naftil]oxi)propanoato de metilo,

50 sulcotriona, sulfallato (CDEC), sulfentrazona, sulfometurón, sulfometuron-metilo, sulfosato (glifosato-trimesio), sulfosulfurón, SIN-523, SIP-249, i.e. 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-il 5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato, SIP-300, es decir 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioximidazolidin-4,5-diona, tebutam, tebutiurón, tecnazeno, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxim, terbacilo, terbucarb, terbuclor, terbumetón, terbutilazina, terbutrina, tenilclor, tiafluamida, tiazafurón, tiazopir, tidiazimin, tidiazurón, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tifensulfurón, tifensulfuron-metilo, tiobencarb, tiocarbazilo, topamezona, tralkoxidim, triallato, triasulfurón, triaziflam, triazofenamida, tribenurón, tribenuron-metilo, ácido tricloroacético (TCA), triclopir, tridifano, trietazina, trifloxisulfurón, trifloxisulfuron-sodio, trifluralina, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo, trimeturón, trinexapac, trinexapac-etilo, tritosulfurón, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P, vernolato, ZJ-0862, es decir 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]bencil}anilina, y los compuestos

65 siguientes:



5 Para la aplicación, las formulaciones presentes en forma comercial, si es adecuado, se diluyen de forma habitual, por ejemplo en el caso de polvos humectables, concentrados emulsionables, dispersiones y gránulos dispersables en agua con agua. Las preparaciones en forma de polvos, gránulos para aplicar en el suelo o gránulos para transmitir y soluciones pulverizables normalmente no se diluyen más con otras sustancias inertes antes de la aplicación.

10 La tasa de aplicación requerida de los compuestos de la fórmula (I) varía con las condiciones externas, incluyendo temperatura, humedad y el tipo de herbicida usado. Puede variar dentro de amplios límites, por ejemplo entre 0,001 y 1,0 kg/ha o más de la sustancia activa; no obstante, preferentemente está entre 0,005 y 750 g/ha.

Los ejemplos siguientes ilustran la invención.

A. Ejemplos químicos

Síntesis de 2-cloro-5-metil-3-metiltio-N-(1-metiltetrazol-5-il)benzamida (N° 2-27)

Etapas 1: Síntesis de N-(trifluoroacetil)-2,6-dibromo-4-metil-anilina

15 En una atmósfera de argón, 50,0 g (189 mmol) de 2,6-dibromo-4-metil-anilina en 500 ml de diclorometano seco se enfriaron hasta la temperatura de 0 °C - 5 °C. A esta temperatura se añadieron 15,7 g (198 mmol) de piridina. A una temperatura de 5 °C - 7 °C, gota a gota se añadieron 41,6 g (198 mmol) de anhídrido trifluoroacético. La mezcla de reacción se agitó a esta temperatura durante 1 hora y después a temperatura ambiente (TA) durante 16 horas. Para el procesamiento, los contenidos se lavaron una vez con agua y, después, dos veces con ácido clorhídrico 1 M. La fase orgánica se secó y el filtrado se liberó del disolvente. Se obtuvieron 69,3 g de N-(trifluoroacetil)-2,6-dibromo-4-metil-anilina como residuo.

Etapas 2: Síntesis de N-(trifluoroacetil)-2,6-dibromo-4-metil-6-(metilitio)anilina

25 En una atmósfera de argón, 69,3 g (95% en peso puro, 182 mmol) de N-(trifluoroacetil)-2,6-dibromo-4-metil-anilina en 900 ml de dietiléter seco se enfriaron hasta la temperatura de -70 °C. A esta temperatura se añadieron gota a gota 153 ml de una solución 2,5 M (382,5 mmol) de n-butillitio en hexano. Después, la mezcla se agitó a esta temperatura durante otros 30 minutos. Después, a esta temperatura, gota a gota se añadió una solución de 51,5 g (547 mmol) de disulfuro de dimetilo en 100 ml de dietiléter seco. Los contenidos se agitaron a esta temperatura

durante 1 hora y después a TA durante 3 horas y, después, se vertieron en 1.000 ml de ácido clorhídrico 1 M. Después de la separación de fases, la fase acuosa se extrajo con dietiléter, las fases orgánicas combinadas se secaron y el filtrado se liberó de los disolventes. El residuo se agitó con heptano durante 30 minutos y después se filtró. Se obtuvieron 46,6 g de N-(trifluoroacetil)-2-dibromo-4-metil-6-(metilitio)anilina como residuo.

5 Etapa 3: Síntesis de ácido 5-metil-3-(metilitio)-2-(trifluoroacetilamino)benzoico

En una atmósfera de argón, 46,6 g (142 mmol) de N-(trifluoroacetil)-2-bromo-4-metil-6-(metilitio)anilina en 750 ml de dietiléter seco se enfriaron hasta una temperatura de -65 °C. A esta temperatura se añadieron gota a gota 119 ml de una solución 2,5M (297,5 mmol) de n-butil-litio en hexano. La mezcla se agitó después a esta temperatura durante 2 horas. A continuación, los contenidos se vertieron cuidadosamente en una mezcla de 62,5 g (1,42 mol) de dióxido de carbono (como hielo seco molido en un mortero) y 150 ml de éter seco. La mezcla se descongeló hasta la TA y se extrajo tres veces con agua. Las fases acuosas combinadas se acidificaron hasta pH < 2 con ácido clorhídrico diluido y se enfriaron hasta una temperatura de 0 °C - 5 °C. La mezcla se filtró, dando 31,0 g de ácido 5-metil-3-(metilitio)-2-(trifluoroacetilamino)benzoico como residuo.

