



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 296 207**

51 Int. Cl.:
C07D 413/14 (2006.01)
A01N 47/38 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **05761599 .9**
86 Fecha de presentación : **13.07.2005**
87 Número de publicación de la solicitud: **1773825**
87 Fecha de publicación de la solicitud: **18.04.2007**

54 Título: **Compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos con dioxazinilo.**

30 Prioridad: **28.07.2004 DE 10 2004 036 551**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.04.2008

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.04.2008

73 Titular/es: **Bayer CropScience Aktiengesellschaft
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es: **Gesing, Ernst, R., F.;**
Feucht, Dieter;
Kehne, Heinz;
Auler, Thomas y
Hills, Martin

74 Agente: **Lehmann Novo, María Isabel**

ES 2 296 207 T3

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

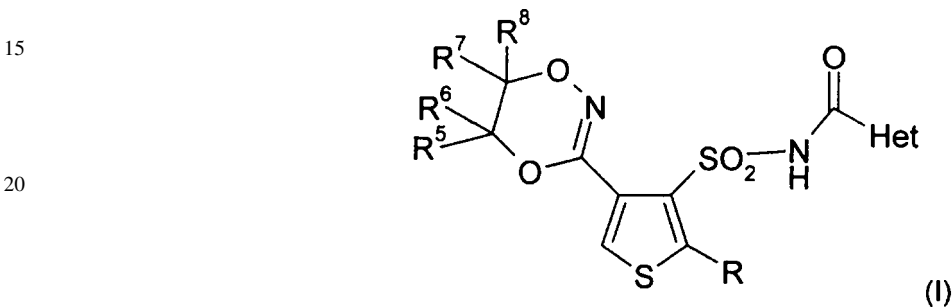
DESCRIPCIÓN

Compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos con dioxazinilo.

5 El invento se refiere a nuevos compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos, a procedimientos y productos intermedios para su preparación y a su utilización como herbicidas.

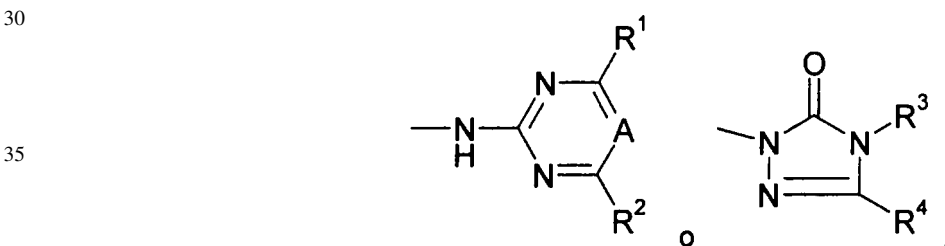
10 Ya es sabido que determinados compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos con dioxazinilo presentan propiedades herbicidas (compárese el documento de patente de los EE.UU. US 5.476.936). Sin embargo, la actividad herbicida de estos compuestos conocidos no es satisfactoria en todas las cuestiones.

Se encontraron por fin los nuevos compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos de la fórmula general (I)



en la que

Het representa



40 A representa nitrógeno o una agrupación CH,

R representa hidrógeno, ciano, nitro, halógeno, representa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquil-sulfino o alquilsulfonilo en cada caso con 1 a 6 átomos de carbono en el grupo alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o representa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi o alquiniloxi en cada caso con 2 a 6 átomos de carbono en el grupo alquenilo o alquinilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano o halógeno,

50 R¹ representa hidrógeno, representa halógeno, representa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o representa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahydrofuriloxi en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄,

55 R² representa hidrógeno, representa halógeno, representa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o representa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahydrofuriloxi, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄,

60 R³ representa hidrógeno, hidroxí, amino, ciano, representa alquiliden C₂-C₁₀-amino, representa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-carbonilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alquenilo o alquinilo en cada caso con 2 a 6 átomos de carbono, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, y/o bromo, representa alcoxi, alquilamino o alquilcarbonilamino en cada caso con 1 a 6 átomos de carbono en el grupo alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, alcoxi C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alqueniloxi con 3 a 6 átomos de carbono, representa dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, representa cicloalquilo, cicloalquilamino o cicloalquilalquilo en cada caso con 3 a 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano y/o alquilo C₁-C₄, o

ES 2 296 207 T3

representa arilo o arilalquilo en caso con 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo y/o alcoxi C₁-C₄,

5 R⁴ representa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, amino, ciano, fluoro, cloro, bromo, yodo, representa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-carbonilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alquenilo o alquinilo en cada caso con 2 a 6 átomos de carbono, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, representa alcoxi, alquiltio, alquilamino o alquilcarbonilamino en cada caso con 1 a 6 átomos de carbono en el grupo alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, alcoxi C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquintiltio, alquenilamino o alquinilamino en cada caso con 3 a 6 átomos de carbono en el grupo alquenilo o alquinilo, representa dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, representa cicloalquilo, cicloalquenilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino en cada caso con 3 a 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo o cicloalquenilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano y/o alquilo C₁-C₄, o representa arilo, arilalquilo, ariloxi, arilalcoxi, ariltio, arilalquiltio, arilamino o arilalquilamino en cada caso con 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo, alcoxi C₁-C₄ y/o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, y

20 R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ independientemente unos de otros, representan hidrógeno, halógeno, ciano o tiocianato, o representan alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o alquilamino-carbonilo en cada caso con 1 a 3 átomos de carbono en la parte de alquilo, eventualmente sustituido con halógeno,

así como sales de compuestos de la fórmula (I).

30 Las agrupaciones hidrocarbilo saturadas o insaturadas, tales como alquilo, alquenilo o alquinilo son, siempre que sea posible, en cada caso lineales o ramificadas - también en uniones con heteroátomos, tal como en alcoxi -.

Los radicales eventualmente sustituidos pueden estar sustituidos una vez o múltiples veces, pudiendo los sustituyentes ser iguales o diferentes en el caso de una sustitución múltiple.

35 R de modo preferido, representa hidrógeno, ciano, fluoro, cloro, bromo, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi, o representa propenilo, butenilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro o cloro.

40 R de modo especialmente preferido, representa fluoro, cloro, bromo, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi.

45 R de modo sumamente preferido, representa metilo, etilo, n- o i-propilo.

50 R¹ de modo preferido, representa hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi.

55 R¹ de modo especialmente preferido, representa fluoro, cloro, bromo o yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, eventualmente sustituido con fluoro o cloro, o representa dimetilamino.

R² de modo preferido, representa fluoro, cloro, bromo, yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, eventualmente sustituido en cada caso con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi.

60 R² de modo especialmente preferido, representa fluoro, cloro, bromo o yodo, o representa metilo, etilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, eventualmente sustituido con fluoro o cloro, o representa dimetilamino.

65 R³ de modo preferido, representa hidrógeno, hidroxilo, amino, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi o etoxi, representa etenilo, propenilo, butenilo, propinilo o butinilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, representa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metilamino, etilamino, n- o i-propil-

ES 2 296 207 T3

lamino, n-, i-, s- o t-butilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi o etoxi, representa propeniloxi o buteniloxi, representa dimetilamino o dietilamino, representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, metilo y/o etilo, o representa fenilo o bencilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, metilo, trifluorometilo y/o metoxi.

R³ de modo especialmente preferido, representa metilo, etilo, n- o i-propilo o ciclopropilo.

R⁴ de modo preferido, representa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, amino, ciano, fluoro, cloro, bromo, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, representa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo o butinilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, representa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, acetilamino o propionilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, representa propeniloxi, buteniloxi, etiniloxi, propiniloxi, butiniloxi, propeniltio, buteniltio, propiniltio, butiniltio, propenilamino, butenilamino, propinilamino o butinilamino, representa dimetilamino, dietilamino o dipropilamino, representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltío, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, metilo y/o etilo, o representa fenilo, bencilo, fenoxi, benciloxi, feniltio, benciltío, fenilamino o bencilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, metoxi o metoxi-carbonilo.

