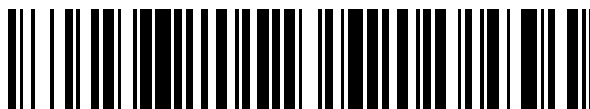


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 523 672**

51 Int. Cl.:

C07D 239/48 (2006.01)

C07D 239/50 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.12.2009** **E 09796977 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **27.08.2014** **EP 2384321**

54 Título: **Derivados de pirimidina y su uso para combatir el crecimiento vegetal indeseado**

30 Prioridad:

30.12.2008 EP 08022523

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

28.11.2014

73 Titular/es:

BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim , DE

72 Inventor/es:

MINN, KLEMENS;
DIETRICH, HANSJÖRG;
DITTGEN, JAN;
FEUCHT, DIETER;
HÄUSER-HAHN, ISOLDE y
ROSINGER, CHRISTOPHER, HUGH

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 523 672 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

Derivados de pirimidina y su uso para combatir el crecimiento vegetal indeseado

La invención se refiere al campo técnico de los agentes fitoprotectores, en particular al de los herbicidas para combatir selectivamente malezas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles.

- 5 En especial, se refiere a 4-aminopirimidinas ópticamente activas, a procedimientos para su preparación así como a su uso para combatir plantas perjudiciales.

Por el estado de la técnica son conocidas pirimidinas que presentan un efecto herbicida. De este modo, por ejemplo, el documento EP 0 523 533 A1 describe determinadas 4-aminopirimidinas sustituidas y su aplicación en el ámbito de la fitoprotección.

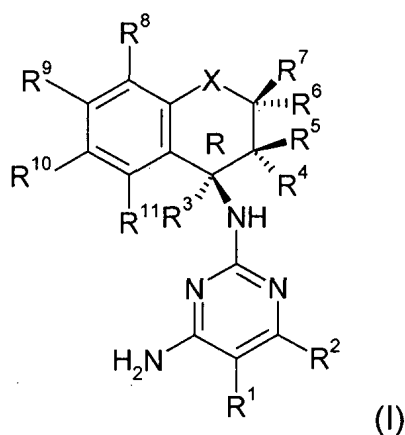
- 10 La aplicación de los derivados de este tipo como herbicidas selectivos para combatir plantas perjudiciales o como reguladores del crecimiento vegetal en distintos cultivos de plantas útiles requiere, sin embargo, con frecuencia una dosis de aplicación inoportuna o conduce a daños indeseados de las plantas útiles. Además, la aplicación de los principios activos en muchos casos no es rentable debido a costes de producción relativamente elevados.

- 15 Por lo tanto, es deseable facilitar principios activos químicos alternativos a base de derivados de pirimidina que se puedan emplear como herbicidas o reguladores del crecimiento vegetal y con los que estén asociadas determinadas ventajas en comparación con sistemas conocidos por el estado de la técnica.

- 20 Por tanto, en general resulta como objetivo de la presente invención facilitar derivados de pirimidina alternativos que se puedan emplear como herbicidas o reguladores del crecimiento vegetal, en particular con un efecto herbicida satisfactorio frente a plantas perjudiciales, con un amplio espectro frente a plantas perjudiciales y/o con una elevada selectividad en cultivos de plantas útiles. A este respecto, estos derivados de pirimidina preferentemente deberían mostrar un mejor perfil de propiedades, en particular un mejor efecto herbicida frente a plantas perjudiciales, un espectro más amplio frente a plantas perjudiciales y/o una mayor selectividad en cultivos de plantas útiles que los derivados de pirimidina conocidos por el estado de la técnica.

- 25 Ahora, de acuerdo con la invención se han hallado nuevas pirimidinas que se pueden emplear ventajosamente como herbicidas y reguladores del crecimiento vegetal. Los compuestos de esta serie se caracterizan, además de por un buen perfil de eficacia y compatibilidad con plantas de cultivo, por procedimientos de preparación y posibilidades de obtención económicos, ya que las sustancias de acuerdo con la invención se pueden preparar a partir de precursores económicos y fácilmente accesibles y, por tanto, se puede prescindir del uso de productos intermedios caros y difícilmente accesibles.

- 30 Por tanto, el objeto de la presente invención son compuestos de fórmula (I) y sus sales agroquímicamente compatibles



en la que

R¹ está seleccionado del grupo compuesto por

- 35 - halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, C(O)OH, C(O)NH₂;
- alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, alquil-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₄);
- alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi-

(C₁-C₆)-carbonil-haloalquilo (C₁-C₆);

- alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquenal-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquenal-(C₂-C₆)-carbonilo, alqueniloxi (C₂-C₆), haloalquenaloxi (C₂-C₆), alqueniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquenaloxi-(C₂-C₆)-carbonilo;
- 5 - alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), alquinal-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquinal-(C₂-C₆)-carbonilo, alquiniloxi (C₂-C₆), haloalquiniloxi (C₂-C₆), alquiniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquiniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo;
- tri-alquil-(C₁-C₆)-silil-alquinilo (C₂-C₆), di-alquil-(C₁-C₆)-silil-alquinilo (C₂-C₆), mono-alquil-(C₁-C₆)-silil-alquinilo (C₂-C₆); fenilsilil-alquinilo (C₂-C₆);
- arilo (C₆-C₁₄), ariloxi (C₆-C₁₄), aril-(C₆-C₁₄)-carbonilo y aril-(C₆-C₁₄)-oxicarbonilo, que pueden estar sustituidos, respectivamente, en la parte arilo con halógeno, alquilo (C₁-C₆) y/o haloalquilo (C₁-C₆);
- 10 - aril-(C₆-C₁₄)-alquilo (C₁-C₆), aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi (C₁-C₆), aril-(C₆-C₁₄)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, aril-(C₆-C₁₄)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;
- mono-(alquil-(C₁-C₆))-amino, mono-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino, di-(alquil-(C₁-C₆))-amino, di-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino, (alquil-(C₁-C₆))-haloalquil-(C₁-C₆))-amino, *N*-(alcanoil-(C₁-C₆))-amino, *N*-(haloalcanoil-(C₁-C₆))-amino, aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆), di-alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆);
- 15 - mono-(alquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, mono-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, di-(alquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, di-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, (alquil-(C₁-C₆))-haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, *N*-(alcanoil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, *N*-(haloalcanoil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, mono-(aril-(C₆-C₁₄))-amino-carbonilo, di-(aril-(C₆-C₁₄))-amino-carbonilo,
- alcoxi-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alcoxi (C₁-C₆);
- 20 - cicloalquilo (C₃-C₈) que puede estar sustituido eventualmente en el resto cicloalquilo con alquilo (C₁-C₆) y/o halógeno; cicloalcoxi (C₃-C₈), cicloalquil-(C₃-C₈)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalcoxi-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalcoxi-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;
- cicloalquenilo (C₃-C₈), cicloalqueniloxi-(C₃-C₈), cicloalquenal-(C₃-C₈)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquenal-(C₃-C₈)-haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquenal-(C₃-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), cicloalquenal-(C₃-C₈)-haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquenal-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquenaloxi-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquenaloxi-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquenal-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenal-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenal-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenal-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;
- hidroxil-alquilo (C₁-C₆), hidroxil-alcoxi (C₁-C₆), ciano-alcoxi (C₁-C₆), ciano-alquilo (C₁-C₆);
- 35 - alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, alquiltio (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquiltio (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfinilo, alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfinil-alquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), haloalquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfinil-alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfinil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquiltio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfinil-haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfoniloxi, haloalquil-(C₁-C₆)-sulfoniloxi, alquiltio-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquiltio-(C₁-C₆)-carbonilo, alquiltio-(C₁-C₆)-carboniloxi, haloalquiltio-(C₁-C₆)-carboniloxi, alquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, alquiltio-(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi; aril-(C₆-C₁₄)-sulfonilo, ariltio (C₆-C₁₄), aril-(C₆-C₁₄)-sulfinilo, cicloalquiltio (C₃-C₈), alquiltio (C₃-C₈), cicloalquiltio (C₃-C₈), alquiltio (C₃-C₆);
- 45 - los restos R¹ y R² forman juntos un grupo alquileo (C₂-C₆) que puede contener uno o varios átomos de oxígeno y/o azufre, pudiendo estar el grupo alquileo (C₂-C₆) mono- o polisustituido con halógeno y pudiendo ser los respectivos sustituyentes halógeno iguales o distintos; y

R² está seleccionado del grupo compuesto por

- hidrógeno, halógeno, hidroxil, ciano, nitro, amino, C(O)OH, C(O)NH₂;
- 50 - alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, alquil-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₄);
- alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-

- alquilo (C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-haloalquilo (C₁-C₆);

5 - alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquenoil-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquenoil-(C₂-C₆)-carbonilo, alquenoiloxi (C₂-C₆), haloalquenoiloxi (C₂-C₆), alquenoiloxi-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquenoiloxi-(C₂-C₆)-carbonilo;

10 - alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), alquinoil-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquinoil-(C₂-C₆)-carbonilo, alquinoiloxi (C₂-C₆), haloalquinoiloxi (C₂-C₆), alquinoiloxi-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquinoiloxi-(C₂-C₆)-carbonilo;

15 - tri-alquil-(C₁-C₆)-silil-alquino (C₂-C₆), di-alquil-(C₁-C₆)-silil-alquino (C₂-C₆), mono-alquil-(C₁-C₆)-silil-alquino (C₂-C₆); fenilsilil-alquino (C₂-C₆);

20 - arilo (C₆-C₁₄), ariloxi (C₆-C₁₄), aril-(C₆-C₁₄)-carbonilo y ariloxi-(C₆-C₁₄)-carbonilo, que pueden estar sustituidos respectivamente en la parte arilo con halógeno, alquilo (C₁-C₆) y/o haloalquilo (C₁-C₆);

25 - aril-(C₆-C₁₄)-alquilo (C₁-C₆), aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi (C₁-C₆), aril-(C₆-C₁₄)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, aril-(C₆-C₁₄)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;

30 - mono-(alquil-(C₁-C₆))-amino, mono-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino, di-(alquil-(C₁-C₆))-amino, di-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino, (alquil-(C₁-C₆))-haloalquil-(C₁-C₆))-amino, N-(alcanoil-(C₁-C₆))-amino, N-(haloalcanoil-(C₁-C₆))-amino, aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆), di-alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆);

35 - mono-(alquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, mono-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, di-(alquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, di-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, (alquil-(C₁-C₆))-haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, N-(alcanoil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, N-(haloalcanoil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, mono-(aril-(C₆-C₁₄))-amino-carbonilo, di-(aril-(C₆-C₁₄))-amino-carbonilo,

40 - alcoxi-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alcoxi (C₁-C₆);

45 - cicloalquilo (C₃-C₈) que puede estar sustituido eventualmente en el resto cicloalquilo con alquilo (C₁-C₆) y/o halógeno; cicloalcoxi (C₃-C₈), cicloalquil-(C₃-C₈)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalcoxi-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalcoxi-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;

50 - cicloalqueno (C₃-C₈), cicloalquenoiloxi (C₃-C₈), cicloalquenoil-(C₃-C₈)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquenoil-(C₃-C₈)-haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquenoil-(C₃-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), cicloalquenoil-(C₃-C₈)-haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquenoil-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-oxicarbonilo, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquenoiloxi-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenoil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;

55 - hidroxi-alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alcoxi (C₁-C₆), ciano-alcoxi (C₁-C₆), ciano-alquilo (C₁-C₆);

60 - alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, alquiltio (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfino, haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquiltio (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfino, alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), haloalquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquiltio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆

alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), arilo (C₆-C₁₄), ariloxi (C₆-C₁₄), aril-(C₆-C₁₄)-carbonilo y ariloxi-(C₆-C₁₄)-carbonilo; o los restos R⁶ y R⁷ forman juntos un grupo alquileo (C₂-C₇), que puede contener uno o varios átomos de oxígeno y/o azufre, pudiendo estar el grupo alquileo (C₂-C₇) mono- o polisustituido con halógeno y pudiendo ser los respectivos sustituyentes halógeno iguales o distintos,

- 5 R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹, independientemente entre sí, están seleccionados respectivamente del grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, alquiloxi-(C₁-C₆)-carbonilo, alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonilo, di-alquil-(C₁-C₆)-aminocarbonilo, haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquilino (C₂-C₆), haloalquilino (C₂-C₆), alquilinil-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquilinil-(C₂-C₆)-carbonilo, alquilinilo (C₂-C₆), haloalquilinilo (C₂-C₆), alquilinilo (C₂-C₆)-carbonilo y haloalquilinilo (C₂-C₆)-carbonilo y nitro;

- 10 X representa un enlace, CH₂ u O;

R¹² y R¹³ respectivamente, de forma independiente entre sí, están seleccionados del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆); y

R¹⁴ está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆).

- 15 De acuerdo con la invención se ha comprobado que estos compuestos presentan un buen perfil de eficacia y compatibilidad con plantas de cultivo.

Los compuestos de acuerdo con la invención se diferencian de los compuestos de acuerdo con el documento EP 0 523 533 A1 en el sentido de que no se trata de 4-aminopirimidinas sustituidas, sino de 2-aminopirimidin-4-aminas sustituidas bicíclicamente.

- 20 A continuación se describen ahora, en primer lugar, significados preferentes, particularmente preferentes y muy particularmente preferentes para los sustituyentes individuales.

Una primera forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

- 25 R¹ está seleccionado, preferentemente, del grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, C(=O)NH₂, NO₂, alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquilo (C₁-C₆), ciclopropilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₆), tioalquilo (C₁-C₆), alquilio (C₁-C₆), alquilino (C₂-C₆), mono-alquil-(C₁-C₆)-amino, di-alquil-(C₁-C₆)-amino y tri-alquil-(C₁-C₆)-silil-(C₂-C₆)-alquilino;

R¹ está seleccionado, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, nitro, trimetilsililetinilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, *tert*-butilo, *n*-pentilo, *n*-heptilo, ciclopropilo, ciclobutilo, acetilo, etinilo, amino, dimetilamino, trifluorometilo, difluorometilo, monofluorometilo, metoxi, etoxi y metoximetilo; y

- 30 R¹ es, de forma muy particularmente preferente, ciano, acetilo y trifluorometilo.

Una segunda forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

- 35 R² se selecciona, preferentemente, del grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, alquil-(C₁-C₆)-fenilo, arilo (C₆-C₁₄), que puede estar sustituido en el resto arilo con alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₆-C₁₄) y/o halógeno; aril-C₆-haloalquilo (C₁-C₆), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆) que puede estar sustituido en el resto cicloalquilo con alquilo (C₁-C₆), haloarilo (C₆-C₁₄) y/o halógeno; 1-alquil-(C₁-C₆)-ciclopropilo, 1-(alquil-(C₁-C₆)-aril-C₆)-ciclopropilo, 1-(monohalofenil)-ciclopropilo, 1-(dihalofenil)-ciclopropilo, mono-alquil-(C₁-C₆)-amino, di-alquil-(C₁-C₆)-amino, tioalquilo (C₁-C₆), alquilio (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) y amino;

- 40 R² se selecciona, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por hidrógeno, cloro, fenilo, 2-metilfenilo, 3-trifluorometilfenilo, metilo, etilo, isopropilo, butilo, *tert*-butilo, *n*-pentilo, *n*-heptilo, trifluorometilo, 1-metilciclopropilo, 1-(*p*-xilil)-ciclopropilo, 1-(2,4-diclorofenil)-ciclopropilo, amino, dimetilamino, trifluorometilo, difluorometilo, monofluorometilo, CHFCH₃, CF(CH₃)₂, CHF(CH₂CH₃), 1-fluorociclopropilo, ciclopentilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, etoximetilo, tiometilo, metilitio y metoxi; y

- 45 R² es, de forma muy particularmente preferente, hidrógeno, metilo o difluorometilo. Una tercera forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

R¹ y R² forman preferentemente, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por uno o dos heteroátomos seleccionados del grupo compuesto por oxígeno y azufre;

- 50 forman de forma particularmente preferente junto con los átomos de carbono a los que están unidos un anillo de cinco miembros que puede estar interrumpido por un heteroátomo seleccionado del grupo compuesto por oxígeno y azufre; y

son, de forma muy particularmente preferente, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2-$ o $-\text{CH}_2\text{-S-CH}_2-$.

Una cuarta forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

R^3 es preferentemente hidrógeno o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$); y

R^3 es de forma particularmente preferente hidrógeno.

5 Una quinta forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

R^4 y R^5 respectivamente, de forma independiente entre sí, se seleccionan preferentemente del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), hidroxilo, ciclopropilo y alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$);

R^4 y R^5 respectivamente, de forma independiente entre sí, se seleccionan de forma particularmente preferente del grupo compuesto por hidrógeno, metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, hidroxilo y metoxi; y

10 R^4 y R^5 respectivamente, de forma independiente entre sí, son de forma muy particularmente preferente metilo, etilo o hidrógeno.

En esta quinta forma de realización se prefiere en especial que al menos uno de los restos R^4 o R^5 sea hidrógeno. Además se prefiere que al menos uno de los restos R^4 o R^5 sea hidrógeno y el otro resto R^4 o R^5 no sea hidrógeno, en particular alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$).