Etapa 4: Síntesis de ácido 2-amino-5-metil-3-(metilitio)benzoico

15 22,0 g (75,0 mmol) de ácido 5-metil-3-(metilitio)-2-(trifluoroacetilamino)benzoico y 9,44 g (225 mmol) de hidróxido de litio monohidrato se calentaron a reflujo en una mezcla de 200 ml de metanol y 30 ml de agua durante 4 horas. Para el procesamiento, los contenidos se enfriaron y se liberaron de los disolventes. El residuo se suspendió en agua y la mezcla se acidificó hasta un pH < 3 con ácido clorhídrico diluido. La mezcla se agitó a una temperatura de 0 °C - 5 °C durante 30 minutos y después se filtró. 15,0 g de ácido 2-amino-5-metil-3-(metilitio)benzoico de una pureza > 95 % en peso se obtuvieron como residuo.

Etapa 5: Síntesis de ácido 2-cloro-5-metil-3-(metilitio)benzoico

25 13 ml de ácido clorhídrico concentrado se añadieron a 6,00 g (30,4 mmol) de ácido 2-amino-5-metil-3-(metilitio)benzoico en 35 ml de agua y la mezcla se calentó a 60°C durante unos minutos. Después, la solución se enfrió hasta una temperatura de 0 °C - 5 °C y una solución de 2,31 g (33,5 mmol) de nitrito sódico en 10 ml de agua se añadieron lentamente gota a gota a esta temperatura. La mezcla se agitó después a esta temperatura durante 1 hora. Esta solución se añadió gota a gota a una mezcla, a TA, de 4,52 g (45,6 mmol) de cloruro de cobre (I), 35 ml de agua y 27 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos y después se calentó lentamente hasta la temperatura de reflujo. Después, los contenidos se calentaron a reflujo durante 15 minutos. Para el procesamiento, la mezcla de reacción se enfrió y se filtró, y el residuo se lavó con agua. 30 Esto dio 5,62 g de ácido 2-cloro-5-metil-3-(metilitio)benzoico como residuo.

Etapa 6: Síntesis de 2-cloro-5-metil-3-metilitio-N-(1-metiltetrazol-5-il)benzamida (N° 2-16)

35 500 mg (2,31 mmol) de ácido 2-cloro-5-metil-3-(metilitio)benzoico y 320 mg (3,23 mmol) de 5-amino-1-metiltetrazol y una cantidad catalítica de 4-(dimetilamino)piridina se disolvieron en 10 ml de piridina. 410 mg (3,23 mmol) de cloruro de oxalilo se añadieron cuidadosamente gota a gota. Después de diez minutos, la mezcla se agitó a 80 °C durante 4 h. Para llevar la reacción hasta finalizar, se añadieron otros 137 mg (1,08 mmol) de cloruro de oxalilo a TA y la mezcla se agitó a 80°C durante otras 4 horas. Para el procesamiento, los contenidos se enfriaron hasta la TA y se liberaron del disolvente en un evaporador rotatorio, y el residuo se disolvió en diclorometano. La solución se lavó con una solución de bicarbonato sódico acuoso saturado y, después, la fase orgánica se liberó del disolvente. El residuo se purificó mediante cromatografía, dando 495 mg de 2-cloro-5-metil-3-metilitio-N-(1-metiltetrazol-5-il)benzamida.

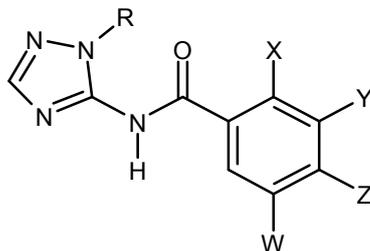
40 Los ejemplos indicados en las tablas siguientes se prepararon de forma análoga a los procedimientos mencionados anteriormente o se pueden obtener de forma análoga a los procedimientos mencionados anteriormente. Los compuestos indicados en las tablas siguientes son particularmente preferidos.

Las abreviaturas usadas indican:

Et = etilo

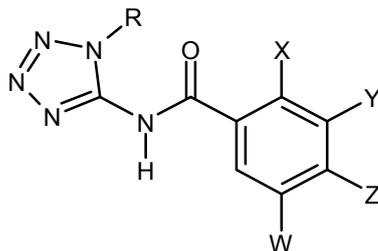
Me = metilo

Tabla 1: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I) en la que A es CY y B es CH



Nº	R	X	Y	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-1	Me	I	SMe	H	Me	7,37 (s,1H), 7,05 (s,1H), 7,00 (s,1H), 3,97 (s,3H), 2,50 (s,3H), 2,36 (s,3H) en CDCl ₃
1-2	Me	I	SO ₂ Me	H	Me	8,15 (s,1H), 7,63 (s,1H), 7,48 (s,1H), 3,95 (s,3H), 3,29 (s,3H), 2,44 (s,3H) en CDCl ₃
1-3	Me	I	SOMe	H	Me	7,71 - 7,69 (m,2H), 7,48 (s,1H), 3,96 (s,3H), 2,76 (s,3H), 2,49 (s,3H) en CDCl ₃
1-4	Me	Br	SMe	H	Me	7,34 (s,1H), 7,12 (s,1H), 7,05 (s,1H), 3,92 (s,3H), 2,51 (s,3H), 2,36 (s,3H) en CDCl ₃
1-5	Me	Br	SOMe	H	Me	7,80 (s,1H), 7,75 (s,1H), 7,57 (s,1H), 3,92 (s,3H), 2,82 (s,3H), 2,48 (s,3H) en CDCl ₃
1-6	Me	Br	SO ₂ Me	H	Me	8,14 (s,1H), 7,70 (s,1H), 7,60 (s,1H), 3,91 (s,3H), 3,31 (s,3H), 2,45 (s,3H) en CDCl ₃
1-7	Me	Cl	SMe	H	Me	
1-8	Me	Cl	SOMe	H	Me	
1-9	Me	Cl	SO ₂ Me	H	Me	
1-10	Me	Me	SMe	H	Me	
1-11	Me	Me	SOMe	H	Me	
1-12	Me	Me	SO ₂ Me	H	Me	
1-13	Me	Cl	H	F	Me	11,14 (sa,1H), 7,88 (s,1H), 7,68 (d,1H), 7,53 (d,1H), 3,75 (s,3H), 2,56 (s,3H), 2,28 (s,3H)
1-14	Me	Cl	H	SMe	Me	11,04 (sa,1H), 7,88 (s,1H), 7,51 (s,1H), 7,28 (s,1H), 3,74 (s,3H), 2,56 (s,3H), 2,26 (s,3H)
1-15	Me	Cl	H	SO ₂ Me	Me	11,42 (sa,1H), 7,99 (s,1H), 7,93 (s,1H), 7,88 (s,1H), 3,78 (s,3H), 3,34 (s,3H), 2,68 (s,3H)