R⁴ de modo especialmente preferido, representa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi.

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ de modo preferido, representan, independientemente unos de otros, hidrógeno o metilo.

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ de modo especialmente preferido, representan hidrógeno.

Son objeto del invento preferiblemente también las sales de sodio, potasio, magnesio, calcio, amonio, alquil C₁-C₄-amonio, di-(alquil C₁-C₄)-amonio, tri-(alquil C₁-C₄)-amonio, tetra-(alquil C₁-C₄)-amonio, tri-(alquil C₁-C₄)-sulfonio, cicloalquil C₅ o C₆-amonio y di-(alquil C₁-C₂)-bencil-amonio de compuestos de la fórmula (I), en la que A, Het, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ tienen los significados antes indicados de modo preferente.

Las definiciones de radicales generales antes expuestas, o expuestas en intervalos preferentes, son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para las sustancias de partida o productos intermedios que se necesitan en cada caso para la preparación. Estas definiciones de radicales se pueden combinar arbitrariamente entre ellas, por lo tanto también entre los intervalos indicados de compuestos preferidos.

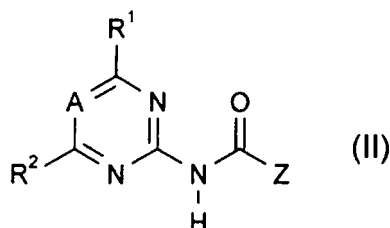
Se prefieren conforme al invento los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados precedentemente expuestos como preferidos.

Se prefieren especialmente conforme al invento los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados precedentemente expuestos como especialmente preferidos.

Los nuevos compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos de la fórmula general (I) se distinguen por una fuerte actividad herbicida.

Los nuevos compuestos de tienilsulfonilaminocarbonilo sustituidos de la fórmula general (I) se obtienen, cuando

(a) se hacen reaccionar aminoazinas sustituidas de la fórmula general (II)



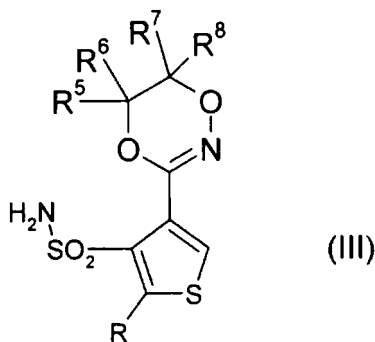
en la que

A, R¹ y R² tienen los significados antes indicados, y

5 Z representa halógeno, alcoxi o ariloxi,

con derivados de tiofeno de la fórmula general (III)

10



15

20

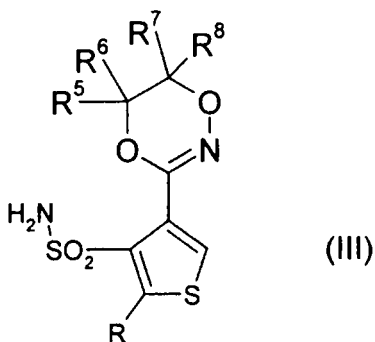
en la que

25 R y R⁵ hasta R⁸ tienen los significados antes indicados,

eventualmente en presencia de un agente coadyuvante de reacción y eventualmente en presencia de un agente diluyente, o

30 (b) se hacen reaccionar tiofeno-3-sulfonamidas sustituidas de la fórmula general (III)

35



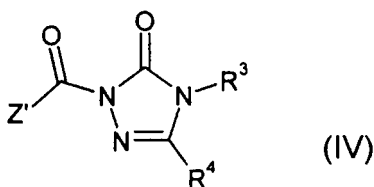
40

45

en la que R y R⁵ hasta R⁸ tienen los significados antes indicados,

con triazolinonas sustituidas de la fórmula general (IV)

50



55

en la que

60 R³ y R⁴ tienen los significados antes indicados, y

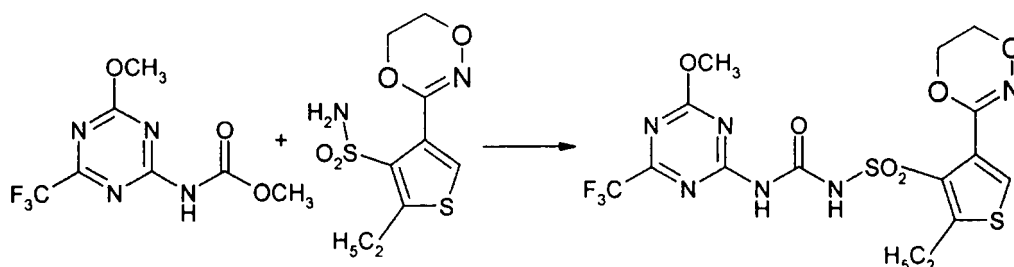
Z' representa halógeno, alcoxi, ariloxi o arilalcoxi,

65 eventualmente en presencia de un agente coadyuvante de reacción y eventualmente en presencia de un agente diluyente,

y eventualmente los compuestos de la fórmula (I), obtenidos de acuerdo con los procedimientos (a) o (b), se transforman en sales de acuerdo con métodos usuales.

ES 2 296 207 T3

Si, por ejemplo, se utilizan 2-metoxicarbonilamino-4-metoxi-6-trifluorometil-1,3,5-triazina y 2-etil-4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-tiofeno-3-sulfonamida como sustancias de partida, entonces la evolución de la reacción en el procedimiento (a) conforme al invento se puede bosquejar de acuerdo con el siguiente esquema de fórmulas:



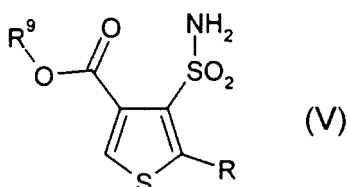
20 Las aminoazinas sustituidas, que se han de utilizar como sustancias de partida en el procedimiento conforme al invento para la preparación de los compuestos de la fórmula (I), están definidas en general por la fórmula (II). En la fórmula (II) A, R¹ y R² tienen de modo preferido o en particular los significados que ya se habían indicado con anterioridad en conexión con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) como preferidos, o como preferidos en particular, para A, R¹ y R²; Z representa preferiblemente fluoro, cloro, bromo, alcoxi C₁-C₄ o fenoxi, en particular representa cloro, metoxi, etoxi o fenoxi.

25 Las sustancias de partida de la fórmula (II) son conocidas y/o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos de por sí conocidos (compárense el documento US 4.690.707 y el documento de patente alemana 19501174).

30 Los derivados de tiofeno, que se han de utilizar adicionalmente como sustancias de partida en el procedimiento conforme al invento, están definidos en términos generales por la fórmula (III). En la fórmula (III), R y R⁵ hasta R⁸ tienen de modo preferido o en particular los significados que ya se habían indicado con anterioridad en conexión con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) como preferidos, o como preferidos en particular, para R y R⁵ hasta R⁸.

35 Las tiofeno-3-sulfonamidas sustituidas de la fórmula general (III) no son conocidas todavía a partir de la bibliografía, como tales, son asimismo objeto del presente invento. Dentro de los compuestos de la fórmula (III), se prefieren aquellos, en los que R no representa hidrógeno.