15 En esta quinta forma de realización se prefiere muy especialmente que uno de los restos R^4 o R^5 sea hidrógeno y el otro resto de R^4 o R^5 sea metilo. Una sexta forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

20 R^4 y R^5 , forman preferentemente juntos un grupo alquileo ($\text{C}_2\text{-C}_7$) que puede contener uno o varios átomos de oxígeno y/o azufre, pudiendo estar el grupo alquileo ($\text{C}_2\text{-C}_7$) mono- o polisustituido con halógeno y pudiendo ser los respectivos sustituyentes halógeno iguales o distintos; y

R^4 y R^5 forman, de forma particularmente preferente, junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de tres o cuatro miembros; y

son de forma particularmente preferente $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2-$ o $-\text{CH}_2\text{-CH}_2-$.

Una séptima forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

25 R^6 y R^7 , independientemente entre sí, están seleccionados preferentemente del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) y arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{14}$);

R^6 y R^7 , independientemente entre sí, están seleccionados de forma particularmente preferente del grupo compuesto por hidrógeno, metilo y fenilo; y

R^6 y R^7 son, de forma muy particularmente preferente, hidrógeno.

30 Una octava forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

R^8 está seleccionado, preferentemente, del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) o halógeno;

R^8 está seleccionado, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por hidrógeno, metilo o flúor; y

R^8 es, de forma particularmente preferente, hidrógeno.

Una novena forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

35 R^9 está seleccionado, preferentemente, del grupo compuesto por hidrógeno y alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$);

R^9 está seleccionado, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por hidrógeno y metilo; y

R^9 es, de forma particularmente preferente, hidrógeno.

Una décima forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

40 R^{10} está seleccionado, preferentemente, del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$); di-alquil- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-amino, halógeno, alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alquil- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), alcoxi- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquil- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), ciano, alcoxi- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo y aminocarbonilo;

R^{10} está seleccionado, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por hidrógeno, metilo, propilo, isopropilo, butilo, *tert*-butilo, dimetilamino, flúor, cloro, bromo, yodo, etenilo, etinilo, metiletinilo, etiletinilo, $\text{MeOCH}_2\text{C}\equiv\text{C}-$, ciano, COOMe y CONH_2 ; y

R¹⁰ es, de forma muy particularmente preferente, hidrógeno o metilo.

Una undécima forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

R¹¹ está seleccionado, preferentemente, del grupo compuesto por hidrógeno y alquilo (C₁-C₆);

5 R¹¹ está seleccionado, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por hidrógeno y metilo; y

R¹¹ es, de forma muy particularmente preferente, hidrógeno.

Una duodécima forma de realización de la presente invención comprende compuestos de fórmula general (I) en los que

X se selecciona, de forma particularmente preferente, del grupo compuesto por CH₂, O y un enlace químico.

10 En el marco de la presente invención es posible combinar de forma discrecional entre sí los significados individuales preferentes, particularmente preferentes y muy particularmente preferentes para los sustituyentes R¹ a R¹¹ y X. Es decir, que están comprendidos por la presente invención compuestos de fórmula general (I) en los que, por ejemplo, el sustituyente R¹ presenta un significado preferente y los sustituyentes R² a R¹¹ presentan el significado general o el
15 restantes sustituyentes presentan un significado general.

En el marco de la presente invención, por el compuesto de fórmula general (I) están comprendidos también compuestos que están cuaternizados mediante a) protonación, b) alquilación o c) oxidación en un átomo de nitrógeno. A este respecto se han de mencionar en particular los correspondientes *N*-óxidos.

Los compuestos de fórmula (I) pueden formar sales.

20 La formación de sal se puede realizar mediante acción de una base sobre aquellos compuestos de fórmula (I) que llevan un átomo de hidrógeno ácido, por ejemplo, en el caso de que R¹ contenga un grupo COOH o un grupo sulfonamida -NHSO₂-. Son bases adecuadas, por ejemplo, aminas orgánicas, tales como trialkilaminas, morfolina, piperidina o piridina así como hidróxidos, carbonatos e hidrogenocarbonatos de amonio, de metal alcalino o alcalinotérreo, en particular hidróxido de sodio y potasio, carbonato de sodio y potasio e hidrogenocarbonato de
25 sodio y potasio. Estas sales son compuestos en los que el hidrógeno ácido se sustituye por un catión adecuado para la agricultura, por ejemplo, sales de metal, en particular sales de metal alcalino o sales de metal alcalinotérreo, en particular sales de sodio y potasio o también sales de amonio, sales con aminas orgánicas o sales de amonio cuaternario, por ejemplo, con cationes de fórmula [NRR'R'']⁺, en la que R a R''' representan respectivamente de forma independiente entre sí un resto orgánico, en particular alquilo, arilo, aralquilo o alquilarilo. Se consideran
30 también sales de alquilsulfonio y alquilsufoxonio, tales como sales de trialkil-(C₁-C₄)-sulfonio y trialkil-(C₁-C₄)-sulfoxonio.

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

Los sustituyentes adecuados que están presentes en forma desprotonada tales como, por ejemplo, ácidos sulfónicos o ácidos carboxílicos, pueden formar sales internas con grupos a su vez protonables, tales como grupos amino.

40 En lo sucesivo, los compuestos de fórmula (I) y sus sales se denominan de forma abreviada también "compuestos (I)" usados de acuerdo con la invención o de acuerdo con la invención.

En la fórmula general (I) y todas las demás fórmulas en la presente invención, los restos alquilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquilamino, alquiltio, haloalquiltio, así como los correspondientes restos insaturados y/o sustituidos en el esqueleto de carbono pueden ser, respectivamente, de cadena lineal o estar ramificados. A menos que se indique
45 especialmente, en estos restos se prefieren los esqueletos de carbono inferiores, por ejemplo, con 1 a 6 átomos de carbono, en particular 1 a 4 átomos de carbono o en grupos insaturados con 2 a 6 átomos de carbono, en particular 2 a 4 átomos de carbono. Los restos alquilo, también en los significados compuestos tales como alcoxi, haloalquilo, etc., significan, por ejemplo, metilo, etilo, *n*- o *i*-propilo, *n*-, *i*-, *t*- o 2-butilo, pentilos, hexilos, tales como *n*-hexilo, *i*-hexilo y 1,3-dimetilbutilo, heptilos, tales como *n*-heptilo, 1-metilhexilo y 1,4-dimetilpentilo; los restos alqueno y alquino tienen el significado de los posibles restos insaturados correspondientes a los restos alquilo; estando
50 contenido al menos un doble enlace o triple enlace, preferentemente un doble enlace o triple enlace. Alqueno significa, por ejemplo, vinilo, alilo, 1-metilprop-2-en-1-ilo, 2-metil-prop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metil-but-3-en-1-ilo y 1-metil-but-2-en-1-ilo; alquino significa, por ejemplo, etinilo, propargilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo y 1-metil-but-3-in-1-ilo.

Los grupos cicloalquilo son, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Los grupos cicloalquilo pueden estar presentes en forma bi- o tri-cíclica.

Cuando están indicados grupos haloalquilo y restos haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquenilo, haloalquinilo, entre otros, en estos restos los esqueletos de carbono inferiores, por ejemplo, con 1 a 6 átomos de C o 2 a 6, en particular 1 a 4 átomos de C o preferentemente 2 a 4 átomos de C, así como los correspondientes restos insaturados y/o sustituidos en el esqueleto de carbono respectivamente son de cadena lineal o están ramificados. Son ejemplos difluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, trifluoroalilo, 1-cloroprop-1-il-3-ilo.

Son grupos alquileo en estos restos los esqueletos de carbono inferiores, por ejemplo con 1 a 10 átomos de C, en particular con 1 a 6 átomos de C o preferentemente 2 a 4 átomos de C, así como los correspondientes restos insaturados y/o sustituidos en el esqueleto de carbono que pueden ser, respectivamente, de cadena lineal o estar ramificados. Son ejemplos metileno, etileno, *n*- e *i*-propileno y *n*-, *s*-, *i*-, *t*-butileno.

Son grupos hidroxialquilo en estos restos los esqueletos de carbono inferiores, por ejemplo con 1 a 6 átomos de C, en particular con 1 a 4 átomos de C, así como los correspondientes restos insaturados y/o sustituidos en el esqueleto de carbono que pueden ser, respectivamente, de cadena lineal o estar ramificados. Son ejemplos de esto 1,2-dihidroxietilo y 3-hidroxipropilo.

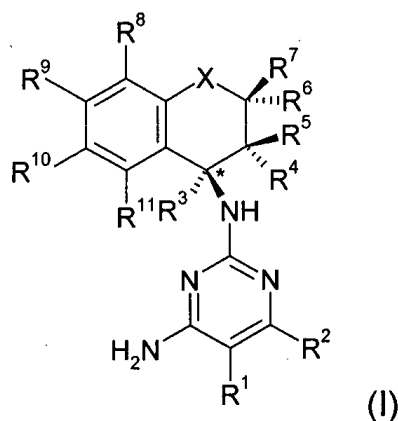
Halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo. Haloalquilo, -alquenilo y -alquinilo significan alquilo, alquenilo o alquinilo completa o parcialmente sustituido con halógeno, preferentemente con flúor, cloro o bromo, en particular por flúor y/o cloro, por ejemplo, monohaloalquilo (= monohalógenoalquilo), perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CF₃CF₂, CH₂FCHCl, CCl₃, CHCl₂, CH₂CH₂Cl; haloalcoxi es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ y OCH₂CH₂Cl; lo correspondiente se aplica a haloalquenilo y otros restos sustituidos con halógeno.

Arilo significa un sistema aromático mono-, bi- o policíclico, por ejemplo, fenilo o naftilo, preferentemente fenilo.

Sobre todo por motivos de la mayor acción herbicida, mejor selectividad y/o mejor producibilidad son de particular interés compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) o sus sales agroquímicas o derivados de N cuaternario en los que restos individuales tienen uno de los significados preferentes ya mencionados o mencionados a continuación o, en particular, aquellos en los que uno o varios de los significados preferentes ya mencionados o mencionados a continuación aparecen de forma combinada.

Las definiciones de restos generales indicadas anteriormente o indicadas en intervalos preferentes se aplican tanto a los productos finales de fórmula general (I) como correspondientemente a los productos de partida y productos intermedios necesarios respectivamente para la preparación. Estas definiciones de restos se pueden intercambiar entre sí al igual que entre los intervalos preferentes indicados.

Los presentes compuestos de fórmula general (I) presentan un átomo de carbono quiral que está aclarado en la estructura representada a continuación por el identificador (*):



De acuerdo con las reglas según Cahn, Ingold y Prelog (reglas de CIP), este átomo de carbono puede presentar una configuración tanto (*R*) como (*S*).

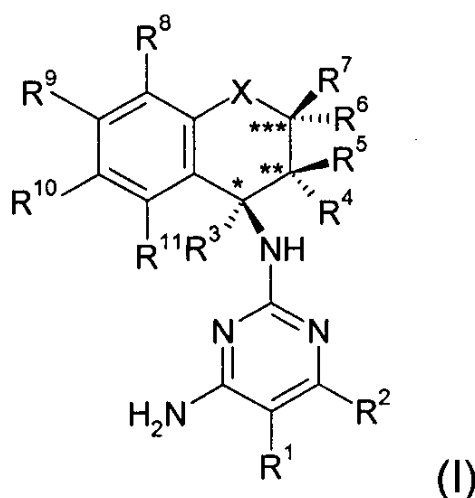
La presente invención se refiere a compuestos de fórmula general (I) en los que la configuración estereoquímica en el átomo de carbono indicado con (*) está presente con una pureza estereoquímica del 60 al 100 % de (*R*), preferentemente del 80 al 100 % de (*R*), en particular del 90 al 100 % de (*R*), de forma muy particular del 95 al 100 % de (*R*).

Teniendo en cuenta la regla según Cahn, Ingold y Prelog, en el átomo de carbono indicado con (*) se puede producir también una situación en la que, a causa de la prioridad de los respectivos sustituyentes, se prefiera la configuración (*S*) en el átomo de carbono indicado con (*). Este es el caso, por ejemplo, cuando los restos R⁴ y/o R⁵ se

corresponden con un resto alcoxi C₁-C₆.

Por tanto, en el marco de la presente invención se prefieren en particular compuestos de fórmula general (I) que se corresponden en su disposición espacial con aquellos compuestos de fórmula general (I) con R⁴ y R⁵ = hidrógeno con configuración (*R*), con una selectividad del 60 al 100 %, preferentemente del 80 al 100 %, en particular del 90 al 100 %, de forma muy particular del 95 al 100 %, estando presente el respectivo compuesto análogo a (*R*) con una enantioselectividad de, respectivamente, más del 50 % de ee, preferentemente del 60 al 100 % de ee, en particular del 80 al 100 % de ee, de forma muy particular del 90 al 100 % de ee, mucho más preferentemente del 95 % al 100 % de ee, en relación con el contenido total del respectivo compuesto análogo a (*R*). Por tanto, la presente invención se refiere en particular a compuestos de fórmula general (I) en los que la configuración estereoquímica está presente en el átomo de carbono indicado con (*) con una pureza estereoquímica del 60 al 100 % (*R* o *R* análogo), preferentemente del 80 al 100 % (*R* o *R* análogo), en particular del 90 al 100 % (*R* o *R* análogo), de forma muy particular del 95 al 100 % (*R* o *R* análogo).

En particular, los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) pueden presentar todavía otros centros de quiralidad en los átomos de carbono indicados con (**) y (***):



En el marco de la presente invención son posibles configuraciones estereoquímicas discrecionales en los átomos de carbono indicados con (*), (**) y (***):

Configuración átomo de carbono (*)	Configuración átomo de carbono (**)	Configuración átomo de carbono (***)
<i>R</i>	<i>R</i>	<i>R</i>
<i>R</i>	<i>R</i>	<i>S</i>
<i>R</i>	<i>S</i>	<i>R</i>
<i>R</i>	<i>S</i>	<i>S</i>

Además, en función de la selección de los respectivos restos pueden estar presentes otros estereoelementos en los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I).

Si están presentes, por ejemplo, uno o varios grupos alqueno, entonces pueden aparecer diastereómeros (isómeros *Z* y *E*).

Si están presentes, por ejemplo, uno o varios átomos de carbono asimétricos, entonces pueden aparecer enantiómeros y diastereómeros.

Se pueden obtener correspondientes estereoisómeros a partir de las mezclas producidas durante la preparación tras procedimientos habituales de separación, por ejemplo, mediante procedimientos de separación cromatográficos. Asimismo se pueden preparar selectivamente estereoisómeros mediante el empleo de reacciones estereoselectivas mediante el uso de sustancias de partida y/o coadyuvantes ópticamente activos. Por lo tanto, la invención se refiere también a todos los estereoisómeros que están comprendidos por la fórmula general (I), que sin embargo no están indicados con su estereoforma específica y sus mezclas.

Las posibilidades de combinación de los distintos sustituyentes de fórmula general (I) se han de entender de tal

manera que se han de observar los fundamentos generales de la estructura de compuestos químicos, es decir, la fórmula (I) no comprende compuestos de los cuales el experto sabe que químicamente no son posibles.