Tabla 2: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I) en la que A es CY y B es N



Nº	R	X	Y	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-1	Me	Me	SMe	H	Me	7,16 (s,1H), 4,11 (s,3H), 2,49 (s,3H), 2,45 (s,3H), 2,40 (s,3H)
2-2	Me	Me	SOMe	H	Me	7,92 (s,1H), 7,59 (s,1H), 4,11 (s,3H), 2,70 (s,3H), 2,50 (s,3H), 2,42 (s,3H)
2-3	Me	Me	SO ₂ Me	H	Me	8,11 (s,1H), 7,77 (s,1H), 4,14 (s,3H), 3,14 (s,3H), 2,82 (s,3H), 2,49 (s,3H)
2-4	Et	Me	SMe	H	Me	7,16 (s,1H), 4,47 (c,2H), 2,49 (s,3H), 2,44 (s,3H), 2,40 (s,3H), 1,63 (t,3H)
2-5	Et	Me	SOMe	H	Me	7,86 (s,1H), 7,59 (s,1H), 4,46 (c,2H), 2,69 (s,3H), 2,50 (s,3H), 2,41 (s,3H), 1,64 (t,3H)
2-6	Et	Me	SO ₂ Me	H	Me	8,11 (s,1H), 7,74 (s,1H), 4,51 (c,2H), 3,15 (s,3H), 2,83 (s,3H), 2,49 (s,3H), 1,63 (t,3H)
2-7	n-Pr	Me	SMe	H	Me	
2-8	n-Pr	Me	SOMe	H	Me	
2-9	n-Pr	Me	SO ₂ Me	H	Me	
2-10	Me	NH ₂	SMe	H	Me	
2-11	Me	NH ₂	SOMe	H	Me	8,06 (s,1H), 7,29 (s,1H), 4,05 (s,3H), 2,93 (s,3H), 2,37 (s,3H)
2-12	Me	NH ₂	SO ₂ Me	H	Me	
2-13	Me	NH(C=O)CF ₃	SMe	H	Me	7,55 (s,1H), 7,35 (s,1H), 4,08 (s,3H), 2,52 (s,3H), 2,41 (s,3H)
2-14	Me	NH(C=O)CF ₃	SOMe	H	Me	
2-15	Me	NH(C=O)CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	8,01 (as,2H), 4,03 (as,3H), 3,13 (s,3H), 2,47 (as,3H)
2-16	Me	Cl	SMe	H	Me	7,32 (s,1H), 7,14 (s,1H), 4,12 (s,3H), 2,52 (s,3H), 2,41 (s,3H)

ES 2 600 082 T3

(continuación)

Nº	R	X	Y	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-17	Me	Cl	SOMe	H	Me	7,82 (s,1H), 7,65 (s,1H), 4,12 (s,3H), 2,83 (s,3H), 2,52 (s,3H)
2-18	Me	Cl	SO ₂ Me	H	Me	8,20 (s,1H), 7,75 (s,1H), 4,14 (s,3H), 3,32 (s,3H), 2,51 (s,3H)
2-19	Et	Cl	SMe	H	Me	7,31 (s,1H), 7,14 (s,1H), 4,48 (c,2H), 2,52 (s,3H), 2,41 (s,3H), 1,63 (t,3H)
2-20	Et	Cl	SOMe	H	Me	7,77 (s,1H), 7,63 (s,1H), 4,48 (c,2H), 2,82 (s,3H), 2,51 (s,3H), 1,64 (t,3H)
2-21	Et	Cl	SO ₂ Me	H	Me	8,18 (s,1H), 7,75 (s,1H), 4,51 (c,2H), 3,34 (s,3H), 2,51 (s,3H), 1,62 (t,3H)
2-22	n-Pr	Cl	SMe	H	Me	7,31 (s,1H), 7,13 (s,1H), 4,41 (t,2H), 2,51 (s,3H), 2,41 (s,3H), 2,03 (sex,2H), 0,99 (t,3H)
2-23	n-Pr	Cl	SOMe	H	Me	7,77 (s,1H), 7,63 (s,1H), 4,41 (t,2H), 2,82 (s,3H), 2,52 (s,3H), 2,05 (sex,2H), 1,01 (t,3H)
2-24	n-Pr	Cl	SO ₂ Me	H	Me	8,18 (s,1H), 7,73 (s,1H), 4,44 (t,2H), 3,34 (s,3H), 2,50 (s,3H), 2,03 (sex,2H), 0,99 (t,3H)
2-25	Me	Br	SMe	H	Me	7,20 (s,1H), 7,08 (s,1H), 4,15 (s,3H), 2,51 (s,3H), 2,39 (s,3H)
2-26	Me	Br	SOMe	H	Me	7,82 (s,1H), 7,57 (s,1H), 4,15 (s,3H), 2,82 (s,3H), 2,51 (s,3H)
2-27	Me	Br	SO ₂ Me	H	Me	8,21 (s,1H), 7,64 (s,1H), 4,17 (s,3H), 3,33 (s,3H), 2,49 (s,3H)
2-28	Et	Br	SMe	H	Me	7,19 (s,1H), 7,08 (s,1H), 4,51 (c,2H), 2,51 (s,3H), 2,39 (s,3H), 1,65 (t,3H)
2-29	Et	Br	SOMe	H	Me	7,72 (s,1H), 7,55 (s,1H), 4,50 (c,2H), 2,79 (s,3H), 2,51 (s,3H), 1,66 (t,3H)
2-30	Et	Br	SO ₂ Me	H	Me	8,19 (s,1H), 7,63 (s,1H), 4,53 (c,2H), 3,33 (s,3H), 2,49 (s,3H), 1,65 (t,3H)
2-31	n-Pr	Br	SMe	H	Me	7,19 (s,1H), 7,08 (s,1H), 4,44 (t,2H), 2,51 (s,3H), 2,39 (s,3H), 2,06 (sex,2H), 1,00 (t,3H)
2-32	n-Pr	Br	SOMe	H	Me	7,70 (s,1H), 7,54 (s,1H), 4,43 (t,2H), 2,78 (s,3H), 2,51 (s,3H), 2,07 (sex,2H), 1,03 (t,3H)