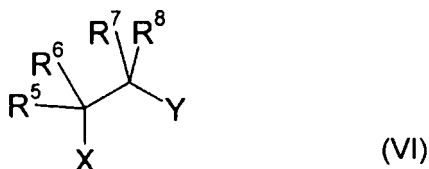
40 Se obtienen las tiofeno-3-sulfonamidas sustituidas de la fórmula general (III), cuando se hacen reaccionar tiofeno-3-sulfonamidas sustituidas de la fórmula general (V)



en la que

50 R tiene el significado antes indicado y R⁹ representa alquilo C₁-C₄,

con hidrocloreuro de hidroxilamina y con un alcano sustituido de la fórmula (VI)



60 en la que R⁵ hasta R⁸ tienen los significados indicados, y

X e Y independientemente uno de otro, representan halógeno, alquil C₁-C₆-carboniloxi, aril C₆-C₁₂-carboniloxi, alquil C₁-C₆-sulfoniloxi o aril C₁-C₆-sulfoniloxi,

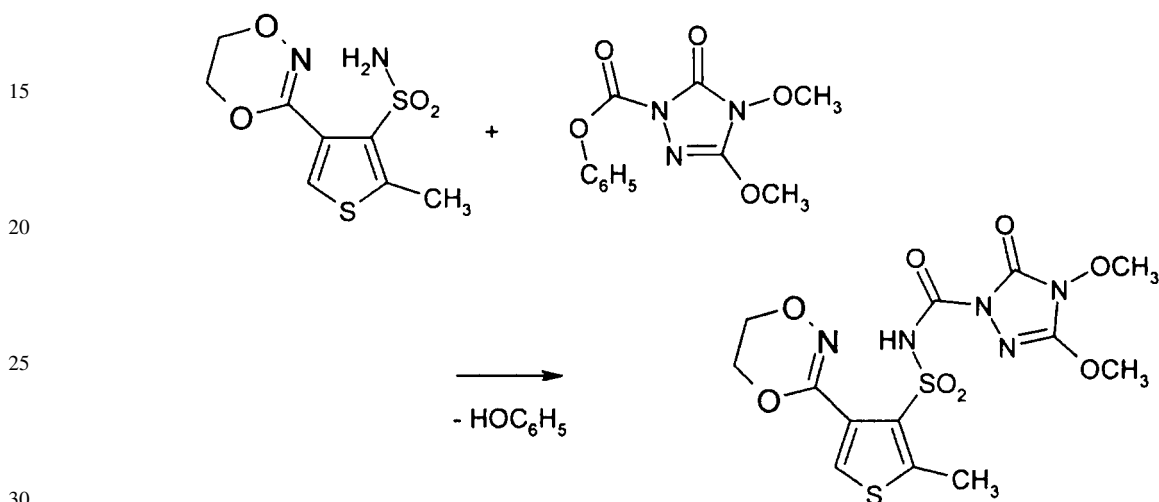
65 eventualmente en presencia de un agente diluyente y eventualmente en presencia de un agente coadyuvante de reacción (compárense el Ejemplo de preparación). Procedimientos análogos se conocen también a partir del documento US 5.476.936 (compárense las columnas 11/12).

ES 2 296 207 T3

Las sustancias de partida de la fórmula (V) son conocidas y/o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos de por sí conocidos (compárense los documentos de solicitudes de patentes internacionales WO 01/05788, WO 01/10863).

5 Los alcanos de la fórmula (VI) son obtenibles comercialmente como productos químicos de síntesis o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos de por sí conocidos (compárense el documento US 5.476.936, columna 13).

Si se utilizan por ejemplo 2-metil-4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-tiofeno-3-sulfonamida y 4,5-dimetoxi-fenoxycarbonil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona como sustancias de partida, entonces la evolución de la reacción en el procedimiento (b) conforme al invento se puede bosquejar mediante el siguiente esquema de fórmulas:



35 Las tiofeno-3-sulfonamidas sustituidas, que se han de utilizar como sustancias de partida en el procedimiento (b) conforme al invento para la preparación de compuestos de la fórmula general de la fórmula (I), se definen en general por la fórmula (III). Se trata de los mismos compuestos de la fórmula (III) que se utilizan de acuerdo con el procedimiento (a) conforme al invento.

40 Las triazolinonas sustituidas, que se han de utilizar adicionalmente como sustancias de partida en el procedimiento (b) conforme al invento para la preparación de compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por la fórmula (IV). En la fórmula general (IV) R³ y R⁴ tienen de modo preferido, o en particular, los significados que ya se han indicado con anterioridad en conexión con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) conformes al invento como preferidos o como preferidos en particular para R³ y R⁴.

45 Las sustancias de partida de la fórmula general (IV) son conocidas y/o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos de por sí conocidos (compárense también las menciones en el documento WO 01/05788). Z' en la fórmula (IV) representa de modo preferido cloro, bromo, metoxi, etoxi, fenoxi o benciloxi.

50 Como agentes diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (b) conformes al invento y del procedimiento para la preparación de los productos intermedios de la fórmula (III), entran en consideración sobre todo disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen en particular hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, eventualmente halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres tales como dietil-éter, diisopropil-éter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicol-dimetil- o -dietil-éter; cetonas tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetil-formamida, N,N-dimetil-acetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametil-triamida de ácido fosfórico; ésteres tales como el éster metílico de ácido acético o éster etílico de ácido acético, así como sulfóxidos tales como dimetil-sulfóxido.

60 Los procedimientos (a) y (b) conformes al invento así como el procedimiento para la preparación de los productos intermedios de la fórmula (III) se llevan a cabo de modo preferido en presencia de un apropiado agente coadyuvante de reacción. Como tales entran en cuestión todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen por ejemplo hidruros, hidróxidos, amiduros, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrógeno-carbonatos de metales alcalino-térreos o alcalinos, tales como por ejemplo hidruro de sodio, amiduro de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc.-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio o carbonato de amonio, así como aminas terciarias, tales como trimetil-amina, trietil-amina, tributil-amina, N,N-dimetil-anilina, piridina, N-metil-piperidina, N,N-dimetil-amino-piridina, diaza-biciclooctano (DABCO), diaza-biciclononeno (DBN) o diaza-biciclundeceno (DBU).

ES 2 296 207 T3

Las temperaturas de reacción se pueden hacer variar en un intervalo más grande en el caso de la realización del procedimiento (a) conforme al invento. Por lo general, se trabaja a unas temperaturas comprendidas entre -20°C y +150°C, de modo preferido entre -10°C y +120°C.

5 Las temperaturas de reacción se pueden hacer variar en un intervalo más grande en el caso de la realización del procedimiento (b) conforme al invento. Por lo general se trabaja a unas temperaturas comprendidas entre -20°C y +150°C, de modo preferido entre 0°C y +100°C.

10 Las temperaturas de reacción se pueden hacer variar en un intervalo más grande en el caso de la realización del procedimiento para la preparación de los productos intermedios de la fórmula (III). Por lo general se trabaja a unas temperaturas comprendidas entre 0°C y +150°C, de modo preferido entre -10°C y +80°C.

15 Los procedimientos (a) y (b) conformes al invento y el procedimiento para la preparación de los productos intermedios de la fórmula (III) se llevan a cabo por lo general bajo una presión normal. Sin embargo, también es posible llevar a cabo los procedimientos conformes al invento bajo una presión elevada o reducida - por lo general entre 0,1 bar y 10 bar -.

20 Para la realización de los procedimientos (a) y (b) conformes al invento y del procedimiento para la preparación de los productos intermedios de la fórmula (III), las sustancias de partida se emplean por lo general en cantidades aproximadamente equimolares. Sin embargo, también es posible utilizar uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo por lo general en el seno de un apropiado agente diluyente en presencia de un agente coadyuvante de reacción, y la mezcla de reacción se agita por lo general durante varias horas a la temperatura necesaria. El tratamiento se lleva a cabo de acuerdo con métodos usuales (compárense los Ejemplos de preparación).