En la siguiente Tabla se mencionan ejemplos de realización específicos de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I):

Tabla

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.1.	H	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.2.	H	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-O-
1.3.	H	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.4.	H	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.5.	H	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-O-
1.6.	H	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.7.	OCH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.8.	H	CF ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.9.	H	C(CH ₃) ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.10.	H	C(CH ₃) ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-O-
1.11.	H	C(CH ₃) ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.12.	H	CH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.13.	H	CH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-O-
1.14.	H	CH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.15.	OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.16.	H	CH ₂ CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.17.	CN	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.18.	CN	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.19.	C(=O)OCH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.20.	C(=O)NH ₂	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.21.	C(=O)NHPh	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.22.	C(=O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.23.	CN	CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.24.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.25.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.26.	CN	CH ₃	H	R	H	H		H	H		F	H	H	H	-O-
1.27.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH(CH ₃) ₂	H	-O-
1.28.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH(CH ₃) ₂	H	-
1.29.	CN	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.30.	CN	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.31.	CN	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.32.	CN	CF ₂ CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.33.	CN	H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.34.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.35.	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.36.	C(=O)OH	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.37.	I	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.38.	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.39.	C≡CSi(CH ₃) ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.40.	H	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.41.	H	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.42.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.43.	CH ₃	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.44.	CH ₃	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.45.	CH ₃	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.46.	I	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.47.	C≡CSi(CH ₃) ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.48.	C=CH	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.49.	C=CPh	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.50.	CH=CHPh	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.51.	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.52.	CH ₃	H	CH ₃	rac	H	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.53.	CH ₃	H	CH ₂ C H ₃	rac	H	H		H		H	H	H	H	H	-
1.54.	CH ₃	H	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.55.	CH ₃	H	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.56.	F	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.57.	F	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.58.	F	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.59.	Cl	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.60.	Cl	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.61.	CN	CH ₂ CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.62.	CN	CH ₂ CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.63.	CN	CH ₂ CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.64.	CN	CH(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.65.	CN	CH(CH ₃) ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.66.	CN	CH(CH ₃) ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.67.	Br	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.68.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.69.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.70.	CN	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.71.	CN	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.72.	CN	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.73.	CN	CF ₂ H	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H		H	H	H	H	-
1.74.	CN	CF ₂ H	H	rac	-CH ₂ CH ₂ -			H		H	H	H	H	H	-
1.75.	H	Cl	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.76.	H	Cl	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.77.	CN	2-(CH ₃)-Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.78.	CN	2-(CH ₃)-Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.79.	CN	2-(CH ₃)-Ph	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.80.	CN	3-(CF ₃)-Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.81.	CN	3-(CF ₃)-Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.82.	CN	3-(CF ₃)-Ph	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.83.	H	Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.84.	CN	1-(CH ₃)- ciclopropilo	H	R	H	H		H	H	H	H	H	H	H	-CH ₂ -
1.85.	CN	1-(4-(CH ₃)Ph)- ciclopropilo	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.86.	CN	1-(2,4-Cl)- ciclopropilo	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.87.	I	H	H	rac	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.88.	H	CH ₂ OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.89.	C(=O)NH ₂	CH ₂ OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.90.	H	OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.91.	H	N(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.92.	H	OCH ₂ C=CH	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.93.	CN	1-(CH ₃)- ciclopropilo	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.94.	CN	1-(2,4-Cl-Ph- ciclopropilo	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.95.	CN	H	H	R	CH ₂ CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.96.	CN	CH ₃	H	R	CH ₂ CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.97.	Br	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.98.	C≡C-Si(CH ₃) ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.99.	CN	2-F-Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.100.	H	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.101.	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.102.	H	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.103.	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.104.	CN	2-F-Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.105.	Cl	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.106.	Cl	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.107.	CF ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	C ₃	H	-
1.108.	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.109.	H	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.110.	Br	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.111.	Br	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.112.	CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.113.	CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.114.	CF ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.115.	CF ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.116.	C=CH	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.117.	C≡C-Si(CH ₃) ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	F	H	-
1.118.	H	C(=O)OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.119.	C=CH	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.120.	NO ₂	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.121.	NO ₂	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.122.	NO ₂	CH ₃	H	S	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.123.	NO ₂	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.124.	NO ₂	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.125.	NO ₂	CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.126.	NO ₂	CH ₃	H	R	CH ₂ CH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.127.	CN	CH ₃	H	rac	H	H	rac	H	H	rac	H	H	H	H	-
1.128.	CN	H	H	rac	H	H	rac	H	H	rac	H	H	H	H	-
1.129.	CN	H	H	R	CH ₂ CH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.130.	CN	CH ₂ CH ₃	H	R	CH ₂ CH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.131.	CN	CH(CH ₃) ₃	H	R	CH ₂ CH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.132.	Cl	ciclopropilo	H	S	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.133.	Cl	4-F-Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.134.	Cl	CF ₃	H	S	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.135.	Cl	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.136.	H	CF ₃	H	S	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.137.	H	4-Cl-Ph	H	S	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.138.	Cl	4-Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.139.	Br	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.140.	H	C(=O)NHCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.141.	CN	H	H	R	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	Cl	H	-
1.142.	CN	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.143.	CN	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-
1.144.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CN	H	-
1.145.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.146.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	OCH ₃	H	-
1.147.	CN	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-
1.148.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-
1.149.	CN	CF ₃	H	R	H	H		H	H		F	H	H	H	-O-
1.150.	CN	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.151.	Cl	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.152.	Cl	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		F	H	CH ₃	H	-O-
1.153.	Cl	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	CH ₃	-O-
1.154.	CH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		F	H	CH ₃	H	-O-
1.155.	CH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.156.	CN	H	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.157.	CN	H	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.158.	CN	CH ₂ CH ₃	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.159.	CN	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		CH ₃	H	Cl	H	-
1.160.	CN	CH ₂ CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.161.	CN	CH(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-
1.162.	Cl	CH ₂ CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-
1.163.	Cl	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-
1.164.	Cl	CH(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	Cl	H	-
1.165.	Cl	CH(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.166.	CH ₃	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.167.	Cl	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.168.	Cl	CClF ₂	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.169.	Cl	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.170.	Cl	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-CH ₂ -
1.171.	Cl	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-CH ₂ -
1.172.	CH ₃	CClF ₂	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-CH ₂ -
1.173.	CH ₃	CClF ₂	H	rac	H	H		H	H		O CH ₃	H	H	H	-CH ₂ -
1.174.	CH ₃	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-O-
1.175.	CN	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-O-
1.176.	Cl	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-O-
1.177.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-O-
1.178.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₂ CH ₃	H	-O-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.179.	CN	CH(CH ₃) ₂	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-O-
1.180.	CN	ciclopropilo	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-O-
1.181.	CN	1-CH ₃ - ciclopropilo	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-O-
1.182.	CN	1-CH ₃ - ciclopropilo	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.183.	CN	1-CH ₃ - ciclopropilo	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.184.	C(=O)-CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.185.	C(=O)-CH ₂ -CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.186.	C(=O)-CH ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.187.	C(=O)-CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.188.	C(=O)-CH ₃	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.189.	C(=O)-CH ₃	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.190.	C=CH	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.191.	C=CH	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.192.	C(=O)-CH ₃	CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.193.	C(=O)-CH ₃	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.194.	H	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.195.	Cl	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.196.	Br	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.197.	I	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.198.	C≡CH	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.199.	C(=O)-CH ₃	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.200.	H	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.201.	CH ₃	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.202.	Cl	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.203.	Br	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.204.	I	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.205.	C≡CCH ₃	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.206.	H	C(=O)NH ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.207.	H	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.208.	H	CN	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.209.	H	CN	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-O-
1.210.	H	CN	H	rac	H	H		H	H		F	H	CH ₃	H	-O-
1.211.	H	CN	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	CH ₃	-O-
1.212.	H	C(=O)OCH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.213.	H	C(=O)OCH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.214.	H	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.215.	H	CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.216.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	Cl	H	H	-
1.217.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	Cl	H	H	-
1.218.	CN	CH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	Cl	H	H	-
1.219.	OCH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.220.	OCH ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.221.	C≡C-(3-OCH ₃)-Ph	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.222.	CC-CH ₂ OH	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.223.	CN	H	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.224.	CN	CH ₃	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.225.	C(=S)NH ₂	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.226.	C(=S)-1- morfolinilo	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.227.	SCH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.228.	S(=O)CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.229.	S(=O) ₂ CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.230.	S(=O) ₂ CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.231.	S(=O)CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.232.	SCH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.233.	C(=O)CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.234.	C=CH	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.235.	C≡C-C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.236.	C≡C-Si(CH ₃) ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.237.	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.238.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.239.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-O-
1.240.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-CH ₂ -
1.241.	CF ₃	H	H	rac	H	H		CH ₃	CH ₃		H	Cl	F	H	-O-
1.242.	C=C-CH(OH)- CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.243.	CF ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	F	H	-
1.244.	CF ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	Cl	H	-
1.245.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	Cl	H	-
1.246.	C≡C-4-(2-CH ₃)- tiazol	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.247.	C=C-(3CF ₃)Ph	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.248.	C≡C-(3Cl, 4F)Ph	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-

(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.249.	C≡C-CH ₂ - CH(CH ₃) ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.250.	C(=O)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.251.	C≡C-CH(OH)- CH ₂ CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.252.	C≡C-CH ₂ -O- C(=O)CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.253.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	OC H ₃	H	H	-CH ₂ -
1.254.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-
1.255.	C(=O)-O- ciclohexilo	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.256.	C≡CCH ₂ OH	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.257.	CF ₃	H	H	S	OH	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.258.	CF ₃	H	H	S	OH	H	R	H	H		H	H	H	H	-
1.259.	CF ₃	H	H	S	OCH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.260.	CF ₃	H	H	S	OCH ₃	H	R	H	H		H	H	H	H	-
1.261.	I	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.262.	CF ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.263.	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

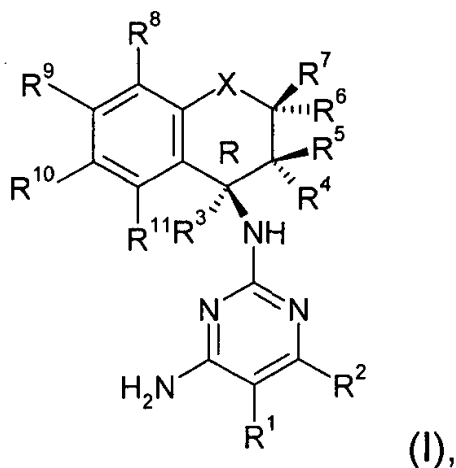
(continuación)

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.264.	CN	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.265.	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.266.	CN	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.267.	CN	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.268.	C(=O)CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.269.	C(=O)CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.270.	C(=O)CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.271.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -

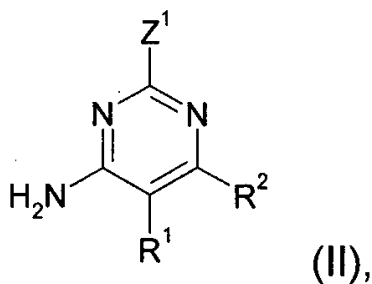
Los compuestos 1.261 a 1.270 están presentes, respectivamente, en forma de sus clorhidratos.

Otro objeto de la presente invención son procedimientos para la preparación de compuestos correspondientes de fórmula general (I) y/o sus sales y/o sus derivados de nitrógeno cuaternizado agroquímicamente compatibles:

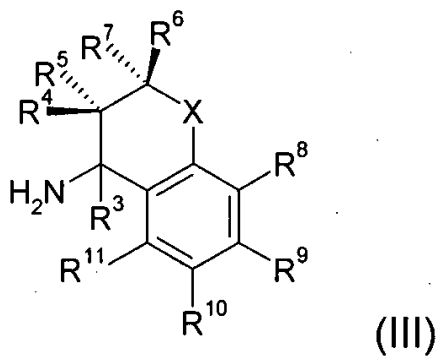
a.) Para la preparación de compuestos de fórmula general (I)



en los que los restos R^1 a R^{11} y X presentan los significados anteriores, se puede hacer reaccionar un compuesto de fórmula general (II)

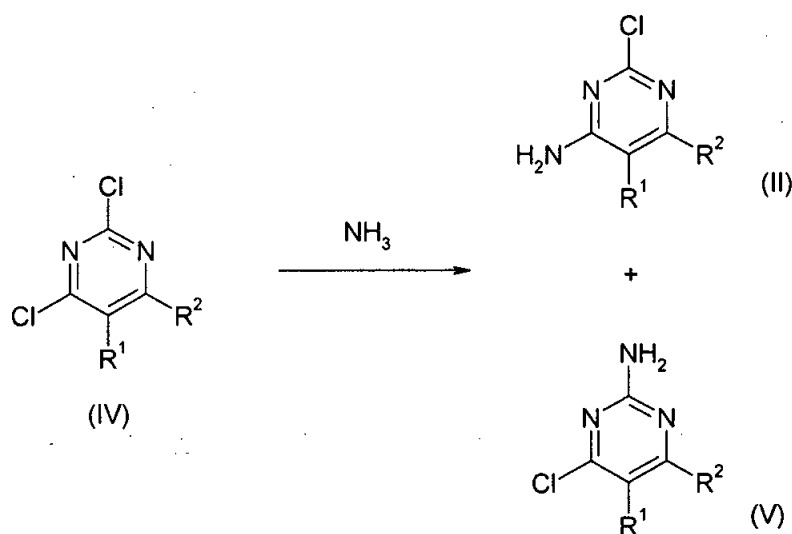


en la que R^1 y R^2 presentan el significado anterior y Z^1 significa un resto sustituible o un grupo saliente tal como, en particular, cloro, triclorometilo, alquil-(C_1 - C_4)-sulfonilo, fenil-alquil-(C_1 - C_4)-sulfonilo no sustituido o sustituido o alquil-(C_1 - C_4)-fenilsulfonilo, con una amina de fórmula general (III) o una sal de adición de la misma



presentando los restos R^3 a R^{11} y X el anterior significado.

Los compuestos de fórmula general (II) se pueden obtener para Z = cloro mediante conversión de compuestos de fórmula general (IV) con amoníaco de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



La mezcla de isómeros de (II) y (V) obtenida a este respecto se puede separar cromatográficamente o usarse como mezcla en la siguiente reacción.

Las aminas de fórmula general (III) o la sal de adición de ácido de las mismas están disponibles en el mercado o su síntesis está descrita en el documento WO2004/069814 A1.

Las pirimidinas de fórmula general (II) están disponibles en el mercado, se pueden preparar derivados especiales según procedimientos conocidos. Por ejemplo, se pueden preparar cianopirimidinas a partir de malonodinitrilo (H. KRISTINSSON, J Chem. Soc., Chem. Commun., 1974, 350) o a partir de cianamida (H. W. SCHMIDT, G. KOITZ, H. JUNEK; J. Heterocycl. Chem., 1987, 24, 1305).

b.) Para la preparación de compuestos de fórmula general (I) se pueden usar compuestos como precursores y transformarse en otros compuestos de acuerdo con la invención.

(1) Por ejemplo, se pueden hacer reaccionar derivados de fórmula (I) con R¹, R² o R¹⁰ = Hal, en particular yodo o bromo con acetilenos o acetileno protegido con trimetilsililo con catálisis de metal de transición, por ejemplo, con cloruro de bis-(trifenilfosfina)-paladio (II) en disolventes próticos o apróticos y adición de base a temperaturas entre 20 y 150 °C para dar compuestos de fórmula (I) con R¹, R² o R¹⁰ = alquínilo.

(2) Por ejemplo, se pueden saponificar derivados de fórmula (I) con R¹ = CN con catálisis de ácido o de base, los ácidos carboxílicos obtenidos de este modo se pueden convertir según procedimientos conocidos en cloruros de ácido y los mismos a su vez en amidas.

(3) Por ejemplo, se pueden hacer reaccionar derivados de fórmula (I) con R² = Hal en disolventes próticos o apróticos y adición de base a temperaturas entre 100 y 200 °C mediante reacción con alcoholatos o aminas para dar compuestos de fórmula (I) con R² = alcóxilalquilo o aminoalquilo o diaminoalquilo.

Se pueden preparar colecciones de compuestos de fórmula (I) y/o sus sales, que se pueden sintetizar según las reacciones que se han mencionado anteriormente, también en paralelo, pudiendo realizarse esto de forma manual, parcialmente automatizada o completamente automatizada. A este respecto, por ejemplo, es posible automatizar la conducción de la reacción, el procesamiento o la purificación de los productos o pasos intermedios. Globalmente, por esto se entiende una forma de proceder como se describe, por ejemplo, por D. Tiebes en Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (editor Günther Jung), Verlag Wiley 1999, en las páginas 1 a 34.

Para la conducción de la reacción y el procesamiento en paralelo se puede usar una serie de aparatos disponibles en el mercado, por ejemplo, bloques de reacción Calypso (Calypso reaction blocks) de la empresa Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EEUU o estaciones de reacción (reaction stations) de la empresa Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, Inglaterra o MultiPROBE Automated Workstations de la empresa Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, EEUU. Para la purificación en paralelo de compuestos de fórmula general (I) y sus sales o de productos intermedios producidos durante la preparación están disponibles, entre otros, aparatos de cromatografía, por ejemplo, de la empresa ISCO, 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EEUU.

Los aparatos indicados conducen a una forma de proceder modular en la que están automatizadas las etapas de trabajo individuales, sin embargo, entre las etapas de trabajo se tienen que llevar a cabo operaciones manuales. Esto se puede evitar mediante el empleo de sistemas de automatización parcial o completamente integrados, en los que los respectivos módulos de automatización son manejados, por ejemplo, por robots. Tales sistemas de automatización se pueden obtener, por ejemplo, en la empresa Caliper, Hopkinton, MA 01748, EEUU.

La realización de etapas de síntesis, individuales o varias, se puede respaldar mediante el empleo de reactivos

soportados por polímero/resinas de captura. En la bibliografía técnica está descrita una serie de protocolos de ensayo, por ejemplo, en ChemFiles, Vol. 4, N° 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

Además de los procedimientos descritos en el presente documento se puede realizar la preparación de compuestos de fórmula general (I) y sus sales completa o parcialmente mediante procedimientos respaldados por fase sólida. Con este fin se unen pasos intermedios individuales o todos los pasos intermedios de la síntesis o de una síntesis adaptada a la correspondiente forma de proceder a una resina de síntesis. Están descritos procedimientos de síntesis respaldados por fase sólida en la bibliografía técnica suficientemente, por ejemplo, Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998 y Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (editor Günther Jung), Verlag Wiley, 1999. El uso de procedimientos de síntesis respaldados por fase sólida permite una serie de protocolos conocidos en la bibliografía que se pueden llevar a cabo, a su vez, de forma manual o automatizada. Las reacciones se pueden llevar a cabo, por ejemplo, mediante tecnología IRORI en microreactores (microreactors) de la empresa Firma Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EEUU.

Tanto en fase sólida como líquida, la realización de etapas de síntesis, individuales o de varias, se puede respaldar mediante el empleo de la tecnología de microondas. En la bibliografía técnica está descrita una serie de protocolos de ensayo, por ejemplo, en Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editores C. O. Kappe y A. Stadler), Verlag Wiley, 2005.

La preparación de acuerdo con los procedimientos descritos en el presente documento proporciona compuestos de fórmula (I) y sus sales en forma de colecciones de sustancias que se denominan bibliotecas. También son objeto de la presente invención bibliotecas que contienen al menos dos compuestos de fórmula (I) y sus sales.