ES 2 600 082 T3

(continuación)

Nº	R	X	Y	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-33	n-Pr	Br	SO ₂ Me	H	Me	8,20 (s,1H), 7,62 (s,1H), 4,45 (t,2H), 3,33 (s,3H), 2,49 (s,3H), 2,06 (sex,2H), 1,01 (t,3H)
2-34	Me	I	SMe	H	Me	7,11 (s,1H), 7,03 (s,1H), 4,20 (s,3H), 2,50 (s,3H), 2,39 (s,3H) en CDCl ₃
2-35	Me	I	SOMe	H	Me	7,70 (s,1H), 7,64 (s,1H), 4,04 (s,3H), 2,79 (s,3H), 2,45 (s,3H)
2-36	Me	I	SO ₂ Me	H	Me	
2-37	Me	OMe	SMe	H	F	11,45 (as,1H), 7,29 (2d,2H), 3,98 (s,3H), 3,80 (s,3H), 2,5 (s,3H)
2-38	Me	OMe	SO ₂ Me	H	F	11,94 (as,1H), 8,01 (dd,1H), 7,80 (dd,1H), 4,02 (s,3H), 3,94 (s,3H), 3,37 (s,3H)
2-392	Me	Cl	H	SO ₂ Me	Me	11,96 (as,1H), 8,00 (s,1H), 7,91 (s,1H), 4,01 (s,3H), 3,35 (s,3H), 2,68 (s,3H)
2-402	Me	Cl	H	SOMe	Cl	8,18 (s,1H), 7,88 (s,1H), 4,02 (s,3H), 2,90 (s,3H)
2-41	Me	Cl	H	SO ₂ Me	Cl	8,32 (s,1H), 8,11 (s,1H), 4,02 (s,3H), 3,48 (s,3H)
2-42	Me	Cl	Me	F	Me	7,56 (d,1H), 3,98 (s,3H), 2,31 (d,3H), 2,28 (d,3H)
2-432	Me	Cl	Me	SMe	Me	
2-442	Me	Cl	Me	SOMe	Me	7,53 (s,1H), 4,00 (s,3H), 2,96 (s,3H), 2,66 (s,3H), 2,57 (s,3H)
2-452	Me	Cl	Me	SO ₂ Me	Me	11,88 (as,1H), 7,69 (s,1H), 4,01 (s,3H), 3,34 (s,3H), 2,76 (s,3H), 2,69 (s,3H)
2-462	Et	Cl	Me	SMe	Me	
2-47	Et	Cl	Me	SOMe	Me	7,53 (s,1H), 4,36 (c,2H), 2,96 (s,3H), 2,66 (s,3H), 2,57 (s,3H), 1,47 (t,3H)
2-482	Et	Cl	Me	SO ₂ Me	Me	11,78 (as,1H), 7,68 (s,1H), 4,37 (c,2H), 3,34 (s,3H), 2,76 (s,3H), 2,69 (s,3H), 1,48 (t,3H)
2-492	Pr	Cl	Me	SMe	Me	
2-50	Pr	Cl	Me	SOMe	Me	7,53 (s,1H), 4,32 (t,2H), 2,96 (s,3H), 2,66 (s,3H), 2,57 (s,3H), 1,88 (m,2H), 0,88 (t,3H)

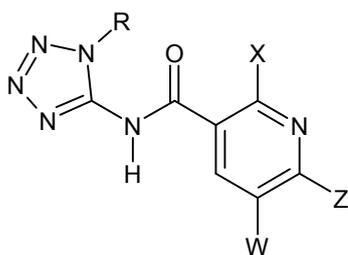
(continuación)