25 A partir de los compuestos conformes al invento de la fórmula general (I) se pueden preparar eventualmente sales. Se obtienen tales sales de una manera sencilla de acuerdo con usuales métodos de formación de sales, por ejemplo por disolución o dispersamiento de un compuesto de la fórmula (I) en un apropiado disolvente, tal como p.ej. cloruro de metileno, acetona, terc.-butil-metil-éter o tolueno, y por adición de una base apropiada. Las sales entonces - eventualmente después de una agitación prolongada - se pueden aislar mediante concentración por evaporación o filtración con succión.

30 Las sustancias activas conformes al invento se pueden utilizar como agentes desfoliantes, desecantes, agentes para la destrucción de hierbas y en particular como agentes para la aniquilación de las malezas. Como una maleza han de entenderse en su sentido más amplio todas las plantas, que crecen en sitios, en donde ellas son indeseadas. El hecho de que las sustancias conformes al invento actúen como herbicidas totales o selectivos, depende en lo esencial de la cantidad consumida.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden utilizar p.ej. en los casos de las siguientes plantas:

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

Plantas cultivadas dicotiledóneas de los géneros: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

50 Malezas 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.

55 Plantas cultivadas monocotiledóneas de los géneros: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

60 La utilización de las sustancias activas conformes al invento no está limitada, sin embargo, de ninguna de las maneras a estos géneros, sino que se extiende de igual manera también a otras plantas.

65 Las sustancias activas conformes al invento son apropiadas, dependiendo de la concentración, para la represión total de malezas, p.ej. en instalaciones industriales y de vías ferroviarias, y en caminos y plazas con o sin vegetación de arbolado. Asimismo, las sustancias activas conformes al invento se pueden emplear para la represión de malezas en cultivos permanentes, p.ej. bosques, plantaciones de árboles de madera ornamental, frutícolas, vinícolas, cítrícolas, nogales, bananales, café, té, caucho, palma oleífera, cacao, frutas de bayas y lúpulo, en céspedes ornamentales y deportivos, y en superficies de prados, así como para la represión selectiva de malezas en cultivos monoanuales.

ES 2 296 207 T3

Los compuestos conformes al invento muestran una fuerte actividad herbicida y un amplio espectro de efectos en el caso de la aplicación sobre el suelo y sobre las partes de las plantas situadas por encima de la tierra. Ellos son apropiados en cierto grado también para la represión selectiva de malezas monocotiledóneas y dicotiledóneas en plantas cultivadas monocotiledóneas y dicotiledóneas, en el procedimiento tanto de antes del brote como también de después del brote.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden utilizar, en determinadas concentraciones y respectivamente cantidades consumidas, también para la represión de plagas animales y enfermedades fúngicas o bacterianas de las plantas. Eventualmente, ellas se pueden utilizar también como productos intermedios o precursores para la síntesis de otras sustancias activas.

Conforme al invento, se pueden tratar todas las plantas y partes de plantas. Como plantas se entienden en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas e indeseadas o plantas cultivadas (inclusive plantas cultivadas que se presentan en la naturaleza). Las plantas cultivadas pueden ser plantas, que se pueden obtener por métodos convencionales de cultivación y optimización o por métodos de biotecnología y tecnología genética, o por combinaciones de estos métodos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que son protegibles o no protegibles por derechos de protección de variedades. Como partes de plantas deben entenderse todas las partes situadas por encima de la tierra y por debajo de la tierra, y órganos de las plantas tales como retoños, hojas, flores y raíces, señalándose a modo de ejemplo hojas, agujas, peciolo, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutas, frutas y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de plantas pertenece también un material cosechado, así como un material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento conforme al invento de las plantas y partes de plantas con las sustancias activas se efectúa de manera directa o por acción sobre su entorno, espacio de vida o espacio de almacenamiento, de acuerdo con los métodos usuales de tratamiento, p.ej. por inmersión, proyección, evaporación, nebulización, esparcimiento, extensión y, en el caso de un material de reproducción, en particular en el caso de semillas, además por envoltura con una o múltiples capas.

Las sustancias activas se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos para proyectar, suspensiones, polvos, agentes para espolvorear, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados para suspensión y emulsión, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con sustancias activas, así como encapsulaciones finísimas en sustancias poliméricas.

Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, p.ej. por mezclamiento de las sustancias activas con agentes extendedores, es decir disolventes líquidos y/o materiales de soporte sólidos, eventualmente mediando utilización de agentes con actividad superficial (tensioactivos), por lo tanto agentes emulsionantes y/o agentes dispersantes y/o agentes generadores de espuma.

En el caso del uso de agua como agente extendedor, se pueden utilizar como disolventes auxiliares p.ej. también disolventes orgánicos. Como disolventes líquidos entran en cuestión en lo esencial: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, p.ej. fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil-etil-cetona, metil-isobutil-cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetil-formamida y dimetil-sulfóxido, así como agua.

Como materiales de soporte sólidos entran en cuestión: p.ej. sales de amonio y polvos finos de piedras naturales, tales como caolines, tierras arcillosas, talco, greda, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y polvos finos de piedras sintéticas, tales como ácido silícico muy disperso, óxido de aluminio y silicatos, como materiales de soporte sólidos para granulados entran en cuestión: p.ej. piedras naturales machacadas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos a base de polvos finos inorgánicos y orgánicos, así como granulados a base de un material orgánico tales como aserrín, cáscaras de nuez de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o generadores de espuma entran en cuestión: p.ej. emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como poli(oxietileno)-ésteres de ácidos grasos, poli(oxietileno)-éteres de alcoholes grasos, p.ej. alquilaril-polglicol-éteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos así como materiales hidrolizados de proteínas; como agentes dispersantes entran en cuestión: p.ej. lejías residuales del procedimiento al sulfito para la obtención de lignina, y metil-celulosa.

En las formulaciones se pueden utilizar agentes adhesivos, tales como carboximetil-celulosa, polímeros en forma pulverulenta, granular o de látex, naturales y sintéticos, tales como goma arábiga, un poli(alcohol vinílico), un poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales, tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden utilizar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, p.ej. óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de metal-ftalocianina, y sustancias nutritivas trazas tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

ES 2 296 207 T3

Las formulaciones contienen por lo general entre 0,1 y 95 por ciento en peso de una sustancia activa, de modo preferido entre 0,5 y 90%.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden utilizar como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos y/o con sustancias que mejoran la compatibilidad con las plantas cultivadas (“antídotos”) para la represión de malezas, siendo posibles formulaciones acabadas o mezclas de depósito. Por lo tanto, son posibles también mezclas con agentes para la represión de malezas, que contienen uno o varios herbicidas conocidos y un antídoto.