Otro objeto de la invención, a causa de la propiedad de herbicida de los compuestos de fórmula general (I), es también el uso de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) como herbicidas para combatir plantas perjudiciales.

Se emplean herbicidas en cultivos aprovechados agrícolamente durante distintas fases de cultivo. De este modo se realiza la aplicación de algunos productos ya antes o durante la siembra. Otros se distribuyen antes de que emerja la placa de cultivo, es decir, antes de que el brote atraviese la superficie de la tierra (herbicidas de pre-emergencia). Finalmente se usan los herbicidas de post-emergencia cuando se han configurado ya las hojas germinales u hojas vegetativas de la planta de cultivo.

A este respecto, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden aplicar tanto en la pre-emergencia como en la post-emergencia, prefiriéndose un uso de los compuestos de acuerdo con la invención en la pre-emergencia.

El tratamiento de pre-emergencia incluye tanto el tratamiento de la superficie de cultivo antes de la siembra (ppi = pre plant incorporation) como el tratamiento de las superficies de cultivo sembradas, pero todavía sin crecimiento.

Los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) y sus sales, denominados en lo sucesivo también de forma sinónima conjuntamente compuestos de fórmula (I), presentan una eficacia herbicida excelente frente a un amplio espectro de plantas perjudiciales mono- y dicotiledóneas económicamente importantes. También quedan bien abarcadas malezas perennes difíciles de combatir que brotan de rizomas, tallos de raíz u otros órganos permanentes por los principios activos. A este respecto, es indiferente si las sustancias se distribuyen en el procedimiento de pre-siembra, pre-emergencia o post-emergencia.

En particular se mencionan por ejemplo algunos representantes de la flora de maleza mono- y dicotiledónea que se pueden controlar mediante los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I), sin que por la mención se haya de realizar ninguna limitación a especies determinadas. Por parte de las especies de malezas monocotiledóneas quedan bien abarcadas, por ejemplo, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachicaria*, *Bromus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Festuca*, *Fimbristylis*, *Ischaemum*, *Lolium*, *Monochoria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sphenoclea* así como especies de *Cyperus* preferentemente del grupo anual y por parte de las especies perennes *Agropyron*, *Cynodon*, *Imperata* así como *Sorghum* y también especies de *Cyperus* vivaces.

En las especies de malezas dicotiledóneas, el espectro de acción se extiende a especies tales como, por ejemplo, *Galium*, *Viola*, *Veronica*, *Lamium*, *Stellaria*, *Amaranthus*, *Sinapis*, *Ipomoea*, *Matricaria*, *Abutilon* y *Sida* en el lado anual así como *Convolvulus*, *Cirsium*, *Rumex* y *Artemisia* en las malezas perennes. Además se observa efecto herbicida en malezas dicotiledóneas tales como *Ambrosia*, *Anthemis*, *Carduus*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Emex*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Lepidium*, *Lindernia*, *Papaver*, *Portlaca*, *Polygonum*, *Ranunculus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Seneceio*, *Sesbania*, *Solanum*, *Sonchus*, *Taraxacum*, *Trifolium*, *Urtica* y *Xanthium*.

Si se aplican los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) antes de la germinación sobre la superficie de la tierra, entonces se evita por completo la emergencia de los brotes de maleza o las malezas crecen hasta el estadio de hoja germinal, sin embargo, entonces detienen su crecimiento y mueren por completo finalmente después del transcurso de tres a cuatro semanas.

En la aplicación de los principios activos de fórmula general (I) sobre las partes de planta verdes en el procedimiento de post-emergencia aparece asimismo muy rápidamente después del tratamiento una detención drástica del crecimiento y las plantas de maleza permanecen en el estadio de crecimiento existente en el momento de aplicación o mueren por completo después de un cierto tiempo, de tal manera que de esta forma se elimina de forma muy temprana y permanente una concurrencia de maleza perjudicial para las plantas de cultivo.

A pesar de que los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) presentan una actividad herbicida excelente frente a malezas mono- y dicotiledóneas, las plantas de cultivo de cultivos económicamente importantes tales como, por ejemplo, trigo, cebada, centeno, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón, colza y soja solo se dañan de forma no esencial o en absoluto. Los presentes compuestos por estos motivos son muy adecuados para combatir selectivamente el crecimiento vegetal indeseado en cultivos de plantas útiles agrícolas.

Además, las sustancias de acuerdo con la invención de fórmula general (I) presentan propiedades reguladoras del crecimiento excelentes en plantas de cultivo. Intervienen de forma reguladora en el metabolismo intrínseco de la planta y, por tanto, se pueden emplear para influir de forma dirigida en ingredientes vegetales y para facilitar la cosecha, tal como, por ejemplo, mediante el desencadenamiento de desecación y detención del crecimiento. Además son adecuados también para el control general y la inhibición del crecimiento vegetativo deseado, sin destruir a este respecto las plantas. Una inhibición del crecimiento vegetativo desempeña un gran papel en muchos cultivos mono- y dicotiledóneos, ya que por ello se puede reducir o evitar por completo el almacenamiento. A causa de sus propiedades herbicidas y reguladoras del crecimiento vegetal, los principios activos se pueden emplear también para combatir plantas perjudiciales en cultivos de plantas modificadas mediante ingeniería genética conocidas o todavía a desarrollar. Las plantas transgénicas, por norma general, se caracterizan por propiedades particularmente ventajosas, por ejemplo, por resistencias frente a determinados pesticidas, sobre todo determinados herbicidas, resistencias frente a enfermedades vegetales o patógenos de enfermedades vegetales, tales como determinados insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al producto de cosecha en relación con cantidad, calidad, capacidad de almacenamiento, composición e ingredientes especiales. De este modo, son conocidas plantas transgénicas con un contenido de almidón aumentado o una calidad modificada del almidón o aquellas con otra composición de ácidos grasos del producto de cosecha. Otras propiedades particulares pueden radicar en una tolerancia o resistencia frente a estresantes abióticos, por ejemplo, calor, frío, sequedad, sal y radiación ultravioleta.

Se prefiere la aplicación de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) o sus sales en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y decorativas, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, tapioca y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisante y otras variedades hortícolas. Preferentemente, los compuestos de fórmula general (I) se pueden emplear como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes o se han hecho resistentes mediante ingeniería genética frente a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

Las vías convencionales para la producción de nuevas plantas que presentan propiedades modificadas en comparación con plantas existentes hasta ahora consisten, por ejemplo, en procedimientos clásicos de mejora y la generación de mutantes. Como alternativa se pueden generar nuevas plantas con propiedades modificadas con ayuda de procedimientos de ingeniería técnica (véanse, por ejemplo, los documentos EP 0221044, EP 0131624). Se han descrito, por ejemplo, en varios casos

- modificaciones de ingeniería genética de plantas de cultivo con el fin de la modificación del almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, documentos WO 92/011376, WO 92/014827, WO 91/019806),
- plantas de cultivo transgénicas que son resistentes frente a determinados herbicidas de tipo glufosinato (cf., por ejemplo, con los documentos EP 0242236, EP 0242246) o glifosatos (documento WO 92/000377) o de las sulfonilureas (documentos EP 0257993, US 5013659),
- plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo, algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas de Bt) que hacen resistentes a las plantas frente a determinados parásitos (documentos EP 0142924, EP 0193259),
- plantas de cultivo transgénicas con composición de ácidos grasos modificada (documento WO 91/013972),
- plantas de cultivo modificadas mediante ingeniería genética con nuevos ingredientes o sustancias secundarias, por ejemplo, nuevas fitoalexinas que causan una mayor resistencia a enfermedades (documentos EP 0309862, EP 0464461),
- plantas modificadas mediante ingeniería genética con fotorrespiración reducida que presentan mayores cosechas y una mayor tolerancia a estrés (documento EP 0305398),
- plantas de cultivo transgénicas que producen proteínas farmacéutica o diagnósticamente importantes ("molecular pharming" (agricultura molecular)).
- plantas de cultivo transgénicas que se caracterizan por mayores cosechas o mejor calidad,
- plantas de cultivo transgénicas que se caracterizan por una combinación, por ejemplo, de las nuevas propiedades que se han mencionado anteriormente ("gene stacking" (apilamiento de genes)).

En principio son conocidas numerosas técnicas de biología molecular con las que se pueden producir nuevas plantas transgénicas con propiedades modificadas; véase, por ejemplo, I. Potrykus y G. Spangenberg (ed.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg o Christou, "Trends in Plant

Science" 1 (1996) 423-431.

Para tales manipulaciones de ingeniería genética se pueden incluir moléculas de ácido nucleico en plásmidos que permiten una mutagénesis o un cambio de secuencia mediante recombinación de secuencias de ADN. Con ayuda de procedimientos convencionales se pueden efectuar, por ejemplo, sustituciones de bases, retirarse secuencias parciales o añadirse secuencias naturales o sintéticas. Para la unión entre sí de los fragmentos de ADN se pueden unir a los fragmentos adaptadores o engarces, véase, por ejemplo, Sambrook y col., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2ª Ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2ª Edición 1996.

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 correspondiente ARN antisentido, un ARN directo para la consecución de un efecto de cosupresión o la expresión de al menos una ribozima construida correspondientemente que escinde específicamente transcritos del producto génico que se ha mencionado anteriormente.

Para esto, por un lado, se pueden usar moléculas de ADN que comprenden toda la secuencia codificante de un producto génico incluyendo secuencias flanqueantes eventualmente existentes al igual que moléculas de ADN que comprenden solo partes de la secuencia codificante, teniendo que tener estas partes la suficiente longitud para causar un efecto antisentido en las células. Es posible también el uso de secuencias de ADN que presenten un elevado grado de homología en relación con las secuencias codificantes de un producto génico, pero que no sean completamente idénticas.

En el caso de la expresión de moléculas de ácido nucleico en plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimento discrecional de la célula vegetal. Pero para conseguir la localización en un determinado compartimento, por ejemplo, la región codificante se puede enlazar con secuencias de ADN que garantizan la localización en un compartimento determinado. Tales secuencias son conocidas por el experto (véase, por ejemplo, Braun y col., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter y col., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald y col., Plant J. 1 (1991), 95-106). La expresión de las moléculas de ácido nucleico puede tener lugar también en las organelas de las células vegetales.

Las células vegetales transgénicas se pueden regenerar según técnicas conocidas hasta dar plantas enteras. En el caso de las plantas transgénicas se puede tratar, en principio, de plantas de cualquier especie vegetal discrecional, es decir, plantas tanto monocotiledóneas como dicotiledóneas.

De este modo se pueden obtener plantas transgénicas que presentan propiedades modificadas mediante sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias génicas homólogos (= naturales) o expresión de genes o secuencias génicas heterólogos (= extraños).

Preferentemente, los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) se pueden emplear en cultivos transgénicos que son resistentes frente a sustancias de crecimiento tales como, por ejemplo, dicamba o frente a herbicidas que inhiben enzimas vegetales esenciales, por ejemplo, acetolactato sintasas (ALS), EPSP sintasas, glutamina sintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD) o frente a herbicidas del grupo de las sulfonilureas, de los glifosatos, glufosinatos o benzoilsoxazoles y principios activos análogos.

En el caso de la aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) en cultivos transgénicos, además de los efectos que se observarían en otros cultivos frente a plantas perjudiciales, frecuentemente aparecen efectos que son específicos de la administración en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplo, un espectro de maleza modificado o especialmente ampliado que se puede combatir, dosis de aplicación modificadas que se pueden emplear para la administración, preferentemente una buena capacidad de combinación con los herbicidas frente a los que es resistente el cultivo transgénico así como la influencia en el crecimiento y cosecha de las plantas de cultivo transgénicas.

Por tanto, el objeto de la invención es también el uso de los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) como herbicidas para combatir plantas perjudiciales en plantas de cultivo transgénicas.

Los compuestos de fórmula general (I) se pueden formular de distinta manera, dependiendo de qué parámetros biológicos y/o físico-químicos estén predefinidos. Como posibilidades de formulación se consideran, por ejemplo: polvo humectable de pulverización (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones de aceite en agua y agua en aceite, soluciones pulverizables, concentrados en suspensión (SC), dispersiones a base de aceite o agua, soluciones miscibles con aceite, suspensiones capsulares (CS), agentes de espolvoreo (DP), desinfectantes, granulados para aplicación de distribución y suelo, granulados (GR) en forma de microgránulos, gránulos de pulverización, fijación y adsorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV, microcápsulas y ceras.

Estos tipos de formulación individuales en principio son conocidos y se describen, por ejemplo, en: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volumen 7, C. Hanser Verlag München, 4ª ed. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3ª Ed. 1979, G.

Goodwin Ltd. Londres.

Los coadyuvantes de formulación necesarios tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos asimismo son conocidos y se describen, por ejemplo, en: 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 y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volumen 7, C. Hanser Verlag München, 4ª ed. 1986.

A base de esas formulaciones se pueden preparar también combinaciones con otras sustancias pesticidamente eficaces tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo, en forma de una formulación final o como mezcla en tanque.

Los polvos humectables de pulverización son preparaciones dispersables uniformemente en agua que contienen además del principio activo, aparte de un diluyente o sustancia inerte, también tensioactivos de tipo iónico y/o no iónico (humectante, dispersante), por ejemplo, alquifenoles polioxetilados, alcoholes grasos polioxetilados, aminas grasas polioxetiladas, sulfatos de éter de poliglicol de alcohol graso, sulfonatos de alcano, sulfatos de alquilbenceno, ligninosulfonato sódico, 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato sódico, dibutilnaftalen-sulfonato sódico o también oleoilmetilaurinato sódico. Para la preparación de los polvos humectables de pulverización, los principios activos herbicidas se muelen finamente, por ejemplo, en aparatos habituales tales como molinos de martillos, molinos de soplador y molidos de chorro de aire y al mismo tiempo o a continuación se mezclan con los coadyuvantes de formulación.

Se preparan concentrados emulsionables mediante disolución del principio activo en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también compuestos aromáticos de mayor punto de ebullición o hidrocarburos o mezclas de los disolventes orgánicos con adición de uno o varios tensioactivos de tipo iónico y/o no iónico (emulsionantes). Como emulsionantes se pueden usar, por ejemplo: sales de calcio de ácido alquilarilsulfónico tales como dodecibencenosulfonato de Ca o emulsionantes no iónicos tales como ésteres de poliglicol de ácido graso, alquilarilpoliglicoléteres, poliglicoléteres de alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, alquilpoliéteres, ésteres de sorbitán tal como, por ejemplo, ésteres de ácido graso de sorbitán o ésteres de polioxietilensorbitán tal como, por ejemplo, ésteres de ácido graso de polioxietilensorbitán.

Se obtienen agentes de espolvoreo mediante molienda del principio activo con sustancias sólidas distribuidas finamente, por ejemplo, talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita o tierra de diatomeas. Los concentrados de suspensión pueden ser de base acuosa u oleosa. Se pueden preparar, por ejemplo, mediante molienda en húmedo mediante molinos de perlas disponibles en el mercado y eventualmente adición de tensioactivos, tal como ya se han indicado anteriormente en los otros tipos de formulación.

Se pueden preparar emulsiones, por ejemplo, emulsiones de aceite en agua (EW) por ejemplo mediante agitación, molinos coloidales y/o mezcladoras estáticas mediante el uso de disolventes orgánicos acuosos y eventualmente tensioactivos, tal como ya se han indicado por ejemplo anteriormente en los otros tipos de formulación.

Se pueden preparar granulados mediante inyección por tobera del principio activo sobre un material inerte granulado con capacidad de adsorción o mediante aplicación de concentrados de principio activo mediante adhesivos, por ejemplo, alcohol polivinílico, poliácido sódico o incluso aceites minerales, sobre la superficie de sustancias de soporte tales como arena, caolinitas o de material inerte granulado. También se pueden granular principios activos adecuados de la forma habitual en la preparación de granulados de fertilizante —en caso deseado mezclados con fertilizantes—.

Los granulados dispersables en agua se preparan, por norma general, según los procedimientos habituales tales como secado por pulverización, granulación en lecho fluidizado, granulación en plato, mezcla con mezcladoras de alta velocidad y extrusión sin material inerte sólido. Para la preparación de granulados de plato, lecho fluidizado, extrusora y pulverización véanse, por ejemplo, los procedimientos en "Spray-Drying Handbook" 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J. E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York 1973, pág. 8-57.

Para otras particularidades en relación con la formulación de agentes fitoprotectores véase, por ejemplo, G. C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nueva 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.

Las preparaciones agroquímicas contienen, por norma general, del 0,1 al 99 % en peso, en particular del 0,1 al 95 % en peso de principio activo de fórmula (I).

En polvos humectables de pulverización, la concentración de principio activo es, por ejemplo, de aproximadamente el 10 al 90 % en peso, el resto hasta el 100 % en peso está compuesto por constituyentes habituales de la

formulación. En el caso de concentrados emulsionables, la concentración de principio activo puede ser de aproximadamente del 1 al 90, preferentemente del 5 al 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvo contienen del 1 al 30 % en peso de principio activo, preferentemente la mayoría de las veces del 5 al 20 % en peso de principio activo, las soluciones pulverizables contienen de aproximadamente el 0,05 al 80, preferentemente del 2 al 50 % en peso de principio activo. En granulados dispersables en agua, el contenido de principio activo en parte depende de si el compuesto eficaz está presente en forma líquida o sólida y qué coadyuvantes de granulación, cargas, entre otras cosas, se usen. En el caso de los granulados dispersables en agua, el contenido de principio activo se encuentra, por ejemplo, entre el 1 y el 95 % en peso, preferentemente entre el 10 y el 80 % en peso.