Nº	R	X	Y	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-51	Pr	Cl	Me	SO ₂ Me	Me	7,66 (s,1H), 4,32 (t,2H), 3,31 (s,3H), 2,76 (s,3H), 2,70 (s,3H), 1,88 (m,2H), 0,88 (t,3H)
2-52	Me	Cl	OMe	SMe	OMe	9,95 (as,1H), 7,14 (s,1H), 4,11 (s,3H), 3,97 (s,3H), 3,94 (s,3H), 2,50 (s,3H)
2-53	Me	Cl	OMe	SO ₂ Me	OMe	11,92 (as,1H), 7,49 (s,1H), 4,03 (s,3H), 3,98 (s,3H), 3,89 (s,3H), 3,37 (s,3H)
2-54	Me	Cl	CO ₂ Me	Cl	Me	
2-55	Me	Cl	CO ₂ Me	SMe	Me	
2-56	Me	Cl	CO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	
2-57	Me	Cl	CO ₂ Me	Cl	Cl	
2-58	Me	Cl	CO ₂ Me	SMe	Cl	
2-59	Me	Cl	CO ₂ Me	SO ₂ Me	Cl	
2-60	Me	Me	NH ₂	SO ₂ Me	Me	8,67 (s,1H), 6,81 (s,1H), 5,72 (s,2H), 4,12 (s,3H), 3,11 (s,3H), 2,66 (s,3H), 2,26 (s, 3H)
2-61	Me	Me	NMe ₂	SO ₂ Me	Me	11,65 (as,1H), 7,48 (s,1H), 4,00 (s,3H), 3,38 (s,3H), 2,80 (s,6H), 2,62 (s,3H), 2,35 (s,3H)
2-62	Me	Me	NHEt	SO ₂ Me	Me	10,66 (as,1H), 7,13 (s,1H), 6,28 (as,1H), 4,11 (s,3H), 3,15 (c,2H), 3,14 (s,3H), 2,68 (s,3H), 2,41 (s,3H), 1,26 (t,3H)
2-63	Me	Cl	H	SMe	Cl	11,82 (as,1H), 7,90 (s,1H), 7,41 (s,1H), 3,95 (s,3H), 2,60 (s,3H)
2-64	Me	Cl	H	SMe	Me	11,61 (as,1H), 7,57 (s,1H), 7,30 (s,1H), 3,97 (s,3H), 2,57 (s,3H), 2,27 (s,3H)
2-65	Me	Cl	H	SOMe	Me	11,85 (as,1H), 7,85 (s,1H), 7,73 (s,1H), 4,00 (s,3H), 2,75 (s,3H), 2,38 (s,3H)
2-66	Me	F	H	CN	F	11,95 (as,1H), 8,25 (dd,1H), 8,05 (dd,1H), 3,98 (s,3H)
2-67	Et	F	H	CN	F	11,89 (as,1H), 8,25 (dd,1H), 8,06 (dd,1H), 4,33 (c,2H), 1,45 (t,3H)
2-68	Et	Cl	H	SO ₂ Me	Cl	
2-69	Et	Me	NMe ₂	SO ₂ Me	Me	11,57 (as,1H), 7,47 (s,1H), 4,34 (c,2H), 3,38 (s,3H), 2,80 (s,6H), 2,62 (s,3H), 2,35 (s,3H), 1,48 (t,3H)

(continuación)

Nº	R	X	Y	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
2-70	Me	Cl	H	F	Me	
2-71	Et	Cl	H	Cl	Cl	11,85 (as,1H), 8,17 (s,1H), 8,07 (s,1H), 4,36 (c,2H), 1,47 (t,3H)
2-72	C ₂ H ₄ OMe	Me	SMe	H	Me	
2-73	C ₂ H ₄ OMe	Me	SOMe	H	Me	
2-74	C ₂ H ₄ OMe	Me	SO ₂ Me	H	Me	
2-75	C ₂ H ₄ OMe	Cl	SMe	H	Me	
2-76	C ₂ H ₄ OMe	Cl	SOMe	H	Me	
2-77	C ₂ H ₄ OMe	Cl	SO ₂ Me	H	Me	
2-78	C ₂ H ₄ OMe	Br	SMe	H	Me	
2-79	C ₂ H ₄ OMe	Br	SOMe	H	Me	
2-80	C ₂ H ₄ OMe	Br	SO ₂ Me	H	Me	
2-812	C ₂ H ₄ OMe	Cl	Me	SMe	Me	
2-822	C ₂ H ₄ OMe	Cl	Me	SO ₂ Me	Me	
2-83	C ₂ H ₄ OMe	Me	NMe ₂	SO ₂ Me	Me	10,02 (as,1H), 7,31 (s,1H), 4,64 (t,4H), 3,84 (t,2H), 3,37 (s,3H), 3,33 (s,3H), 2,88 (s,6H), 2,70 (s,3H), 2,45 (s,3H)

Tabla 3: Compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula general (I) en la que A y B son N



5

Nº	R	X	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
3-1	Me	Me	CF ₃	Me	
3-2	Me	Me	CF ₃	F	
3-3	Me	Me	CF ₃	Cl	
3-4	Me	Me	Cl	Me	
3-5	Me	Me	Cl	Cl	

(continuación)

Nº	R	X	Z	W	Datos físicos (RMN de ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz)
3-6	Me	Me	SMe	Me	
3-7	Me	Me	SO ₂ Me	Me	
3-8	Me	Me	SMe	Cl	
3-9	Me	Me	SO ₂ Me	Cl	
3-10	Me	Cl	CF ₃	Me	
3-11	Me	Cl	CF ₃	F	
3-12	Me	Cl	CF ₃	Cl	
3-13	Me	Cl	Cl	Me	
3-14	Me	Cl	Cl	F	12,08 (as,1H), 8,61 (d,1H), 4,01 (s,3H)
3-15	Et	Cl	Cl	F	11,99 (as,1H), 8,62 (d,1H), 4,37 (c,2H), 1,48 (t,3H)
3-16	Me	Cl	Cl	Cl	
3-17	Me	Cl	SMe	Me	
3-18	Me	Cl	SO ₂ Me	Me	
3-19	Me	Cl	SMe	F	
3-20	Me	Cl	SO ₂ Me	F	
3-21	Me	Cl	SMe	Cl	
3-22	Me	Cl	SO ₂ Me	Cl	