Para las mezclas entran en cuestión herbicidas conocidos, por ejemplo acetocloro, acifluorfen (-sodio), aclonifen, alacloro, aloxidim (-sodio), ametrina, amicarbazona, amidocloro, amidosulfurón, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurón, beflubutamida, benazolina (-etilo), benfuresato, bensulfurón (-metilo), bentazona, benzofendizona, benzbiciclon, benzofenap, benzoilprop (-etilo), bialafos, bifenox, bispiribac (-sodio), bromobutida, bromofenoxima, bromoxinilo, butacloro, butafenacilo (-alilo), butroxidim, butilato, cafenstrol, caloxidim, carbetamida, carfentrazona (-etilo), clometoxifen, cloramben, cloridazona, clorimurón (-etilo), cloronitrofenol, clorosulfurón, clorotolurón, cinidon (-etilo), cinmetilina, cinosulfurón, clefoxidim, cletodim, clodinafop (-propargilo), clomazona, clomeprop, clopiralida, clopirasulfurón (-metilo), cloransulam (-metilo), cumilurón, cianazina, cibrina, cicloato, ciclosulfamurón, cicloxi-dim, cihalofop (-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, desmedifam, dialato, dicamba, diclorprop (-P), diclofop (-metilo), diclosulam, dietatil (-etilo), difenzoquat, diflufenicán, diflufenzopir, dimefurón, dimepiperato, dimetacloro, dimetametrin, dime-tenamida, dimexiflam, dinitramina, difenamida, diquat, ditiopir, diurón, dimron, epropodan, EPTC, esprocarb, etal-fluralina, etametsulfurón (-metilo), etofumesato, etoxifeno, etoxisulfurón, etobenzanida, fenoxaprop (-P-etilo), fen-trazamida, flamprop (-isopropilo, -isopropilo-L, -metilo), flazasulfurón, florasulam, fluazifop (-P-butilo), fluazolato, flucarbazona (-sodio), flufenacet, flufenpir, flumetsulam, flumiclorac (-pentilo), flumioxazina, flumipropin, flumet-sulam, fluometurón, fluorocloridona, fluoroglicofeno (-etilo), flupoxam, flupropacil, flurpirsulfurón (-metilo, -sodio), flurenol (-butilo), fluridona, fluroxipir (-butoxipropilo, -meptilo), flurprimidol, flurtamona, flutiacet (-metilo), flutiami-da, fomesafen, foramsulfurón, glufosinato (-amonio), glifosato (-isopropilamonio), halosafeno, haloxifop (-etoxietilo, -P-metilo), hexazinona, imazametabenz (-metilo), imazametapir, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazeta-pir, imazosulfurón, yodosulfurón (-metilo, -sodio), ioxinilo, isopropalina, isoproturón, isourón, isoxaben, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, ketoespiradox, lactofeno, lenacilo, linurón, MCPA, mecoprop, mefenacet, mesotriona, meta-mitrón, metazacloro, metabenzotiazurón, metobenzurón, metobromurón, (alfa-) metolacloro, metosulam, metoxurón, metribuzina, metsulfurón (-metilo), molinato, monolinurón, naproanilida, napropamida, neburón, nicosulfurón, nor-flurazona, orbencarb, oryzalina, oxadiargil, oxadiazona, oxasulfurón, oxaziclomefona, oxifluorfenol, paraquat, ácido pelargónico, pendimetalina, pendralina, penoxisulam, pentoxazona, petoxamida, fenmedifam, picolinafeno, piperofos, pretilacloro, primisulfurón (-metilo), profluazol, profoxidim, prometrin, propacloro, propanilo, propaquizafop, propisocloro, propoxicarbazona (-sodio), propizamida, prosulfocarb, prosulfurón, piraflufen (-etilo), pirazolil, pira-zolato, pirazosulfurón (-etilo), pirazoxifeno, piribenzoxima, piributicarb, piridato, piridatol, piriftalida, piriminoba-co (-metilo), piritiobac (-sodio), quinclorac, quinmerac, quinclamina, quizalofop (-P-etilo, -P-tefurilo), rimsulfurón, setoxidim, simazina, simetrin, sulcotriona, sulfentrazona, sulfometurón (-metilo), sulfosato, sulfosulfurón, tebutam, tebutiurón, tepraloxidim, terbutilazina, terbutrin, tenilcloro, tiafluamida, tiazopir, tidiazimina, tífensulfurón (-metilo), tiobencarb, tiocarbazil, tralkoxidim, trialato, triasulfurón, tribenurón (-metilo), triclopir, tridifano, trifluralina, trifloxi-sulfurón, triflusulfurón (-metilo), tritosulfurón.

Para las mezclas entran en cuestión además antídotos conocidos, por ejemplo AD-67, BAS-145138, benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinil, 2,4-D, DKA-24, diclormida, dimrón, fenclorim, fenclorazol (-etilo), flurazol, flu-xofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), MCPA, mecoprop (-P), mefenpir (-dietilo), MG-191, oxabetrinil, PPG-1292, R-29148.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acari-cidas, nematocidas, sustancias protectoras contra el ataque de los pájaros, sustancias nutritivas de las plantas y agentes para mejorar la estructura de los suelos.

Las sustancias activas se pueden utilizar como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de ellas por dilución adicional, tales como soluciones, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados, que están prestas / prestos para el uso. La aplicación se efectúa de un modo usual, p.ej. por vertimiento, proyección, rociadura o esparcimiento.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden aplicar tanto antes como también después del brote de las plantas. Se pueden incorporar en el suelo también antes de la siembra.

La cantidad aplicada de sustancia activa puede fluctuar en un gran intervalo. Ésta depende en lo esencial del tipo del efecto deseado. Por lo general, las cantidades consumidas están situadas entre 1 g y 10 kg de sustancia activa por hectárea de superficie del suelo, preferiblemente entre 5 g y 5 kg por ha.

Tal como ya se ha mencionado anteriormente, se pueden tratar conforme al invento todas las partes y sus partes. En una forma preferida de realización, se tratan especies de plantas y variedades de plantas presentes en estado silvestre o

bien obtenidas por métodos convencionales de cultivación biológica, tales como cruce o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma preferida adicional de realización, se tratan plantas transgénicas y especies de plantas que se habían obtenido por métodos de tecnología genética, eventualmente en combinación con métodos convencionales (organismos modificados genéticamente) y sus partes. El concepto de “partes” o bien “partes de plantas” o “partes de vegetales” se explicó más arriba.

De modo especialmente preferido se tratan plantas conformes al invento de las variedades de plantas que en cada caso son usuales en el comercio o que se encuentran en uso. Como variedades de plantas se entienden las plantas con determinadas propiedades (“rasgos”, en inglés “traits”), que se han obtenido por cultivación convencional, por mutagénesis, o también por técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades, biotipos y genotipos.

Dependiendo de las especies de plantas o bien de las variedades de plantas, de su sitio de estancia y de las condiciones de crecimiento (suelos, climas, períodos de vegetación, nutrición) pueden aparecer mediante el tratamiento conforme al invento también efectos superiores a los aditivos (“sinérgicos”). Así, por ejemplo, son posibles unas cantidades consumidas disminuidas y/o unas ampliaciones del espectro de efectos y/o un refuerzo del efecto de las sustancias y agentes utilizables conformes al invento - también en combinación con otras sustancias activas agroquímicas, un mejor crecimiento de las plantas cultivadas, una tolerancia aumentada de las plantas cultivadas frente a temperaturas altas o bajas, una tolerancia aumentada de las plantas cultivadas frente a la sequedad o frente al contenido de agua o bien de sales del suelo, un rendimiento aumentado de floración, una cosecha facilitada, una aceleración de la maduración, mayores rendimientos de cosechas, una calidad más alta y/o un poder nutritivo más alto de los productos cosechados, una más alta capacidad de almacenamiento y/o elaborabilidad de los productos cosechados, que va más allá de los efectos que propiamente son de esperar.