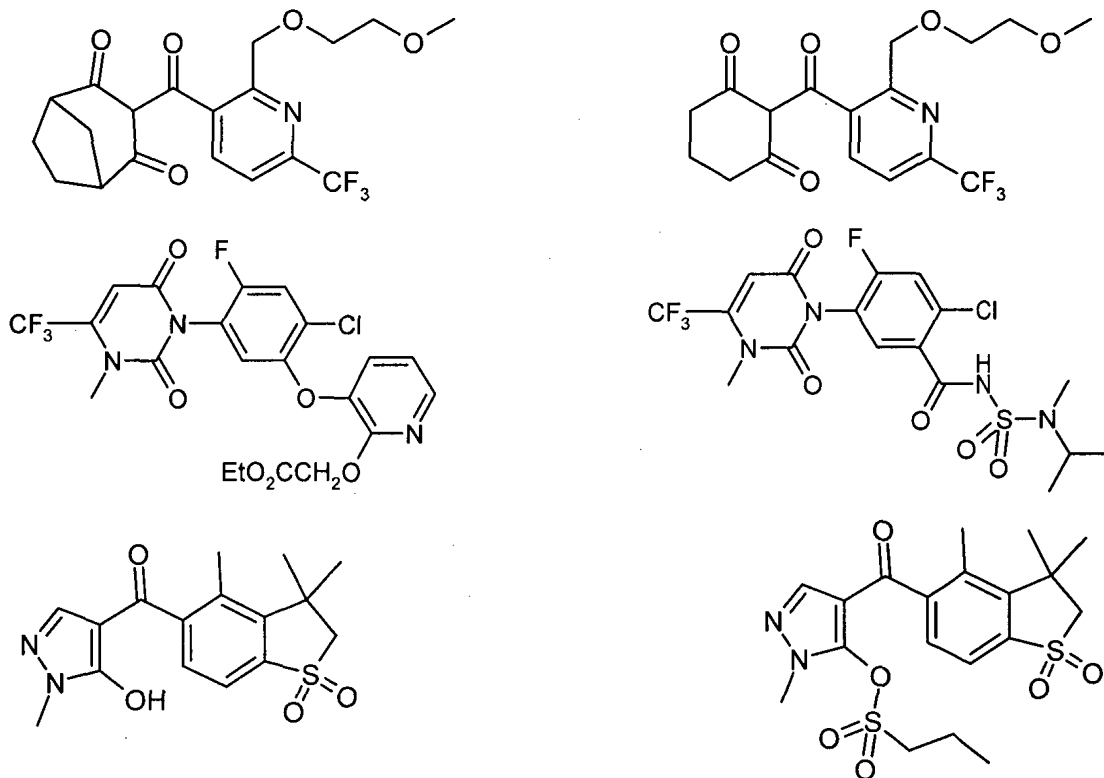
Además, las formulaciones de principio activo mencionadas contienen eventualmente los agentes adherentes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, agentes de penetración, conservantes, agentes anticongelantes y disolventes, cargas, vehículos y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación y agentes que influyen en el valor del pH y la viscosidad respectivamente habituales.

Los compuestos de fórmula general (I) o sus sales se pueden emplear como tales o de forma combinada en forma de sus preparaciones (formulaciones) con otras sustancias con actividad pesticida, tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, fungicidas, protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo, como formulación terminada o como mezclas en tanque.

Como asociados de combinación para los compuestos de acuerdo con la invención en formulaciones de mezcla o en la mezcla en tanque se pueden emplear, por ejemplo, principios activos conocidos que se basan en una inhibición de, por ejemplo, acetolactato sintasa, acetil-CoA-carboxilasa, celulosa sintasa, enolpiruvilshikimat-3-fosfato sintasa, glutamina-sintetasa, *p*-hidroxi-fenilpivurato dioxigenasa, fitoendesaturasa, fotosistema I, fotosistema II, protoporfirinógeno oxidasa, tal como se describe, por ejemplo, en Weed Research 26 (1986) 441-445 o "The Pesticide Manual", 13ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 y bibliografía citada allí. Como herbicidas o reguladores del crecimiento vegetal conocidos que se pueden combinar con los compuestos de acuerdo con la invención se han de mencionar, por ejemplo, los siguientes principios activos (los compuestos están denominados con la "denominación común" según la International Organization for Standardization (ISO) o con el nombre químico o con el número de código) y comprenden siempre todas las formas de aplicación, tales como ácidos, sales, ésteres e isómeros, tales como esteroisómeros e isómeros ópticos. A este respecto se mencionan por ejemplo una y en parte también varias formas de aplicación:

acetoclor, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, acifluorofeno, acifluorofeno sódico, aclonifeno, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim sódica, ametrina, amicarbazona, amidoclor, amidosulfuron, aminopiridid, amitrol, sulfamato de amonio, ancimidol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, aziprotrina, BAH-043, BAS-140H, BAS-693H, BAS-714H, BAS-762H, BAS-776H, BAS-800H, beflubutamida, benazolina, benazolina-etilo, bencarbazona, benfluralina, benfuresato, bensulida, bensulfurona-metilo, bentazona, bencfendizona, benzobiciclona, benzofenap, benzoilprop, bifenox, bilanafos, bilanafos sódico, bispiribaco, bispiribac sódico, bromacilo, bromobutida, bromofenoxima, bromoxinilo, bromuron, buminafos, busoxinon, butaclor, butafenacilo, butamifos, butenaclor, butralina, butroxidima, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etilo, clometoxifeno, cloramben, clorazifop, clorazifop-butilo, clorbromurona, clorbufam, clorfenaco, clorfenaco sódico, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metilo, cloridazona, clorimuron, clorimuron-etilo, cloruro de cloromequat, clornitrofenol, clorofluralina, clortaldimetilo, clorotoluron, clorsulfuron, cinidon, cinidon-etilo, cinmetilina, cinosulfuron, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorfencet, clomazona, clomeprop, cloprop, clopiralid, cloransulam, cloransulam-metilo, cumiluron, cianamida, cianazina, ciclanilida, cicloato, ciclosulfamuron, cicloxidim, cicluron, cihalofop, cihalofop-butilo, ciperquat, ciprotrina, ciprazol, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron/dimron, dalapon, daminozida, dazomet, *n*-decanol, desmedifam, desmetrina, detosil-pirazolato (DTP), dialato, dicamba, diclobenilo, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulam, dietatilo, dietatilo-etilo, difenoxuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir sódico, dimefuron, diquegulaco sódico, dimefuron, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamida, dimetenamida-P, dimetipina, dimetrasulfuron, dinitramina, dinoseb, dinoterb, difenamida, dipropetrina, diquat, dibromuro de diquat, ditiopir, diuron, DNOC, eglinafina-etilo, endotal, EPTC, esprocarb, etalfuralina, etametsulfuron-metilo, etefona, etidimuron, etiozina, etofumesato, etoxifeno, etoxifeno-etilo, etoxisulfuron, etobenzanida, F-5331, es decir *N*-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-dihidro-5-oxo-1*H*-tetrazol-1-il]-fenil]-etanosulfonamida, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fentrazamida, fenuron, flamprop, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurona, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, fluazolato, flucarbazona, flucarbazona sódica, flucetosulfuron, fluclofuralina, flufenacet (tiaflumida), flufenpir, flufenpir-etilo, flumetralina, flumetsulam, flumicloraco, flumicloraco-pentilo, flumioxazina, flumipropina, fluometuron, fluorodifeno, fluoroglicofeno, fluoroglicofeno-etilo, flupoxam, flupropacilo, flupropanato, flupirsulfuron, flupirsulfuron-metilo sódica, flurenol, flurenol-butilo, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-metilo, flurprimidol, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metilo, flutiamida, fomesafeno, foramsulfuron, forclorfenuron, fosamina, furiloxifeno, ácido giberélico, glufosinato, *L*-glufosinato, *L*-glufosinato amónico, glufosinato amónico, glifosato, glifosato-isopropilamonio, H-9201, halosafeno, halosulfuron, halosulfuron-metilo, haloxifop, haloxifop-P, haloxifopetoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HNPC-9908, HOK-201, HW-02, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquina, imazetapir, imazosulfuron, inabenfida, indanofan, ácido indolacético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico (IBA), yodosulfuron, yodosulfuron-metilo sódica, ioxinilo, isocarbamida, isopropalina, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaclorol,

isoxaflutol, isoxapirifop, IDH-100, KUH-043, KUH-071, carbutilato, quetospiradox, lactofeno, lenacilo, linuron, hidrazida de ácido maleico, MCPA, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y sódico, mecoprop, mecoprop sódico, mecopropbutotilo, mecoprop-P-butotilo, mecoprop-P-dimetilamonio, mecoprop-P-2-etilhexilo, mecoprop-P potásico, mefenacet, mefluidida, cloruro de mepiquat, mesosulfuron, mesosulfuron-metilo, mesotriona, metabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitrona, metazaclor, metazol, metoxifenona, metildimrona, 1-metilciclopropeno, metilisotiocianato, metobenzuron, metobromuron, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxuron, metribuzina, metsulfuron, metsulfuron-metilo, molinato, monalida, monocarbamida, dihidrogensulfato de monocarbamida, monolinuron, monosulfuron, monuron, MT 128, 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-benciloxipirazol, neburon, nicosulfuron, nipiraclofeno, nitalina, nitrofenol, nitrofenolato sódico (mezcla de isómeros), nitrofluorofeno, ácido nonanoico, norflurazona, orbencarb, ortosulfamuron, orizalina, oxadiargilo, oxadiazona, oxasulfuron, oxaciclomefona, oxifluorofeno, paclobutrazol, paraquat, dicloruro de paraquat, ácido pelargónico (ácido nonanoico), pendimetalina, pendralina, penoxsulam, pentanoclor, pentoxazona, perfluidona, petoxamida, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etilo, picloram, picolinafeno, pinoxadeno, piperofos, pirifenop, pirifenop-butilo, pretilaclor, primisulfuron, primisulfuron-metilo, probenazol, profluzol, prociazina, prodiamina, prifluralina, profoxidima, prohexadiona, prohexadiona cálcica, prohidrojasmona, prometona, prometrina, propaclor, propanilo, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona sódica, propizamida, prosulfalina, prosulfocarb, prosulfuron, prinaclor, piraclonilo, piraflufeno, piraflufeno-etilo, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfuron-etilo, pirazoxifeno, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribenzoxima, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalid, piriminobaco, piriminobaco-metilo, pirimisulfan, piritiobaco, piritiobaco sódico, piroxasulfona, piroxsulam, quincoloraco, quinmeraco, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, rimsulfuron, secbumetona, setoxidima, siduron, simazina, simetrina, SN-106279, sulcotriona, sulfalato (CDEC), sulfentrazona, sulfometuron, sulfometuron-metilo, sulfosato (glifosato-trimesio), sulfosulfuron, SYN-523, SYP-249, SYP-298, SYP-300, tebutam, tebutiuron, tecnaceno, tefuriltriona, tembotriona, tepaloxidim, terbacilo, terbucarb, terbutaclor, terbumetona, terbutilazina, terbutrina, TH-547, tenilclor, tiafluamida, tiazafluron, tiazipir, tidiazimina, tidiazuron, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tifensulfuron, tifensulfuron-metilo, tiobencarb, tiocarbacilo, topramezona, tralcoxidima, trialato, triasulfuron, triaziflam, triazofenamida, tribenuron, tribenuron-metilo, ácido tricloroacético (TCA), triclopir, tridifano, trietazina, trifloxisulfuron, trifloxisulfuron sódico, trifluralina, triflusulfuron, triflusulfuron-metilo, trimeturon, trinexapaco, trinexapaco-etilo, tritosulfuron, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P, vernolato, ZJ-0166, ZJ-0270, ZJ-0543, ZJ-0862 así como los siguientes compuestos

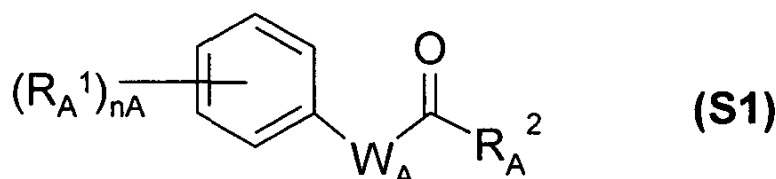


Es de interés particular la lucha selectiva contra plantas perjudiciales en cultivos de plantas útiles y decorativas. A pesar de que los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) presentan ya en muchos cultivos una selectividad de muy buena a suficiente, en principio en algunos cultivos y, sobre todo también en el caso de

mezclas con otros herbicidas que son menos selectivos, pueden aparecer fitotoxicidades en las plantas de cultivo. A este respecto son de particular interés combinaciones de compuestos de acuerdo con la invención de fórmula general (I) que contienen los compuestos de fórmula general (I) o sus combinaciones con otros herbicidas o pesticidas y protectores. Los protectores que se emplean en un contenido con actividad de antídoto reducen los efectos secundarios fitotóxicos de los herbicidas/pesticidas empleados, por ejemplo, en cultivos económicamente importantes tales como cereales (trigo, cebada, centeno, maíz, arroz, mijo), remolacha azucarera, caña de azúcar, colza, algodón y soja, preferentemente cereales. Se consideran los siguientes grupos de compuestos, por ejemplo, como protectores para los compuestos (I) en solitario o, sin embargo, en sus combinaciones con otros pesticidas:

Los protectores están seleccionados preferentemente del grupo compuesto por:

S1) Compuestos de fórmula (S1),

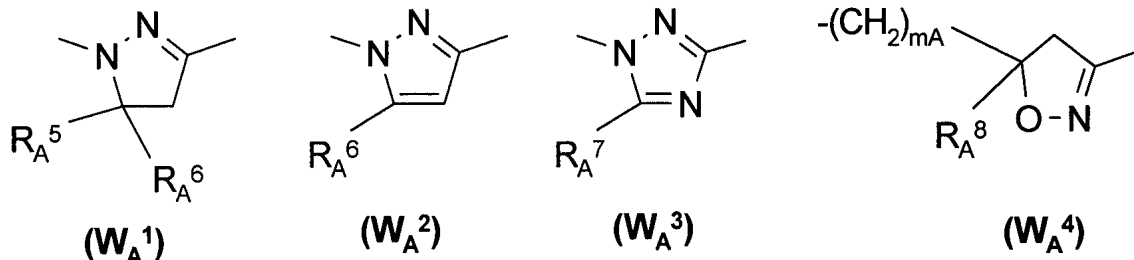


en la que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

n_A es un número natural de 0 a 5, preferentemente de 0 a 3;

RA^1 es halógeno, alquilo (C_1 - C_4), alcoxi (C_1 - C_4), nitro o haloalquilo (C_1 - C_4);

W_A es un resto heterocíclico divalente no sustituido o sustituido del grupo de los heterociclos de cinco miembros parcialmente saturados o aromáticos con 1 a 3 heteroátomos de anillo del grupo N y O, estando contenido al menos un átomo de N y como mucho un átomo de O en el anillo, preferentemente un resto del grupo (W_A^1) a (W_A^4).



m_A es 0 o 1;

RA^2 es OR_A^3 , SR_A^3 o $NR_A^3RA^4$ o un heterocíclico de 3 a 7 miembros saturado o insaturado con al menos un átomo de N y hasta 3 heteroátomos, preferentemente del grupo O y S, que está unido a través del átomo de N con el grupo carbonilo en (S1) y está no sustituido o sustituido con restos del grupo alquilo (C_1 - C_4), alcoxi (C_1 - C_4) o fenilo eventualmente sustituido, preferentemente un resto de fórmula OR_A^3 , NHR_A^4 o $N(CH_3)_2$, en particular de fórmula OR_A^3 ;

RA^3 es hidrógeno o un resto de hidrocarburo alifático no sustituido o sustituido, preferentemente con en total 1 a 18 átomos de C;

RA^4 es hidrógeno, alquilo (C_1 - C_6), alcoxi (C_1 - C_6) o fenilo sustituido o no sustituido;

RA^5 es H, alquilo (C_1 - C_8), haloalquilo (C_1 - C_8), alcoxi- $(C_1$ - $C_4)$ -alquilo (C_1 - C_8), ciano o $COOR_A^9$, siendo RA^9 hidrógeno, alquilo (C_1 - C_8), haloalquilo (C_1 - C_8), alcoxi- $(C_1$ - $C_4)$ -alquilo (C_1 - C_4), hidroxialquilo (C_1 - C_6), cicloalquilo (C_3 - C_{12}) o tri-alquil- $(C_1$ - $C_4)$ -sililo;

RA^6 , RA^7 , RA^8 son iguales o distintos hidrógeno, alquilo (C_1 - C_8), haloalquilo (C_1 - C_8), cicloalquilo (C_3 - C_{12}) o fenilo sustituido o no sustituido;

preferentemente:

a) compuestos del tipo del ácido diclorofenilpirazolin-3-carboxílico ($S1^a$), preferentemente compuestos tales como ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolin-3-carboxílico, éster de etilo de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolin-3-carboxílico ($S1-1$) ("mefenpir-dietilo") y compuestos relacionados, tal como están descritos en el documento WO-A-91/07874;

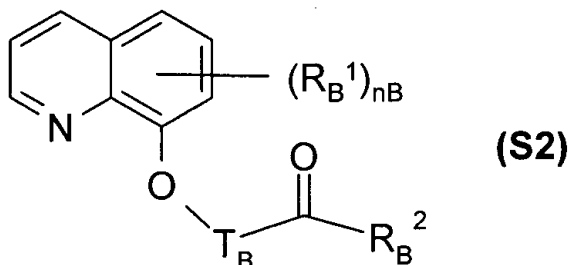
b) derivados del ácido diclorofenilpirazolcarboxílico ($S1^b$), preferentemente compuestos tales como éster de etilo de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-metil-pirazol-3-carboxílico ($S1-2$), éster de etilo de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropil-pirazol-3-carboxílico ($S1-3$), éster de etilo de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetil-etil)pirazol-3-carboxílico ($S1-4$) y compuestos relacionados, tal como están descritos en los documentos EP-A-333 131 y EP-A-269 806;

c) derivados del ácido 1,5-difenilpirazol-3-carboxílico (S1^c), preferentemente compuestos tales como éster de etilo de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxílico (S1-5), éster de metilo de ácido 1-(2-clorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxílico (S1-6) y compuestos relacionados, tal como están descritos, por ejemplo, en el documento EP-A-268554;

d) compuestos del tipo de los ácidos triazolcarboxílicos (S1^d), preferentemente compuestos tales como (éster de etilo de) fenclofazol, es decir éster de etilo de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-triclorometil-(1*H*)-1,2,4-triazol-3-carboxílico (S1-7) y compuestos relacionados, tal como están descritos en los documentos EP-A-174 562 y EP-A-346 620;

e) compuestos del tipo del ácido 5-bencil- o 5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico o del ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1^e), preferentemente compuestos tales como éster de etilo de ácido 5-(2,4-diclorobencil)-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1-8) o éster de etilo de ácido 5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1-9) y compuestos relacionados, tales como están descritos en el documento WO-A-91/08202, o ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-carboxílico (S1-10) o éster de etilo de ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-carboxílico (S1-11) ("isoxadifeno-etilo") o éster de *n*-propilo (S1-12) o el éster de etilo de ácido 5-(4-fluorofenil)-5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1-13), tal como están descritos en la Solicitud de Patente WO-A-95/07897.