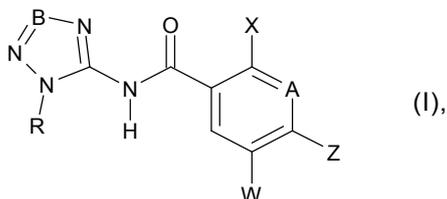
B. Ejemplos de formulación

- 5 a) Se obtiene un polvo obtenido mezclando 10 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y/o una sal del mismo y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y triturar la mezcla en un molino de martillos.
- b) Un polvo humectable fácilmente dispersable en agua se obtiene mezclando 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y/o sales del mismo, 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de lignosulfonato potásico y 1 parte en peso de oleilmetilaurato sódico como agente humectante y dispersante, y moliendo la mezcla en un molino en disco articulado.
- 10 c) Un concentrado de dispersión fácilmente dispersable en agua se obtiene mezclando 20 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y/o sales del mismo con 6 partes en peso de alquilfenilpoliglicoléter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanol poliglicoléter (8 EO) y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico (intervalo de ebullición, por ejemplo, de aproximadamente 255 a por encima de 277 °C), y triturando la mezcla en un molino de bolas hasta una fineza inferior a 5 micrómetros.
- 15 d) Se obtiene un concentrado emulsionable a partir de 15 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y/o sales del mismo, 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol etoxilado como emulsionante.
- e) Se obtienen gránulos dispersables en agua mezclando
- 75 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y/o sales del mismo,
- 20 10 partes en peso de lignosulfonato de calcio,

- 5 partes en peso de laurilsulfato sódico,
 3 partes en peso de poli(alcohol vinílico), y
 7 partes en peso de caolín,
 5 moliendo la mezcla en un molino de disco articulado y granulando el polvo en un lecho fluidizado mediante aplicación con pulverización de agua como líquido de granulación.
- f) También se obtienen gránulos dispersables en agua homogeneizando y pretriturando
 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y/o sales del mismo,
 5 partes en peso de 2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato sódico,
 2 partes en peso de oleoilmetilaurato sódico,
 10 1 parte en peso de poli(alcohol vinílico),
 17 partes en peso de carbonato cálcico, y
 50 partes en peso de agua
 en un molino coloidal, moliendo después la mezcla en un molino de bolas y atomizando y secando la suspensión resultante en una torre de pulverización por medio de una boquilla para una sustancia.
- 15 C. Ejemplos biológicos
1. Acción herbicida preemergencia contra plantas dañinas
- Semillas de plantas de malas hierbas y plantas de cultivo monocotiledóneas y dicotiledóneas se introducen en macetas de fibra de madera en marga arenosa y se cubren con tierra. Los compuestos de la invención formulados en forma de polvos humectables (PH) o como concentrados en emulsión (CE) se aplican después a la superficie del suelo de cobertura como una suspensión acuosa o emulsión a una tasa de aplicación de agua de 600 a 800 l/ha (convertido) con adición de 0,2% de agente humectante. Después del tratamiento, las macetas se introducen en un invernadero y se mantienen en buenas condiciones de crecimiento para las plantas de ensayo. El daño a las plantas de ensayo se evalúa visualmente después de un periodo de ensayo de 3 semanas en comparación con controles sin tratar (actividad herbicida en porcentaje (%): 100 % de la acción = las plantas han muerto, 0 % de acción = como plantas control). Por ejemplo, en el presente documento, los compuestos N° 1-06, 2-01, 2-02, 2-03, 2-04, 2-05, 2-06, 2-16, 2-19, 2-21, 2-37, 2-43, 2-48, 2-49, 2-64 y 2-69, a una tasa de aplicación de 320 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos un 80% contra *Alopecurus myosuroides* y *Amaranthus retroflexus*. Los compuestos N° 2-17, 2-18, 2-20, 2-22, 2-23, 2-24, 2-27, 2-30, 2-33, 2-44, 2-45, 2-46, 2-47 y 2-62, a una tasa de aplicación de 320 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos un 80% contra *Cyperus serotinus* y *Setaria viridis*. Los compuestos N° 2-25, 2-26, 2-28, 2-29, 2-37, 2-42 y 2-34, a una tasa de aplicación de 320 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos un 80% contra *Abutilon theophrasti* y *Avena fatua*. Los compuestos N° 2-32, 2-37, 2-39, 2-50, 2-51, 2-61, 2-69 y 2-83, a una tasa de aplicación de 320 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos un 80% contra *Echinochloa crus galli* y *Veronica persica*.
- 35 2. Acción herbicida postemergencia contra plantas dañinas
- Semillas de plantas de malas hierbas y plantas de cultivo monocotiledóneas y dicotiledóneas se introducen en macetas de fibra de madera en marga arenosa cubierta por tierra y se cultivan en invernadero en condiciones de crecimiento buenas. De 2 a 3 semanas después de la siembra, las plantas de ensayo se tratan en la etapa de una hoja. Los compuestos de la invención formulados en forma de polvos humectables (PH) o como concentrados en emulsión (CE) se rocían sobre las partes verdes de las plantas como una suspensión acuosa o emulsión a una tasa de aplicación de agua de 600 a 800 l/ha (convertido) con adición de 0,2% de agente humectante. Después de dejar reposar las plantas de ensayo en el invernadero en condiciones de crecimiento óptimas durante aproximadamente 3 semanas, la acción de las formulaciones se evalúa visualmente en comparación con los controles no tratados (acción herbicida en porcentaje (%): Actividad 100 %= las plantas han muerto, actividad 0%= plantas control similares). En el presente documento, los compuestos N° 1-02, 1-03, 1-05, 1-06, 1-14, 1-15, 2-01, 2-02, 2-03, 2-04, 2-05, 2-06, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 2-25, 2-26, 2-27, 2-28, 2-29, 2-30, 2-31, 2-33, 2-34, 2-35, 2-39, 2-40, 2-41, 2-43, 2-44, 2-45, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-69 y 2-83 muestran cada uno, a una tasa de aplicación de 80 g/ha, una actividad de al menos un 80% contra *Abutilon theophrasti* y *Veronica persica*. Los compuestos N° 1-14, 2-32, 2-42, 2-66, 2-67, 2-69 y 2-83, a una tasa de aplicación de 80 g/ha, cada uno muestra una actividad de al menos un 80% contra *Amaranthus retroflexus* y *Stellaria media*.