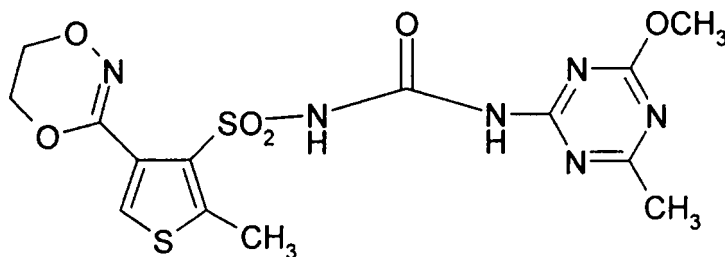
A las preferidas plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas por tecnología genética) que se han de tratar conforme al invento, pertenecen todas las plantas que se habían obtenido mediante la modificación por tecnología genética de un material genético, que confiere a estas plantas unas propiedades (“rasgos”) valiosas especialmente ventajosas. Ejemplos de tales propiedades son un mejor crecimiento de las plantas, una tolerancia aumentada frente a temperaturas altas o bajas, una tolerancia aumentada frente a la sequedad o frente al contenido de agua o de sales del suelo, un rendimiento aumentado de floración, una cosecha facilitada, una aceleración de la maduración, rendimientos más altos de cosechas, una calidad más alta y/o un poder nutritivo más alto de los productos cosechados, una más alta capacidad de almacenamiento y/o elaborabilidad de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y resaltados especialmente de tales propiedades son una defensa aumentada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos, bacterias y/o virus que son patógenos para las plantas, así como una tolerancia aumentada de las plantas frente a determinadas sustancias activas herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan las importantes plantas cultivadas, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza así como plantas frutícolas (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), teniendo que resaltarse especialmente maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades (“rasgos”) se resaltan especialmente la defensa mejorada de las plantas frente a insectos por medio de toxinas que se forman en las plantas, en particular las que son producidas en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus Thuringiensis* (p.ej. por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones) (en lo sucesivo “plantas Bt”). Como propiedades (“rasgos”) se resaltan también especialmente la defensa aumentada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR de Systemische Akquirierte Resistenz), sistemina, fitoalexinas, elicitores así como genes de resistencia, y proteínas y toxinas expresadas de un modo correspondiente. Como propiedades (“rasgos”) se resaltan especialmente además la tolerancia aumentada de las plantas frente a determinadas sustancias activas herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (p.ej. el gen “PAT”). Los genes que confieren en cada caso las deseadas propiedades (“rasgos”) se pueden presentar también en combinaciones entre ellos en las plantas transgénicas. Como ejemplos de “plantas Bt” se han de mencionar variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se venden bajo las denominaciones comerciales YIELD GARD® (p.ej. maíz, algodón, soja), KnockOut® (p.ej. maíz), StarLink® (p.ej. maíz), Bollgard® (algodón), Nucotr® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas se han de mencionar variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden bajo las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente al glifosato p.ej. en maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfotricina, p.ej. en colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, p.ej. en maíz). Como plantas resistentes a herbicidas (cultivadas convencionalmente para obtener tolerancia a herbicidas, se han de mencionar también las variedades (p.ej. de maíz) comercializadas bajo la denominación Clearfield®. Evidentemente, estas informaciones son válidas también para las variedades de plantas que se desarrollen en el futuro o que lleguen al mercado en el futuro con estas propiedades genéticas o propiedades genéticas desarrolladas en el futuro (“rasgos”).

Las plantas reseñadas se pueden tratar de un modo especialmente ventajoso conforme al invento con los compuestos conformes al invento o con las mezclas de sustancias activas conformes al invento, apareciendo, de manera adicional a la buena represión de las plantas de malezas, los efectos sinérgicos antes mencionados con las plantas, o variedades de plantas, transgénicas. Los intervalos preferentes indicados en los casos de las sustancias activas o mezclas son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Se ha de resaltar de un modo especial el tratamiento de las plantas con los compuestos o bien con las mezclas que se exponen especialmente en el presente texto.

La preparación y la utilización de las sustancias activas conformes al invento se deduce de los siguientes ejemplos.

Ejemplos de preparación

Ejemplo 1



A una solución de 0,41 g (1,59 mmol) de 2-fenoxicarbonilamino-4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazina en 40 ml de acetonitrilo se le añaden a la temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) de manera consecutiva 0,50 g (1,91 mmol) de 4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-2-metil-tienil-3-sulfonamida y 0,29 g de DBU (1,91 mmol). Después de haber agitado durante 12 horas a la temperatura ambiente, el disolvente se elimina en el vacío de una trompa de agua, se mezcla con 100 ml de cloruro de metileno, se lava con ácido clorhídrico 2 N y con agua, se seca sobre sulfato de sodio y finalmente el disolvente añadido se elimina en el vacío de una trompa de agua. El residuo se recristaliza a partir de isopropanol, se separa por filtración y se seca.

Se obtienen 0,40 g (59% del rendimiento teórico) de N-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-N'-(4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-2-metil-tien-3-il-sulfonyl)-urea con el punto de fusión de 200°C.

De una manera análoga a la del Ejemplo 1, así como de una manera correspondiente a la descripción general del procedimiento de preparación conforme al invento, se pueden preparar por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) que se reseñan en la siguiente Tabla 1.

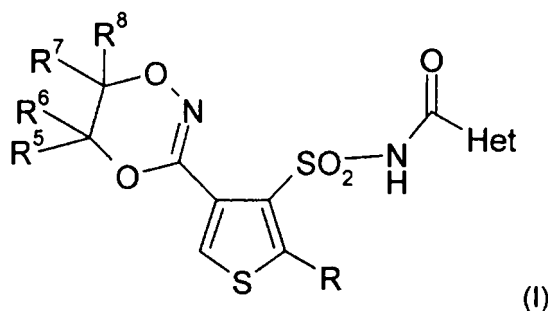
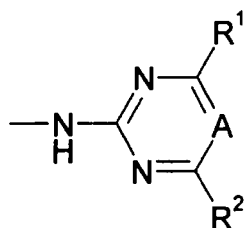


TABLA 1

Ejemplos de los compuestos de la fórmula (I)

Het =



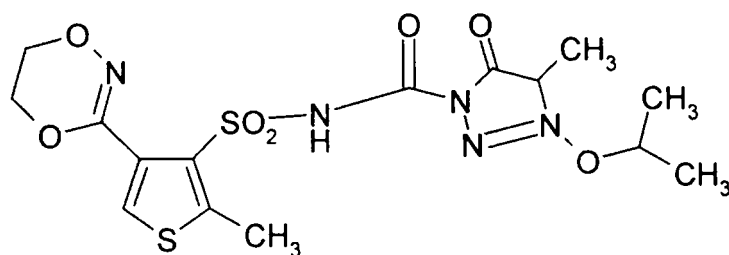
Ej.- Nº	A	R ¹	R ²	R	R ⁵ , R ⁶ , R ⁷ , R ⁸	Punto de fusión (°C)
2	CH	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	211
3	CH	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	97
4	N	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	199

Ejemplo 5

5

10

15



20 A una solución de 0,44 g (1,59 mmol) de 5-isopropiloxi-4-metil-2-fenoxicarbonil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona en 40 ml de acetonitrilo se le añaden a la temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) de manera consecuti-
 va 0,50 g (1,91 mmol) de 4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-2-metil-tienil-3-sulfonamida y 0,29 g de DBU (1,91 mmol). Después de haber agitado durante 12 horas a la temperatura ambiente, el disolvente se elimina en el vacío de una trompa de agua, se mezcla con 100 ml de cloruro de metileno, se lava con ácido clorhídrico 2 N y con agua, se seca sobre sulfato de sodio y finalmente el disolvente añadido se elimina en el vacío de una trompa de agua. El residuo se recristaliza a partir de isopropanol y se separa por filtración y se seca.

25

Se obtienen 0,5 g (71% del rendimiento teórico) de 5-isopropiloxi-4-metil-2-[[4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-2-metil-tien-3-il]-sulfonil-amino-amino-carbonil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona con el punto de fusión de 199°C.

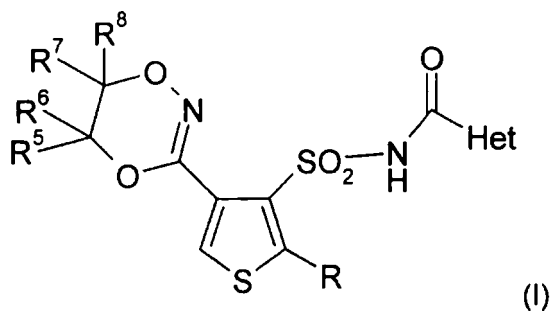
30

De una manera análoga a la del Ejemplo 5 así como de una manera correspondiente a la descripción general del procedimiento de preparación conforme al invento, se pueden preparar por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) que se reseñan en la siguiente Tabla 1 (continuación).