S2) derivados de quinolina de fórmula (S2),



en la que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

R_B¹ es halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), nitro o haloalquilo (C₁-C₄);

n_B es un número natural de 0 a 5, preferentemente de 0 a 3;

R_B² es OR_B³, SR_B³ o NR_B³R_B⁴ o un heterociclo de 3 a 7 miembros saturado o insaturado con al menos un átomo de N y hasta 3 heteroátomos, preferentemente del grupo O y S, que está unido a través del átomo de N con el grupo carbonilo en (S2) y está no sustituido o sustituido con restos del grupo alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄) o fenilo eventualmente sustituido, preferentemente un resto de fórmula OR_B³, NHR_B⁴ o N(CH₃)₂, en particular de fórmula OR_B³;

R_B³ es hidrógeno o un resto hidrocarburo alifático no sustituido o sustituido, preferentemente con en total 1 a 18 átomos de C;

R_B⁴ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) o fenilo sustituido o no sustituido;

T_B es una cadena de alcano-(C₁ o C₂)-diilo, que está no sustituida o sustituida con uno o dos restos alquilo (C₁-C₄) o con [alcoxi (C₁-C₃)]-carbonilo; preferentemente:

a) compuestos del tipo del ácido 8-quinolinoxiacético (S2^a), preferentemente

éster de (1-metilhexilo) de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético ("cloquintocet-mexilo") (S2-1),

éster de (1,3-dimetil-but-1-ilo) de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-2),

éster de 4-aliloxi-butilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-3),

éster de 1-aliloxi-prop-2-ilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-4),

éster de etilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-5),

éster de metilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-6),

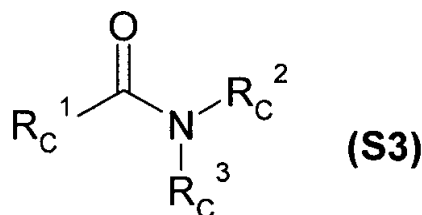
éster de alilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-7),

éster de 2-(2-propiliden-iminoxi)-1-etilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-8),

éster de 2-oxo-prop-1-ilo de ácido de (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-9) y compuestos relacionados, tal como están descritos en los documentos EP-A-86 750, EP-A-94 349 y EP-A-191 736 o EP-A-0 492 366 así como ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)acético (S2-10), sus hidratos y sales, por ejemplo sus sales de litio, sodio, potasio, calcio, magnesio, aluminio, hierro, amonio, amonio cuaternario, sulfonio o fosfonio, tal como están descritos en el documento WO-A-2002/34048;

b) compuestos del tipo del ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)malónico (S2^b), preferentemente compuestos tales como éster de dietilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)malónico, éster de dialilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)malónico, éster de metil-etilo de ácido (5-cloro-8-quinolinoxia)malónico y compuestos relacionados, tal como están descritos en el documento EP-A-0 582 198.

S3) compuestos de fórmula (S3)



en la que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

R_C¹ es alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alqueno (C₂-C₄), haloalqueno (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), preferentemente diclorometilo;

R_C², R_C³ son iguales o distintos hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), alqueno (C₂-C₄), alquino (C₂-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalqueno (C₂-C₄), alquil-(C₁-C₄)-carbomilo-alquilo (C₁-C₄), alqueno-(C₂-C₄)-carbomilo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi-(C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), dioxolanil-alquilo (C₁-C₄), tiazolilo, furilo, furilalquilo, tienilo, piperidilo, fenilo sustituido o no sustituido, o R_C² y R_C³ forman juntos un anillo heterocíclico sustituido o no sustituido, preferentemente un anillo de oxazolidina, tiazolidina, piperidina, morfina, hexahidropirimida o benzoxazina; preferentemente:

principios activos del tipo de las dicloroacetamidas que se aplican frecuentemente como protectores de pre-emergencia (protectores con eficacia en el suelo) tales como, por ejemplo, "dicloromid" (N,N-dialil-2,2-dicloroacetamida) (S3-1),

"R-29148" (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina) de la empresa Stauffer (S3-2),

"R-28725" (3-dicloroacetil-2,2-dimetil-1,3-oxazolidina) de la empresa Stauffer (S3-3),

"Benoxacor" (4-dicloroacetil-3,4-dihidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina) (S3-4), "PPG-1292" (N-alil-N-[(1,3-dioxolan-2-il)-metil]-dicloroacetamida) de la empresa PPG Industries (S3-5),

"DKA-24" (N-alil-N-[(alilaminocarbonil)metil]-dicloroacetamida) de la empresa Sagro-Chem (S3-6),

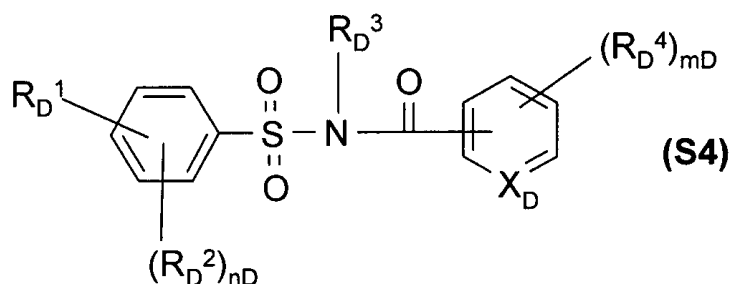
"AD-67" o "MON 4660" (3-dicloroacetil-1-oxa-3-aza-spiro[4,5]decano) de la empresa Nitrokemia o Monsanto (S3-7),

"TI-35" (1-dicloroacetil-azepan) de la empresa TRI-Chemical RT (S3-8), "diclonon" (diciclonon) o "BAS145138" o

"LAB145138" (S3-9) ((RS)-1-dicloroacetil-3,3,8a-trimetilperhidropirrol[1,2-a]pirimidin-6-ona) de la empresa BASF,

"Furilazol" o "MON 13900" ((RS)-3-dicloroacetil-5-(2-furil)-2,2-dimetil-oxazolidina) (S3-10); así como su isómero (R) (S3-11).

S4) N-acilsulfonamidas de fórmula (S4) y sus sales



en la que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

X_D es CH o N;

R_D¹ es CO-NR_D⁵R_D⁶ o NHCO-R_D⁷;

R_D² es halógeno, haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), nitro, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-sulfonilo, alcoxi-(C₁-C₄)-carbonilo o alquil-(C₁-C₄)-carbonilo;

R_D³ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), alqueno (C₂-C₄) o alquino (C₂-C₄);

R_D⁴ es halógeno, nitro, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), fenilo, alcoxi (C₁-C₄), ciano, alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-sulfonilo, alquil-(C₁-C₄)-sulfonilo alcoxi-(C₁-C₄)-carbonilo o alquil-(C₁-C₄)-carbonilo;

R_D⁵ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalqueno (C₅-C₆), fenilo o heterociclo de 3 a 6 miembros que contiene v_D heteroátomos del grupo nitrógeno, oxígeno y azufre, estando los siete restos mencionados en último lugar sustituidos con v_D sustituyentes del grupo halógeno, alcoxi

(C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₂)-sulfinilo, alquil-(C₁-C₂)-sulfonilo, cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi-(C₁-C₄)-carbonilo, alquil-(C₁-C₄)-carbonilo y fenilo y en el caso de restos cíclicos, también alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄);

R_D⁶ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), estando sustituidos los tres restos mencionados en último lugar con v_D restos del grupo halógeno, hidroxilo, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), y alquiltio (C₁-C₄) o

R_D⁵ y R_D⁶ forman junto con el átomo de nitrógeno que los lleva un resto pirrolidinilo o piperidinilo;

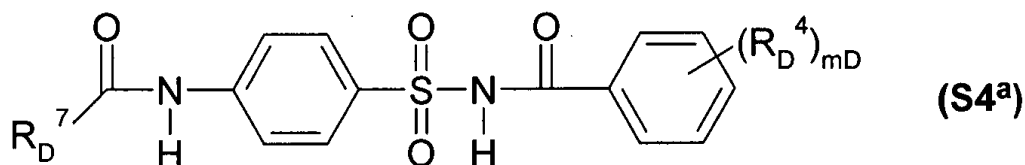
R_D⁷ es hidrógeno, alquil-(C₁-C₄)-amino, di-alquil-(C₁-C₄)-amino, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), estando sustituidos los 2 restos mencionados en último lugar con v_D sustituyentes del grupo halógeno, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₆) y alquiltio (C₁-C₄) y en el caso de restos cíclicos también alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄);

n_D es 0, 1 o 2;

m_D es 1 o 2;

v_D es 0, 1, 2 o 3;

de las que se prefieren compuestos del tipo de las *N*-acilsulfonamidas, por ejemplo, de la siguiente fórmula (S4^a) que se conocen, por ejemplo, por el documento WO-A-97/45016



en la que

R_D⁷ significa alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), estando sustituidos los 2 restos mencionados en último lugar con v_D sustituyentes del grupo halógeno, alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₆) y alquiltio (C₁-C₄) y en el caso de restos cíclicos también alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄);

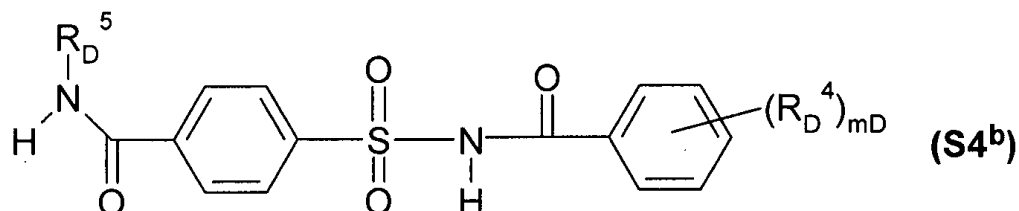
R_D⁴ halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), CF₃;

m_D 1 o 2;

v_D es 0, 1, 2 o 3;

así como

amidas de ácido acilsulfamoylbenzoico, por ejemplo, de la siguiente fórmula (S4^b), que son conocidas, por ejemplo, por el documento WO-A-99/16744,



por ejemplo aquellas en las que

R_D⁵ = ciclopropilo y (R_D⁴) = 2-OMe ("ciprosulfamidas", S4-1),

R_D⁵ = ciclopropilo y (R_D⁴) = 5-Cl-2-OMe (S4-2),

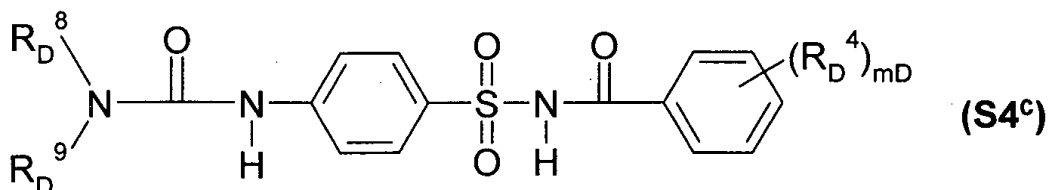
R_D⁵ = etilo y (R_D⁴) = 2-OMe (S4-3),

R_D⁵ = isopropilo y (R_D⁴) = 5-Cl-2-OMe (S4-4) y

R_D⁵ = isopropilo y (R_D⁴) = 2-OMe (S4-5)

así como

compuestos de tipo de las *N*-acilsulfamoylifenilureas de fórmula (S4^c), que son conocidas, por ejemplo, por el documento EP-A-365484



en la que

R_D⁸ y R_D⁹ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo (C₁-C₈), cicloalquilo (C₃-C₈), alqueno (C₃-C₆), alquino (C₃-C₆),

R_D⁴ halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), CF₃

m_D 1 o 2;
por ejemplo

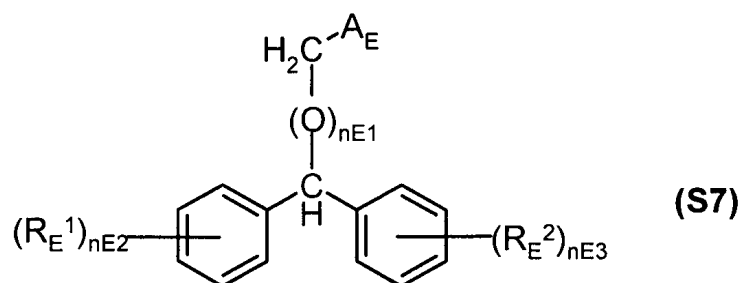
1-[4-(*N*-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilurea,
1-[4-(*N*-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetilurea,
1-[4-(*N*-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilurea.

S5) principios activos de la clase de los compuestos hidroxiaromáticos y de los derivados de ácidos carboxílicos aromáticos alifáticos (S5), por ejemplo, éster de etilo de ácido 3,4,5-triacetoxibenzoico, ácido 3,5-dimetoxi-4-hidroxibenzoico, ácido 3,5-dihidroxibenzoico, ácido 4-hidroxisalicílico, ácido 4-fluorosalicílico, ácido 2-hidroxicinámico, ácido 2,4-diclorocinámico, tal como están descritos en los documentos WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

S6) principios activos de la clase de las 1,2-dihidroquinoxalin-2-onas (S6), por ejemplo

1-metil-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-tiona, clorhidrato de 1-(2-aminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, 1-(2-metilsulfonilaminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, tal como están descritos en el documento WO-A-2005/112630.

S7) compuestos de fórmula (S7), tal como están descritos en el documento WO-A-1998/38856



en la que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

R_E^1 , R_E^2 son, independientemente entre sí, halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-amino, di-alquil-(C₁-C₄)-amino, nitro;

A_E es COOR_E³ o COSR_E⁴

R_E^3 , R_E^4 son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₄), cianoalquilo, haloalquilo (C₁-C₄), fenilo, nitrofenilo, bencilo, halobencilo, piridinilalquilo y alquilamonio,

n_E^1 es 0 o 1

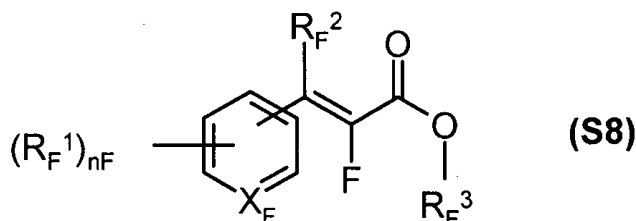
n_E^2 , n_E^3 son, independientemente entre sí, 0, 1 o 2, preferentemente:

ácido difenilmetoxiacético,

éster de etilo de ácido difenilmetoxiacético,

éster de metilo de ácido difenilmetoxiacético (Nº de Reg. CAS 41858-19-9) (S7-1).