REIVINDICACIONES

1. Amidas de ácido N-(tetrazol-5-il)- o N-(triazol-5-il)arilcarboxílico sustituidas con 5-fenilo de la fórmula (I) o sales de las mismas.



5 en la que

A significa N o CY,

B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, formilo, tiocianato, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, alquilheteroarilo (C₁-C₆), alquilheterociclilo (C₁-C₆), en los que los dos últimos radicales mencionados está cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) y haloalcoxi (C₁-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,

Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquenilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-CN, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, alquilfenilo (C₁-C₆), alquilheteroarilo (C₁-C₆), alquilheterociclilo (C₁-C₆), fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en los que los últimos 6 radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo,

Z significa halógeno, ciano, tiocianato, halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, heteroarilo, heterociclilo o fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) o halo-alcoxi (C₁-C₆) y en los que el heterociclilo porta n grupos oxo, o

Z también puede significar hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) o alcoxi (C₁-C₆) si Y representa el radical S(O)_nR²,

W significa alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), halocicloalquilo (C₃-C₇), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₄), halógeno, nitro, NR³COR³ o ciano,

R significa alquilo (C₁-C₈), halo-alquilo (C₁-C₈), alquenilo (C₂-C₈), halo-alquenilo (C₂-C₈), alquinilo (C₂-C₈), halo-alquinilo (C₂-C₈), en donde estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno con s radicales del grupo que consiste en hidroxilo, nitro, ciano, SiR⁵₃, PO(OR⁵)₂, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), N(R³)₂, COR³, COOR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, O-alquilo (C₁-C₂)-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, en donde los siete últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo o,

- R significa cicloalquilo (C₃-C₇), heteroarilo, heterociclilo o fenilo, cada uno de los cuales está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄), en donde heterociclilo porta n grupos oxo,
- 5 Q significa O, S o NR³,
- R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilalquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que los 21 últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 10 NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en los que los 21 últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 15 R² significa alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenilalquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en donde los 21 últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 20 NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en donde los 21 últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, tiocianato, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxycarbonilo (C₂-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- R³ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o fenilo,
- R⁴ significa alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆) o fenilo,
- 25 R⁵ significa alquilo (C₁-C₄),
- n significa 0, 1 o 2;
- s significa 0, 1, 2 o 3.
2. Amidas de ácido N-(tetrazol-5-il)- o N-(triazol-5-il)arilcarboxílico sustituidas con 5-fenilo de acuerdo con la reivindicación 1, en las que
- 30 A significa N o CY,
- B significa N o CH,
- X significa nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹ o alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilo (C₁-C₆)-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-heterociclilo, en donde los dos últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en radicales halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) y halo-alcoxi (C₁-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 35 alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹ o alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilo (C₁-C₆)-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en donde los seis últimos radicales mencionados están sustituidos cada uno con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 40 con s radicales del grupo que consiste en radicales halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) y halo-alcoxi (C₁-C₆), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 45 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, tiocianato, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalqueno (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, OR¹, COOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-S(O)_nR², alquilo (C₁-C₆)-OR¹, alquilo (C₁-C₆)-OCOR¹, alquilo (C₁-C₆)-OSO₂R², alquilo (C₁-C₆)-CO₂R¹, alquilo (C₁-C₆)-SO₂OR¹, alquilo (C₁-C₆)-CON(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-SO₂N(R¹)₂, alquilo (C₁-C₆)-NR¹COR¹, alquilo (C₁-C₆)-NR¹SO₂R², alquilo (C₁-C₆)-fenilo, alquilo (C₁-C₆)-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-heterociclilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en donde los seis últimos radicales mencionados están sustituidos cada uno con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄) y cianometilo, y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,
- 50 Z significa halógeno, ciano, tiocianato, halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), halo-cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹, COOR¹, C(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹,

$\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, NR^1COR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OCOR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OSO_2R^2 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- CO_2R^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- SO_2OR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{CON}(\text{R}^1)_2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^1COR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$ o 1,2,4-triazol-1-ilo, o

Z también puede significar hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) o alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) si Y representa el radical $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$,

5 W significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), haloalcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), halógeno o ciano,

R significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_8$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_8$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_8$), halo-alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_8$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_8$), halo-alquino ($\text{C}_2\text{-C}_8$), en donde estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno por s radicales del grupo que consiste en nitro, ciano, SiR^5_3 , $\text{P}(\text{OR}^5)_3$, $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{N}(\text{R}^3)_2$, COR^3 , COOR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, en donde los siete últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo o,