35

40

45



50

55

60

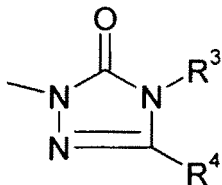
65

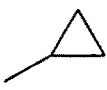
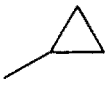
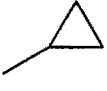
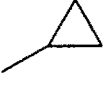
ES 2 296 207 T3

TABLA 1 (continuación)

Ejemplos de los compuestos de la fórmula (I)

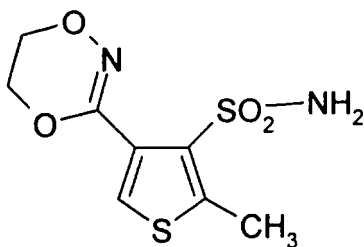
Het =



Ej.- Nº	R ³	R ⁴	R	R ⁵ , R ⁶ , R ⁷ , R ⁸	Punto de fusión (°C)
6	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	157
7	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	185
8	CH ₃	O-(n-propilo)	CH ₃	H	177
9		OCH ₃	CH ₃	H	204
10		OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	202
11		O-(n-propilo)	CH ₃	H	190
12		O-(i-propilo)	CH ₃	H	200

Sustancias de partida de la fórmula (III)

Ejemplo (III-1)



27,8 g (0,4 mol) de hidrocloreto de hidroxilamina se suspenden en 400 ml de metanol y se mezclan a la temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) con una solución de 44,8 g (0,8 mol) de hidróxido de potasio en 400 ml de metanol. A la temperatura ambiente se añaden a esto en porciones 47 g (0,7 mol) del éster metílico de ácido 2-metil-3-sulfamoyl-tienil-4-carboxílico y se agita a 40°C durante 12 horas. Después de haber enfriado a la temperatura ambiente, se añaden 27,6 g (0,2 mol) de carbonato de potasio y se añaden gota a gota 185,8 g (0,92 mol) de 1,2-dibromo-etano. Luego se agita a 60°C durante 12 horas adicionales. Después de haber enfriado a la temperatura ambiente, el disolvente se elimina en el vacío de una trompa de agua y el residuo remanente se digiere con 400 ml de cloruro de metileno y con 200 ml de una solución al 25% de dihidrógeno-fosfato de sodio. El precipitado resultante se separa por filtración y se seca.

ES 2 296 207 T3

Se obtienen 11,8 g (23% del rendimiento teórico) de 4-(5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-il)-prop-metil-tienil-3-sulfonamida con el punto de fusión de 48°C.

Ejemplos de realización

5

Ejemplo A

Ensayo después del brote

10 Semillas de plantas de malezas o respectivamente cultivadas mono- o bien di-cotiledóneas se colocan en macetas de fibras de madera dentro de un suelo de légamo arenoso, se cubren con tierra y se cultivan en un invernadero en buenas condiciones de crecimiento. A las 2 hasta 3 semanas después de la siembra, las plantas experimentales se tratan en el estadio de una sola hoja. Los compuestos de ensayo, formulados en forma de polvos humectables (WP), se rocían sobre las partes verdes de las plantas en diferentes dosificaciones con una cantidad consumida de agua que, convertida por cálculo, es de 800 l/ha, mediando adición de 0,2% de un agente humectante. Después de un período de tiempo de 3 semanas de permanencia de las plantas experimentales en el invernadero en condiciones óptimas de crecimiento, se valora visualmente el efecto de las formulaciones en comparación con el del testigo sin tratar (efecto herbicida en tanto por ciento (%): 100% de efecto = las plantas han muerto, 0% de efecto = como las plantas testigo).

20 En este ensayo, por ejemplo los compuestos de acuerdo con los Ejemplos de preparación 1, 3, 6,7 y 9 muestran un efecto muy bueno contra malezas.

25

(Tabla pasa a página siguiente)

30

35

40

45

50

55

60

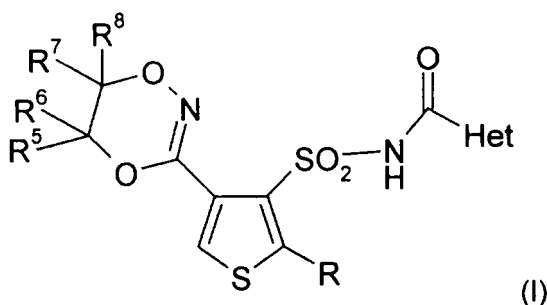
65

Tabla A1: Ensayo después del brote / invernadero

Sustancia activa según el Ejemplo de preparación N°	Cantidad consumida (g de i.a./ha)	Amaranthus	Lolium	Setaria	Sinapis	Stellaria	Cyperus	Echinochloa
(1)	80	90	90	90	90	90	100	90
(3)	80	90	90	80	90	90	100	90
(6)	80	90	90	80	80	90	80	80
(7)	80	90	90	90	80	90	90	90
(9)	80	100	90	90	80	90	70	90

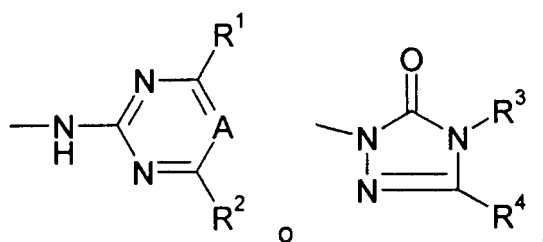
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula general (I)



20 en la que

Het representa



35 A representa nitrógeno o una agrupación CH,

R representa hidrógeno, ciano, nitro, halógeno, representa alquilo, alcoxi, alcocarbonilo, alquiltio, alquil-sulfino o alquilsulfonilo en cada caso con 1 a 6 átomos de carbono en el grupo alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o representa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi o alquiniloxi en cada caso con 2 a 6 átomos de carbono en el grupo alquenilo o alquinilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano o halógeno,

40

R¹ representa hidrógeno, representa halógeno, representa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o representa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahydrofuriloxi en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄,

45

R² representa hidrógeno, representa halógeno, representa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o representa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahydrofuriloxi, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄,

50

R³ representa hidrógeno, hidroxilo, amino, ciano, representa alquilideno C₂-C₁₀-amino, representa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-carbonilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alquenilo o alquinilo en cada caso con 2 a 6 átomos de carbono, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, y/o bromo, representa alcoxi, alquilamino o alquil-carbonilamino en cada caso con 1 a 6 átomos de carbono en el grupo alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, alcoxi C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alqueniloxi con 3 a 6 átomos de carbono, representa dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, representa cicloalquilo, cicloalquilamino o cicloalquilalquilo en cada caso con 3 a 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano y/o alquilo C₁-C₄, o representa arilo o arilalquilo en caso con 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo y/o alcoxi C₁-C₄,

55

60

R⁴ representa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, amino, ciano, fluoro, cloro, bromo, yodo, representa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-carbonilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alquenilo o alquinilo en cada caso con 2 a 6 átomos de

65

- carbono, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, representa alcoxi, alquiltio, alquilamino o alquilcarbonilamino en cada caso con 1 a 6 átomos de carbono en el grupo alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, alcoxi C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, representa alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquintiltio, alquenilamino, o alquinilamino en cada caso con 3 a 6 átomos de carbono en el grupo alqueno o alquino, representa dialquilamino en cada caso con 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, representa cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino en cada caso con 3 a 6 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo o cicloalqueno y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano y/o alquilo C₁-C₄, o representa arilo, arilalquilo, ariloxi, arilalcoxi, ariltio, arilalquiltio, arilamino o arilalquilamino en cada caso con 6 o 10 átomos de carbono en el grupo arilo y eventualmente con 1 a 4 átomos de carbono en la parte de alquilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo, alcoxi C₁-C₄ y/o alcoxi C₁-C₄-carbonilo, y
- R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ independientemente unos de otros, representan hidrógeno, halógeno, ciano o tiocianato, o representan alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfino, alquilsulfonilo, alquilamino, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o alquilaminocarbonilo en cada caso con 1 a 3 átomos de carbono en la parte de alquilo, eventualmente sustituido con halógeno,
- así como sales de compuestos de la fórmula (I).