S8) compuestos de fórmula (S8), tal como están descritos en el documento WO-A-98/27049



en la que

X_F CH o N,

n_F en el caso de que $X_F=N$ es un número entero de 0 a 4 y en el caso de que $X_F=CH$ es un número entero de 0 a 5,

R_F^1 halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), nitro, alquiltio (C₁-C₄), alquil-(C₁-C₄)-sulfonilo, alcoxi-(C₁-C₄)-carbonilo, fenilo eventualmente sustituido, fenoxi eventualmente sustituido,

R_F^2 hidrógeno o alquilo (C₁-C₄),

R_F^3 hidrógeno, alquilo (C₁-C₈), alquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄) o arilo, estando cada uno de los restos que contienen C que se han mencionado anteriormente no sustituidos o sustituidos por uno o varios, preferentemente hasta tres restos iguales o distintos del grupo compuesto por halógeno y alcoxi; o sus sales

preferentemente compuestos en los que significan

X_F CH,

n_F un número entero de 0 a 2,

R_F^1 halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4),

R_F^2 hidrógeno o alquilo (C_1-C_4),

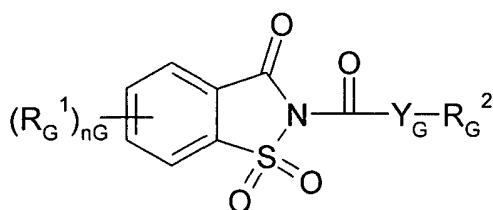
R_F^3 hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_4), alquinilo (C_2-C_4) o arilo, estando cada uno de los restos que contienen C que se han mencionado anteriormente no sustituidos o sustituidos con uno o varios, preferentemente hasta tres, restos iguales o distintos del grupo compuesto por halógeno y alcoxi o sus sales.

S9) principios activos de la clase de las 3-(5-tetrazolilcarbonyl)-2-quinolonas (S9), por ejemplo

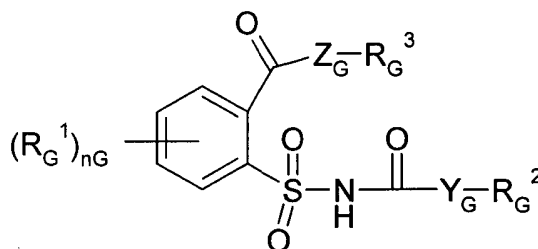
1,2-dihidro-4-hidroxi-1-etil-3-(5-tetrazolilcarbonyl)-2-quinolona (Nº de Reg. CAS 219479-18-2), 1,2-dihidro-4-hidroxi-1-metil-3-(5-tetrazolilcarbonyl)-2-quinolona (Nº de Reg. CAS 95855-00-8), tal como están descritos en el documento WO-A-1999/000020.

S10) compuestos de las fórmulas (S10^a) o (S10^b)

tal como están descritos en los documentos WO-A-2007/023719 y WO-A-2007/023764



(S10^a)



(S10^b)

en las que significan

R_G^1 halógeno, alquilo (C_1-C_4), metoxi, nitro, ciano, CF_3 , OCF_3 ,

Y_G , Z_G , independientemente entre sí, O o S,

n_G un número entero de 0 a 4,

R_G^2 alquilo (C_1-C_{16}), alquenilo (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_6), arilo; bencilo, halobencilo,

R_G^3 hidrógeno o alquilo (C_1-C_6).

S11) principios activos del tipo de los compuestos oxiimino (S11), que son conocidos como desinfectantes de simiente tales como, por ejemplo, "oxabetrinilo" ((Z)-1,3-dioxolan-2-ilmetoxiimino(fenil)acetoniitrilo) (S11-1), que es conocido como protector desinfectante de simiente para mijo contra daños por metolaclor,

"Fluxofenim" (1-(4-clorofenil)-2,2,2-trifluoro-1-etanon-O-(1,3-dioxolan-2-ilmetil)-oxima) (S11-2), que es conocido como protector desinfectante de simiente para mijo contra daños por metolaclor y

"Ciometrinilo" o "CGA-43089" ((Z)-cianometoxiimino(fenil)acetoniitrilo) (S11-3) que es conocido como protector desinfectante de simiente para mijo contra daños por metolaclor.

S12) principios activos de la clase de las isotiocromanonas (S12), tales como, por ejemplo, [(3-oxo-1H-2-benzotipiran-4(3H)-iliden)metoxil]acetato de metilo (Nº de Reg. CAS 205121-04-6) (S12-1) y compuestos relacionados del documento WO-A-1998/13361.

S13) uno o varios de los compuestos del grupo (S13):

"Anhídrido naftálico" (anhídrido de ácido 1,8-naftalendicarboxílico) (S13-1), que es conocido como protector desinfectante de simiente para maíz contra daños por herbicidas de tiocarbamato,

"Fenclorim" (4,6-dicloro-2-fenilpirimidina) (S13-2), que es conocido como protector para pretilaclor en arroz sembrado,

"Flurazol" (2-cloro-4-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxilato de bencilo) (S13-3), que es conocido como protector desinfectante de simiente para mijo contra daños por alaclor y metolaclor,

"CL 304415" (Nº de Reg. CAS 31541-57-8) (ácido 4-carboxi-3,4-dihidro-2H-1-benzopirran-4-acético) (S13-4) de la empresa American Cyanamid, que es conocido como protector para maíz contra daños por imidazolinonas,

"MG 191" (Nº de Reg. CAS 96420-72-3) (2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano) (S13-5) de la empresa Nitrokemia, que es conocido como protector para maíz,

"MG-838" (Nº de Reg. CAS 133993-74-5) (1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano-4-carboditioato de 2-propenilo) (S13-6) de la empresa Nitrokemia,

"Disulfoton" (S-2-etiltioetilfosforoditioato de O,O-dietilo) (S13-7),

"Dietolato" (fosforotioato de O,O-dietilo O-fenilo) (S13-8),

"Mefenato" (metilcarbamato de 4-clorofenilo) (S13-9).

S14) principios activos que, además de un efecto herbicida contra plantas perjudiciales, presentan también un efecto de protector en plantas de cultivo tales como arroz, tales como, por ejemplo,

"Dimepiperatos" o "MY-93" (piperidin-1-carbotioato de S-1-metilo-1-feniletilo), que es conocido como protector

para arroz frente a daños del herbicida molinato,

"Daimuron" o "SK 23" (1-(1-metil-1-feniletil)-3-*p*-tolil-urea), que es conocido como protector para arroz contra daños del herbicida imazosulfuron, "Cumiluron" = "JC-940" (3-(2-clorofenilmetil)-1-(1-metil-1-fenil-etil)urea, véase el documento JP-A-60087254), que es conocido como protector para arroz contra daños de algunos herbicidas,

"Metoxifenona" o "NK 049" (3,3'-dimetil-4-metoxi-benzofenona), que es conocido como protector para arroz contra daños de algunos herbicidas, "CSB" (1-bromo-4-(clorometilsulfonil)benceno) de Kumiai, (CAS N° de Reg. 54091-06-4), que es conocido como protector contra daños de algunos herbicidas en arroz.

S15) principios activos que se emplean prioritariamente como herbicidas, pero que presentan también efecto de protector en plantas de cultivo, por ejemplo,

ácido (2,4-diclorofenoxi)acético (2,4-D),

ácido (4-clorofenoxi)acético,

ácido (*R,S*)-2-(4-cloro-*o*-toliloxi)propionico (mecoprop),

ácido 4-((2,4-diclorofenoxi)butírico (2,4-DB),

ácido (4-cloro-*o*-toliloxi)acético (MCPA),

ácido 4-((4-cloro-*o*-toliloxi)butírico,

ácido 4-((4-clorofenoxi)butírico,

ácido 3,6-dicloro-2-metoxibenzoico (dicamba),

3,6-dicloro-2-metoxibenzoato de 1-(etoxicarbonil)etilo (Lactidicloro-etilo).

Algunos de los protectores ya son conocidos como herbicidas y, por tanto, además del efecto herbicida en plantas perjudiciales despliegan al mismo tiempo un efecto de protección en las plantas de cultivo.

Las proporciones en peso de (mezcla) herbicida a protector en general dependen de la dosis de la aplicación de herbicida y de la eficacia del respectivo protector y pueden variar dentro de amplios límites, por ejemplo, en el intervalo de 200:1 a 1:200, preferentemente 100:1 a 1:100, en particular 20:1 a 1:20. Los protectores se pueden formular de manera análoga a los compuestos de fórmula (I) o sus mezclas con otros herbicidas/pesticidas y facilitarse y aplicarse como formulación terminada o mezcla en tanque con los herbicidas.

Para la aplicación, las formulaciones existentes en forma disponible en el mercado se diluyen eventualmente de la manera habitual, por ejemplo, en polvos humectables de pulverización, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables en agua mediante agua. Las preparaciones en forma de polvo, los granulados de suelo y distribución así como las soluciones pulverizables antes de la aplicación ya no se diluyen habitualmente con otras sustancias inertes.

Con las condiciones externas tales como temperatura, humedad, el tipo de herbicida usado, entre otras, varía la dosis de aplicación requerida de los compuestos de fórmula general (I). Puede oscilar dentro de amplios límites, por ejemplo, entre 0,001 y 10,0 kg/ha o más sustancia activa, sin embargo, preferentemente se encuentra entre 0,005 y 5 kg/ha.

La presente invención se explica con más detalle mediante los siguientes ejemplos que, sin embargo, no limitan de ningún modo la invención.

A. Ejemplos de síntesis

4-amino-2-[(1*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilamino]pirimidin-5-carbonitrilo (Ejemplo: 1.30)

Se calientan 0,25 g (1,61 mmol) de 4-amino-2-cloro-pirimidin-5-carbonitrilo, 0,31 g (2,10 mmol) de (1*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-amina y 0,67 g (4,85 mmol) de carbonato de potasio en 3 ml de *N,N*-dimetilformamida durante 4 horas a 120 °C, la mezcla en bruto se concentra a alto vacío, la mezcla en bruto restante se aplica sobre gel de sílice y se purifica mediante cromatografía en columna con heptano/acetato de etilo como eluyente. Después de concentrar se obtienen 0,22 g de 4-amino-2-[(1*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-ilamino]pirimidin-5-carbonitrilo (punto de fusión 167,6 °C) (rendimiento del 48 % con el 95 % de pureza).

4-amino-2-[(1*R*)-2,3-dihidro-1*H*-inden-1-ilamino]-6-etilpirimidin-5-carbonitrilo (Ejemplo: 1.62)

Se calientan 0,25 g (1,09 mmol) de 4-amino-2-cloro-6-etilpirimidin-5-carbonitrilo, 0,19 g (1,31 mmol) de (1*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-amina y 0,45 g (3,28 mmol) de carbonato de potasio en 2 ml de *N,N*-dimetilacetamida en una cubeta cerrada en un microondas durante 30 minutos a 140 °C. La mezcla en bruto obtenida de este modo se aplica sobre gel de sílice y se purifica mediante cromatografía en columna con heptano/acetato de etilo como eluyente. Después de concentrar se obtienen 0,28 g de 4-amino-2-[(1*R*)-2,3-dihidro-1*H*-inden-1-ilamino]-6-etilpirimidin-5-carbonitrilo (rendimiento del 82 % con el 95 % de pureza).

4-amino-2-cloro-6-etilpirimidin-5-carbonitrilo

Con agitación se añaden gota a gota a 37,57 g de ciano[1-dicianometiliden)propil]azanida sódica aproximadamente al 80 % (178,76 mmol) lentamente 200 ml de ácido clorhídrico concentrado, de tal manera que la temperatura de la

reacción no supera los 30 °C. A continuación, la mezcla de reacción se pone sobre aproximadamente 600 ml de agua helada y se aísla el sólido formado mediante filtración con aspiración. Después del secado se obtienen 33,89 g de 4-amino-2-cloro-6-etilpirimidin-5-carbonitrilo con el punto de fusión 226,5 °C.

ciano[1-(dicianometiliden)propil]azanida sódica

- 5 A una solución de 32,38 g (33,4 ml, densidad= 0,97 g/l) de solución de metanolato sódico al 30 % y 100 ml de etanol se añaden por porciones 7,56 g de cianamida, la mezcla se agita durante aproximadamente 5 minutos a 25 °C; después en el intervalo de aproximadamente 25 minutos se añaden gota a gota 30 g (aproximadamente al 90 %, 180 mmol) de (1-etoxi-propiliden)-malononitrilo. La mezcla se agita durante dos horas, a continuación se eliminan mediante destilación sustancialmente los constituyentes volátiles, el residuo restante se recoge en cloruro de metileno. La fase de cloruro de metileno se separa y se emplean los 37,57 g restantes de ciano[1-(dicianometiliden)propil]azanida sódica con una pureza de aproximadamente el 80 % en la etapa posterior.

(1-etoxi-propiliden)-malononitrilo

- 15 Se calientan 33,03 g (0,5 mol) de dinitrilo de ácido malónico y 88,13 g (99,02 ml, 0,5 mol) de ortopropionato de trietilo durante dos horas a 100 °C, destilándose el etanol que se forma en ese tiempo a través de la cabeza. La mezcla de reacción se deja enfriar y se vierte sobre aproximadamente 500 ml de agua. La fase acuosa se extrae con acetato de etilo, entonces se seca la fase orgánica con sulfato sódico y después de la retirada por filtración del agente secante se concentra. Los 72 g de (1-etoxi-propiliden)-malononitrilo obtenidos de este modo (pureza de aproximadamente el 90 %) se emplean sin purificación adicional en la etapa posterior.

5-bromo-N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]pirimidin-2,4-diamina (Ejemplo: 1.67)

- 20 Se calientan 0,2 g (0,96 mmol) de 4-amino-5-bromo-2-cloropirimidina, 0,196 g (1,15 mmol) de (1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-amina y 0,339 g de carbonato potásico en 1,5 ml de N,N-dimetilacetamida en una cubeta cerrada en un microondas durante 60 minutos a 170 °C (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>). La mezcla en bruto obtenida de este modo se aplica sobre gel de sílice y se purifica mediante cromatografía en columna con heptano/acetato de etilo como eluyente. Después de concentrar se obtienen 0,13 g de 5-bromo-N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]pirimidin-2,4-diamina (rendimiento del 37 % con pureza del 95 %).

N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-5-[(trimetilsilil)etnil]pirimidin-2,4-diamina (Ejemplo: 1.98)

- 30 Una mezcla de 0,310 g (0,93 mmol) de 5-bromo-N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]pirimidin-2,4-diamina, 0,183 g (0,26 ml, 1,86 mmol) de (trimetilsilil)-acetileno, 0,050 g (0,05 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) y 0,01 g (0,05 mmol) de yoduro de cobre (I) en 2 ml de trietilamina se agitan durante 8 horas a 70 °C. Después del enfriamiento se aplica la mezcla en bruto obtenida de este modo sobre gel de sílice y se purifica mediante cromatografía en columna con heptano/acetato de etilo como eluyente. Después de concentrar se obtuvieron 0,04 g de 5-bromo-N2-N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-5-[(trimetilsilil)etnil]pirimidin-2,4-diamina (rendimiento del 10 % con pureza del 85 %).

N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-5-etnilpirimidin-2,4-diamina (Ejemplo: 1.119)

- 35 A una mezcla de 0,47 g (1,34 mmol) de N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-5-[(trimetilsilil)etnil]pirimidin-2,4-diamina (Ejemplo: 1.98) en 3 ml de metanol y 1 ml de agua se añaden 0,427 g de hidróxido potásico, se agita durante una hora a 25 °C, se concentra y se recoge la mezcla en agua. A continuación se extrae con acetato de etilo, se seca la fase orgánica y se concentra la misma. Después de la purificación de la mezcla en bruto mediante separación mediante cromatografía en columna se obtienen 0,139 g de N2-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-5-etnilpirimidin-2,4-diamina (rendimiento del 33 % con pureza del 90 %).

N2-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-il]-5-(trifluorometil)pirimidin-2,4-diamina (Ejemplo: 1.108)

- 45 A una solución de amoniaco metanólica enfriada a aproximadamente 5 °C (aproximadamente 8 moles de amoniaco en metanol) se añade con agitación 1,0 g de 2,4-dicloro-5-(trifluorometil)pirimidina (Aldrich; N° de pedido 684864), se deja calentar a 25 °C y se agita durante dos horas a la temperatura. La mezcla se concentra y se vierte sobre agua. Después de filtrar con aspiración se obtienen 0,56 g de una mezcla de 4-amino-2-cloro-5-trifluorometilpirimidina (aproximadamente el 45 %) y 2-amino-4-cloro-5-trifluorometilpirimidina (aproximadamente el 45 %).

- 50 A continuación se calienta en una cubeta cerrada una mezcla de 0,25 g del sólido que se ha obtenido anteriormente así como 0,224 g (1,47 mmol) de (R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftilamina y 0,35 g (2,53 mmol) de carbonato potásico en 1 ml de N-metilpirrolidona como disolvente en un aparato microondas (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>) durante 60 min a 160 °C. La mezcla en bruto se aplica sobre gel de sílice y después de separación mediante cromatografía en columna se obtienen 0,167 g de N2-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-il]-5-(trifluorometil)pirimidin-2,4-diamina con un punto de fusión de 130 - 131 °C (pureza del 95 %).