10 R significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), halo-alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), halo-alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), en donde estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno por s radicales del grupo que consiste en nitro, ciano, SiR^5_3 , $\text{P}(\text{OR}^5)_3$, $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{N}(\text{R}^3)_2$, COR^3 , COOR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), heteroarilo, heterociclilo, fenilo, Q-heteroarilo, Q-heterociclilo, Q-fenilo y Q-bencilo, en donde los siete últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo o,

15 R significa cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), heteroarilo, heterociclilo o fenilo, cada uno de los cuales está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$),

Q significa O, S o NR^3 ,

20 R^1 significa hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), fenilo, fenilo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heteroarilo, alquilheteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heterociclilo, alquilheterociclilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heteroarilo, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heterociclilo, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heteroarilo o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heterociclilo, en donde los dieciséis últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR^3 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^4$, $\text{N}(\text{R}^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, CO_2R^3 , $\text{CON}(\text{R}^3)_2$ y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxycarbonilo ($\text{C}_2\text{-C}_6$), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,

25 R^2 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), fenilo, fenilo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heteroarilo, alquilheteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), heterociclilo, alquilheterociclilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heteroarilo, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-O-heterociclilo, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heteroarilo o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^3 -heterociclilo, en donde estos dieciséis últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR^3 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^4$, $\text{N}(\text{R}^3)_2$, NR^3OR^3 , $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^4$, COR^3 , OCOR^3 , NR^3COR^3 , CO_2R^3 , $\text{CON}(\text{R}^3)_2$ y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alcoxycarbonilo ($\text{C}_2\text{-C}_6$), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,

30 R^3 significa hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$) o cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$),

R^4 significa alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) o alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$),

35 R^5 significa metilo o etilo,

n significa 0, 1 o 2;

s significa 0, 1, 2 o 3.

3. Amidas de ácido N-(triazol-5-il)- o N-(triazol-5-il)arilcarboxílico sustituidas con 5-fenilo de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2, en las que

40 A significa N o CY,

B significa N o CH,

X significa nitro, halógeno, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), OR^1 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{CON}(\text{R}^1)_2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^1COR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, alquilheteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilheterociclilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), en donde los dos últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales de halógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) y halo-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,

50 Y significa hidrógeno, nitro, halógeno, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), OR^1 , $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, $\text{N}(\text{R}^1)_2$, $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, NR^1COR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- OR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{CON}(\text{R}^1)_2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^1COR^1 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$, alquilfenilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilheteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alquilheterociclilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), fenilo, heteroarilo o heterociclilo, en donde los últimos 6 radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$), $\text{S}(\text{O})_n$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$) y

cianometilo, y en donde el heterociclilo porta n grupos oxo,

Z significa halógeno, ciano, haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_nR², 1,2,4-triazol-1-ilo, o

Z también puede significar hidrógeno, metilo, metoxi o etoxi si Y representa el radical S(O)_nR²,

W significa metilo, etilo, metoximetilo, metoxi, flúor, cloro o S(O)_nCH₃,

5 R significa alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), halo-alquino (C₂-C₆), en donde estos seis radicales mencionados anteriormente están sustituidos cada uno con s radicales del grupo que consiste en ciano, S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), COR³, COOR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, cicloalquilo (C₃-C₆), heteroarilo, heterociclilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, ciano y halógeno, y en donde el heterociclilo porta de 0 a 2 grupos oxo o,

10 R significa fenilo que está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), S(O)_n-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄),

15 R¹ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-alquilo (C₁-C₆), fenilo, fenil-alquilo (C₁-C₆), heteroarilo, alquilheteroarilo (C₁-C₆), heterociclilo, alquilheterociclilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆)-O-heteroarilo, alquilo (C₁-C₆)-O-heterociclilo, alquilo (C₁-C₆)-NR³-heteroarilo o alquilo (C₁-C₆)-NR³-heterociclilo, en donde los dieciséis últimos radicales mencionados están cada uno sustituido con s radicales del grupo que consiste en ciano, halógeno, nitro, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ y alcoxi (C₁-C₄)-alcoxicarbonilo (C₂-C₆), y en donde el

20 heterociclilo porta n grupos oxo,
R² significa alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), cada uno de los cuales está sustituido con s radicales del grupo que consiste en halógeno y OR³,

R³ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₆).

R⁴ significa alquilo (C₁-C₆),

25 R⁵ significa metilo o etilo,

n significa 0, 1 o 2;

s significa 0, 1, 2 o 3.

4. Composición herbicida caracterizada por una cantidad con eficacia herbicida de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.

30 5. Composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 4 mezclada con auxiliares de formulación.

6. Composición herbicida de acuerdo con las reivindicaciones 4 o 5, que contiene al menos una sustancia con actividad plaguicida adicional del grupo de insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores del crecimiento.

7. Composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 6, que contiene un protector selectivo.

35 8. Composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 7, que contiene cipsulfamida, cloquintocet-mexilo, mepfenpir-dietilo o isoxadifen-etilo.

9. Composición herbicida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 6 a 8, que contiene un herbicida adicional.

40 10. Procedimiento para combatir plantas indeseadas, que se caracteriza porque una cantidad eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o de una composición herbicida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 4 a 9 se aplica a las plantas o al sitio de crecimiento de las plantas indeseadas.

11. Uso de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o de una composición herbicida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 4 a 9 para combatir plantas indeseadas.

45 12. Uso de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizado porque los compuestos de la fórmula (I) se usan para combatir plantas indeseadas en cultivos de plantas útiles.

13. Uso de acuerdo con la reivindicación 12, caracterizado porque las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.