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados** porque

- R representa hidrógeno, ciano, fluoro, cloro, bromo, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n- i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfino, etilsulfino, metilsulfonilo o etilsulfonilo, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi, o representa propenilo, butenilo, propinilo, propinilo, propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi, eventualmente sustituido en cada caso con ciano, fluoro, o cloro,
- R¹ representa fluoro, cloro, bromo, yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi,
- R² representa fluoro, cloro, bromo, yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi,
- R³ representa hidrógeno, hidroxilo, amino, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi o etoxi, representa etenilo, propenilo, butenilo, propinilo o butinilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, representa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi o etoxi, representa propeniloxi o buteniloxi, representa dimetilamino o dietilamino, representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopropilamino, ciclohexilo, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopropilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopropilmetilo o ciclohexilmetilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, metilo y/o etilo, o representa fenilo o bencilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, metilo, trifluorometilo y/o metoxi,
- R⁴ representa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, amino, ciano, fluoro, cloro, bromo, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, representa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo o butinilo, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, representa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, acetilamino o propionilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, ciano, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, representa propeniloxi, buteniloxi, etiniloxi, propiniloxi, butiniloxi, propeniltio, buteniltio, propiniltio, butiniltio, propenilamino, butenilamino, propinilamino o butinilamino, representa dimetilamino, dietilamino o dipropilamino, representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopropilamino, ciclohexilo, ciclopropilamino, ciclohexilamino, ciclopropilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopropilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopropilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopropilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopropilmetilamino o ciclohexilmetilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, metilo y/o etilo, o representa fenilo, bencilo, fenoxi, benciloxi, feniltio, benciltio, fenilamino o bencilamino, en cada caso eventualmente sustituido con fluoro, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, metoxi o metoxicarbonilo, y

ES 2 296 207 T3

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ representan de modo preferido independientemente unos de otros, hidrógeno o metilo,

así como las sales de sodio, potasio, magnesio, calcio, amonio, alquil C₁-C₄-amonio, di-(alquil C₁-C₄)-amonio, tri-(alquil C₁-C₄)-amonio, tetra-(alquil C₁-C₄)-amonio, tri-(alquil C₁-C₄)-sulfonio, cicloalquil C₅ o C₆-amonio y di-(alquil C₁-C₂)-bencil-amonio de estos compuestos.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados** porque

R representa fluoro, cloro, bromo, representa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, en cada caso eventualmente sustituido con ciano, fluoro, cloro, metoxi o etoxi,

R¹ representa fluoro, cloro, bromo o yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi eventualmente sustituido con fluoro, cloro, o representa dimetilamino

R² representa fluoro, cloro, bromo o yodo, o representa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, eventualmente sustituido con fluoro, cloro, o representa dimetilamino,

R³ representa metilo, etilo, n- o i-propilo o ciclopropilo,

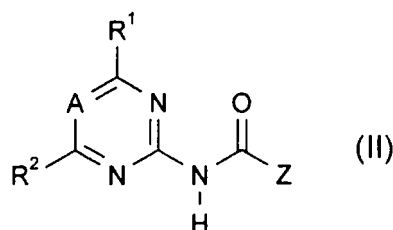
R⁴ representa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, y

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ representan hidrógeno,

así como las sales de sodio, potasio, magnesio, calcio, amonio, alquil C₁-C₄-amonio, di-(alquil C₁-C₄)-amonio, tri-(alquil C₁-C₄)-amonio, tetra-(alquil C₁-C₄)-amonio, tri-(alquil C₁-C₄)-sulfonio, cicloalquil C₅ o C₆-amonio o di-(alquil C₁-C₂)-bencil-amonio de compuestos de la fórmula (I).

4. Procedimiento para la preparación de compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado** porque

(a) se hacen reaccionar aminoazinas sustituidas de la fórmula general (II)

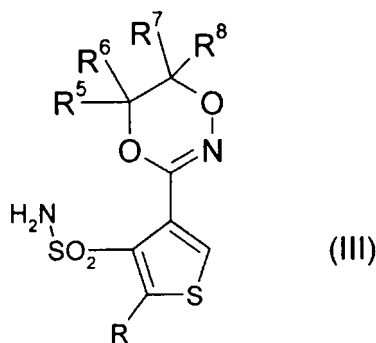


en la que

A, R¹ y R² tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y

Z representa halógeno, alcoxi o ariloxi,

con derivados de tiofeno de la fórmula general (III)

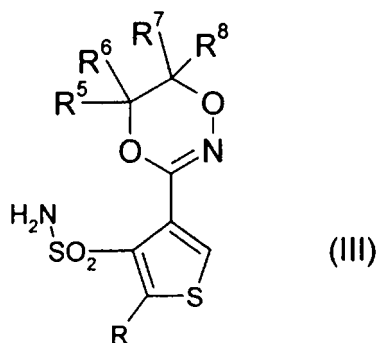


en la que

R y R⁵ hasta R⁸ tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

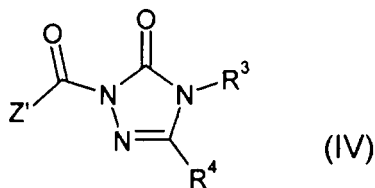
eventualmente en presencia de un agente coadyuvante de reacción y eventualmente en presencia de un agente diluyente, o

(b) se hacen reaccionar tiofeno-3-sulfonamidas sustituidas de la fórmula general (III)



en la que R y R⁵ hasta R⁸ tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

con triazolinonas sustituidas de la fórmula general (IV)



en la que

R³ y R⁴ tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y

Z' representa halógeno, alcoxi, ariloxi o arilalcoxi,

eventualmente en presencia de un agente coadyuvante de reacción y eventualmente en presencia de un agente diluyente,

y eventualmente los compuestos de la fórmula (I) obtenidos de acuerdo con el procedimiento (a) o (b) se transforman en sales de acuerdo con métodos usuales.

5. Procedimiento para la represión de una vegetación de plantas indeseadas, **caracterizado** porque por lo menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 se hace actuar sobre plantas indeseadas, partes de estas plantas y/o su espacio de vida.

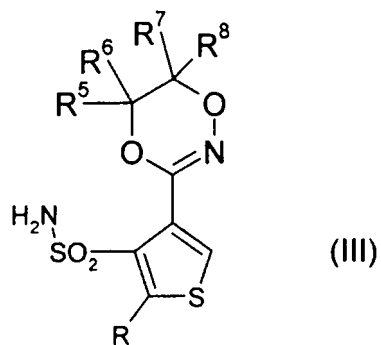
6. Utilización de por lo menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 para la represión de plantas indeseadas.

7. Agente herbicida, **caracterizado** por un cierto contenido de uno o varios compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 y de usuales agentes extendedores y/o agentes activos superficialmente.

8. Agente herbicida, **caracterizado** por un cierto contenido de uno o varios compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 y de una o varias otras sustancias activas agroquímicas.

9. Compuestos de la fórmula (III)

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65



en la que

R y R⁵ hasta R⁸ tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

10. Utilización de compuestos de la fórmula (III) para la preparación de compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3.