4-amino-2-[[[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]amino]-6-(2-fluorofenil)pirimidin-5-carbonitrilo (Ejemplo: 104)

5 Una mezcla de 0,20 g (0,76 mmol) de 4-amino-6-(2-fluorofenil)-2-(metilsulfanil)pirimidin-5-carbonitrilo y 0,5 g de (1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-amina en 1 ml de *N*-metilpirrolidona como disolvente se calienta en un aparato microondas (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>) durante 180 min a 180 °C. La mezcla en bruto se aplica sobre gel de sílice y después de separación mediante cromatografía en columna se obtienen 0,034 g de 4-amino-2-[[[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]amino]-6-(2-fluorofenil)pirimidin-5-carbonitrilo con un punto de fusión de 67 - 68 °C (12 % de rendimiento, pureza del 95 %).

Datos fisicoquímicos:

Compuesto	Descripción
1.17	sólido, punto de fusión: 166,4 °C; logp (HCOOH): 2,40; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,40 (a, 3H, CH ₃); 2,50 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,15 (t, 1H, CH); 5,25 (a, 2H, NH ₂); 5,45 (a, 1H, NH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H)
1.18	de tipo cera; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,45 (m, 2H, CH ₂); 1,85 (m, 2H, CH ₂); 1,85 y 2,10 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 2,40 (a, 3H, CH ₃); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 5,05 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 7,05 - 7,20 (m, 4H, Ar-H)
1.26	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,66; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 2,10 y 2,25 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 2,40 (a, 3H, CH ₃); 4,25 y 4,35 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 5,15 - 5,55 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,80 y 7,00 (respectivamente m, 3H, Ar-H)
1.30	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,92; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,85 (m, 2H, CH ₂); 1,85 y 2,05 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 5,05 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 7,05 - 7,20 (m, 4H, Ar-H); 8,30 (s, 1H, PIR-H)
1.35	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,35; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (a, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 5,20 - 5,90 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,20 (m, 3H, Ar-H); 8,00 (s, 1H, PIR-H)
1.37	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,32; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,85 (m, 2H, CH ₂); 1,85 y 2,05 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 4,95 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 7,05 - 7,20 (m, 4H, Ar-H); 8,40 (s, 1H, PIR-H)
1.39	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,86; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 0,25 (s, 9H, CH ₃); 1,85 (m, 2H, CH ₂); 1,85 y 2,05 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 5,05 - 5,40 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 7,05 - 7,30 (m, 4H, Ar-H); 8,00 (s, 1H, PIR-H)
1.46	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,39; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,45 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 4,85 - 5,60 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H)
1.51	de tipo cera; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,00 (s, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 2H, CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,10 (t, 1H, CH); 5,20 - 5,70 (a, 2H, NH ₂); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,10 (dd, 2H, Ar-H); 7,45 (s, 1H, PIR-H); 9,50 (d, 1H, NH);
1.56	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,20; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,15 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,25 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 4,80 (a, 2H, NH ₂); 5,00 (a, 1H, NH); 5,10 (t, 1H, CH); 6,95 - 7,05 (m, 3H, Ar-H); 7,80 (s, 1H, PIR-H);
1.61	sólido, punto de fusión: 126,9 °C; logp (HCOOH): 3,07; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 6H, 2*CH ₃); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,75 (m, 2H, CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,0 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 3H, Ar-H);
1.62	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,18; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (t, 3H, CH ₃); 1,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,65 (m, 3H, CH ₂ y 1H de CH ₂); 2,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 5,0 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 4H, Ar-H);

(continuación)

Compuesto	Descripción
1.63	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,49; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (t, 3H, CH ₃); 1,85 (m, 3H, CH ₂ y 1H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,60 - 2,90 (m, 4H, CH ₂ y 2*1 H de CH ₂); 5,0 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 4H, Ar-H);
1.64	de tipo cera; logp (HCOOH): 3,90; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 9H, 3*CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 3,15 (m, 1H, CH); 5,00 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 3H, Ar-H);
1.65	de tipo cera; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 6H, 2*CH ₃); 1,85 (m, 3H, CH ₂ y 1H de CH ₂); 2,60 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 - 3,20 (m, 3H, CH y 2*1H de CH ₂); 5,0 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 4H, Ar-H);
1.66	de tipo cera; logp (HCOOH): 3,34; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 6H, 2*CH ₃); 1,85 (m, 3H, CH ₂ y 1H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, 2*CH); 2,80 (m, 1H, CH); 5,0 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 4H, Ar-H);
1.67	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,30; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 3,15 (m, 1H, CH); 5,00 - 5,40 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,05 (m, 3H, Ar-H); 7,90 (s, 1H, PIR-H);
1.77	sólido; logp (HCOOH): 3,83; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,20 (t, 1H, CH); 5,50 (a, 2H, NH ₂); 6,25 (a, 1H, NH); 6,95 - 7,05 (m, 3H, Ar-H); 7,25 - 7,40 (m, 4H, Ar-H);
1.78	sólido; logp (HCOOH): 3,41; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,85 - 2,05 (a, 4H, CH ₂ , CH ₂); 2,40 (s, 3H, CH ₃); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 4,95 - 5,50 (m, 3H, CH, NH ₂); 6,40 (a, 1H, NH); 7,05 - 7,45 (m, 8H, Ar-H);
1.80	de tipo cera; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (m, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,20 - 5,70 (m, m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,60 (m, 1H, Ar-H); 7,75 (m, 1H, Ar-H); 8,15 (m, 2H, Ar-H);
1.81	de tipo cera; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,85 - 2,05 (a, 4H, CH ₂ , CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 5,20 - 5,70 (m, m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,60 (m, 1H, Ar-H); 7,75 (m, 1H, Ar-H); 8,15 (m, 2H, Ar-H);
1.84	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,63; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 0,75 (m, 2H, CH ₂); 1,45 (m, 2H, CH ₂); 1,55 (a, 3H, CH ₃); 1,85 (a, 3H, 1H de CH ₂ , CH ₂); 2,10 (a, 1H, 1H de CH ₂); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 5,20 - 5,70 (m, 4H, CH, NH ₂); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H);
1.85	de tipo cera; logp (HCOOH): 4,02; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,70 - 2,10 (a, 6H, 3*CH ₂); 2,20 - 2,50 (a, 2H, CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 5,30 (t, 1H, CH); 5,60 (a, 2H, NH ₂); 6,60 (a, 1H, NH); 6,95 - 7,10 (m, 7H, Ar-H);
1.86	de tipo cera; logp (HCOOH): 5,15; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (a, 2H, CH ₂); 1,80 - 2,10 (a, 6H, 3*CH ₂); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 5,20 - 5,70 (m, 4H, CH, NH ₂); 6,95 - 7,50 (m, 6H, Ar-H);
1.93	de tipo cera; logp (HCOOH): 3,31; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 0,75 (m, 2H, CH ₂); 1,25 (d, 3H, CH ₃); 1,50 (s, 3H, CH ₃); 1,55 (m, 2H, CH ₂); 2,30 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 4,20 (a, 2H, NH ₂); 4,70 (d, 1H, NH); 5,10 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,00 (dd, 2H, Ar-H);
1.94	de tipo cera; logp (HCOOH): 5,55; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 1,30 (m, 2H, CH ₂); 1,80 - 2,00 (m, 2H, CH ₂); 2,30 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 4,20 (a, 2H, NH ₂); 4,70 (d, 1H, NH); 5,10 - 6,20 (m, 4H, CH, NH ₂); 6,95 - 7,50 (m, 6H, Ar-H);

(continuación)

Compuesto	Descripción
1.96	sólido, punto de fusión: 132 - 133 °C; logp (HCOOH): 2,46; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,00 (t, 3H, CH ₃); 1,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 1,80 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (a, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 5,00 - 5,80 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95 - 7,10 (m, 4H, Ar-H);
1.97	sólido, punto de fusión: 124 - 125 °C; logp (HCOOH): 1,18; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,80 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 4,90 - 5,60 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,00 - 7,40 (m, 4H, Ar-H); 7,90 (a, 1H, PIR-H);
1.98	de tipo cera, logp (HCOOH): 2,28; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 0,25 (s, 9H, CH ₃); 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,2 - 5,4 (4H, NH ₂ , NH, CH); 7,00 (dd, 2H, Ar-H); 7,10 (s, 1H, Ar-H); 8,1 (a, 1H, PIR-H);
1.104	sólido, punto de fusión: 67 - 68 °C; logp (HCOOH): 3,65; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,40 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,20 (a, 1H, CH); 5,60 (a, 2H, NH ₂); 6,00 (a, 1H, NH) 7,00 - 7,60 (m, 7H, Ar-H);
1.105	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,27; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,30 (d, 3H, CH ₃); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 5,00 - 5,20 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,90 (a, 1H, PIR-H);
1.106	sólido; logp (HCOOH): 1,13; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,80 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 4,90 - 5,40 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,00 - 7,40 (m, 4H, Ar-H); 7,90 (a, 1H, PIR-H);
1.107	de tipo cera, logp (HCOOH): 2,11; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 1,60 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,0 - 5,6 (4H, NH ₂ , NH, CH); 7,00 (dd, 2H, Ar-H); 7,10 (s, 1H, Ar-H); 8,0 - 8,40 (a, 1H, PIR-H);
1.108	sólido, punto de fusión: 130,8 °C, logp (HCOOH): 1,64; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,85 (m, 2H, CH ₂); 1,85 y 2,05 (respectivamente m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 4,95 - 5,50 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 7,05 - 7,20 (m, 4H, Ar-H); 8,0 - 8,40 (a, 1H, PIR-H)
1.116	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,09; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,80 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 3,40 (s, 1H, 1H de CCH); 5,00 - 5,30 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,00 - 7,40 (m, 4H, Ar-H); 8,10 (a, 1H, PIR-H);
1.118	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,96; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,30 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,55 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 3,95 (s, 3H, CH ₃); 5,20 (a, 2H, NH ₂); 5,50 (a, 1H, CH); 6,80 (a, 1H, PIR-H); 6,95-7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,60 (a, 1H, NH);
1.119	sólido, punto de fusión: 99 °C; logp (HCOOH): 1,43; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 3,4 (s, 1H, C=CH); 5,2 - 5,4 (4H, NH ₂ , NH, CH); 7,00 (dd, 2H, Ar-H); 7,10 (s, 1H, Ar-H); 8,1 (a, 1H, PIR-H);
1.129	sólido, punto de fusión: 142 - 143 °C; logp (HCOOH): 2,43; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,00 (t, 3H, CH ₃); 1,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 1,80 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 5,00 - 5,80 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,15 - 7,30 (m, 4H, Ar-H); 8,00 y 8,30 (a, 1H, PIR-H);
1.184	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,58; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,30 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,40 (a, 3H, CH ₃); 2,55 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 5,20 - 5,80 (m, 3H, NH ₂ , CH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 8,40 - 8,80 (a, 2H, NH, PIR-H);
1.221	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,98; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,55 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 3,80 (s, 3H, OCH ₃); 5,20 - 5,40 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,85 - 7,30 (m, 7H, Ar-H); 8,10 (a, 1H, PIR-H);
1.222	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,04; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHz, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 4,50 (s, 2H, CH ₂ OH); 5,20 - 5,40 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 8,10 (a, 1H, PIR-H);

(continuación)

Compuesto	Descripción
1.237	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,50; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,80 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,65 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 5,00 - 5,60 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,15 - 7,25 (m, 4H, Ar-H); 8,10 y 8,30 (a, 1H, PIR-H);
1.247	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,60; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,50 (m, 2H, 2H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,10 (m, 1 H, CH); 6,00 (a, 2H, NH ₂); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,50 - 7,70 (m, 4H, Ar-H); 7,70 (s, 1H, NH); 7,90 (s, 1H, PIR-H);
1.248	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,71; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,50 (m, 2H, 2H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,15 (m, 1H, CH); 6,00 (a, 2H, NH ₂); 6,95 - 7,60 (m, 7H, Ar-H, NH); 7,95 (s, 1H, PIR-H);
1.249	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,73; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,00 (d, 6H, 2*CH ₃); 1,25 (d, 3H, CH ₃); 1,90 (m, 1H, CH(CH ₃) ₂); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,40 (d, 2H, CCH ₂); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,10 - 5,30 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,95 (s, 1H, PIR-H);
1.251	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,48; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,00 (t, 3H, CH ₃); 1,25 (d, 3H, CH ₃); 1,80 (m, 2H, CH ₂ CH ₃); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 4,55 (m, 1H, CHOH); 5,10-5,30 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 8,10 (a, 1H, PIR-H);
1.252	de tipo cera; logp (HCOOH): 1,59; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,10 (s, 3H, C(=O)-CH ₃); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 4,90 (s, 2H, CH ₂ O); 5,10 - 5,30 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95-7,10 (m, 3H, Ar-H); 8,10 (a, 1H, PIR-H);
1.255	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,03; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 2,10 - 2,65 (m, 10H); 2,50 (m, 3H); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 5,00 - 5,50 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,05 - 7,40 (m, 4H, Ar-H);
1.261*HCl	sólido, punto de fusión: 225 - 226 °C; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,50 (m, 2H, 2H de CH ₂); 3,10 (m, 1H, CH); 5,15 (t, 1H, CH); 6,00 (a, 2H, NH ₂); 6,90 (s, 1H, Ar-H); 7,00 - 7,10 (dd, 2H, Ar-H); 8,00 (s, 1H, PIR-H); 8,70 (s, 1H, NH);
1.266*HCl	sólido; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,50 (m, 2H, 2H de CH ₂); 2,75 (s, 3H, PIR-CH ₃); 3,10 (m, 1H, CH); 5,15 (t, 1H, CH); 6,20 (a, 2H, NH ₂); 6,90 (s, 1H, Ar-H); 7,00 - 7,10 (dd, 2H, Ar-H); 8,70 (s, 1H, NH);
1.273	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,57; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,85 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,25 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,30 (s, 3H, Ar-CH ₃); 2,40 (s, 3H, PIR-CH ₃); 2,60 (m, 2H, 2H de CH ₂); 5,10 - 5,90 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,90 - 7,00 (2s, 2H, Ar-H);
1.274	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,07; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 1,70 - 2,20 (m, 8H, 8H de CH ₂); 2,70 - 2,90 (m, 4H, 4H de CH ₂); 5,00 - 5,90 (m, 5H, NH ₂ , NH, 2*CH); 6,60 (m, 1H, PIR-H); 7,10-7,50 (m, 8H, Ar-H); 7,70 (a, 1H, C(=O)NH);
1.255	de tipo cera; logp (HCOOH): 2,03; RMN de 1H (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ en ppm): 2,10 - 2,65 (m, 10H); 2,50 (m, 3H); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 5,00 - 5,50 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,05-7,40 (m, 4H, Ar-H);

B. Ejemplos de formulación

a) Se obtiene un agente de espolvoreo mezclando 10 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y triturando en un molino de impacto.

5 b) Se obtiene un polvo humectable fácilmente dispersable en agua mezclando 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales, 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de potasio de ácido ligninosulfónico y 1 parte en peso de oleoilmetiltaurínico como humectante y dispersante y moliendo en un molino de clavijas.

10 c) Se obtiene un concentrado de dispersión fácilmente dispersable en agua mezclando 20 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales con 6 partes en peso de alquilfenolpoliglicoléter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanolpoliglicoléter (8 OE) y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico (intervalo de

ebullición, por ejemplo, de aproximadamente 255 a por encima de 277 °C) y moliendo en un molino de bolas de fricción hasta una finura por debajo de 5 micrómetros.

5 d) Se obtiene un concentrado emulsionable a partir de 15 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales, 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxietilado como emulsionante.

e) Se obtiene un granulado dispersable en agua mezclando

10 75 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales,
10 partes en peso de ligninosulfonato cálcico,
5 partes en peso de laurilsulfato sódico,
3 partes en peso de alcohol polivinílico y
7 partes en peso de caolín,

moliendo en un molino de clavijas y granulando el polvo en un lecho fluidizado mediante pulverización de agua como líquido de granulación.

f) También se obtiene un granulado dispersable en agua homogeneizando y pretriturando en un molino coloidal

15 25 partes en peso de un compuesto de fórmula (I) y/o sus sales,
5 partes en peso de 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato sódico
2 partes en peso de oleoilmetilaurinato sódico,
1 parte en peso de alcohol polivinílico,
20 17 partes en peso de carbonato de calcio y
50 partes en peso de agua,

moliendo a continuación en un molino de perlas y pulverizando y secando la suspensión obtenida de este modo en una torre de pulverización mediante una tobera unitaria.

C. Ejemplos biológicos

Descripción del ensayo

25 1. Efecto herbicida o compatibilidad con plantas de cultivo en pre-emergencia

30 Se siembran semillas de malezas o plantas de cultivo mono- o dicotiledóneas en macetas de fibra de madera en tierra arcillosa arenosa y se cubrieron con tierra. Los compuestos de acuerdo con la invención formulados en forma de polvos humectables (WP) o como concentrados de emulsión (EC) entonces se aplican como suspensión o emulsión acuosa con una cantidad de aplicación de agua de, calculada, 600 a 800 l/ha con adición del 0,2 % de humectante sobre la superficie de la tierra de cubierta. La dosificación de los compuestos de acuerdo con la invención está indicada en gramos por hectárea.

35 Después del tratamiento se colocan las macetas en un invernadero y se mantienen en buenas condiciones de crecimiento para las plantas de ensayo. La valoración visual de los daños en las plantas de ensayo se realiza después de un tiempo de ensayo de 3 semanas en comparación con controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas han muerto, 0 % de efecto = como las plantas de control).

En las siguientes tablas se usan las siguientes abreviaturas:

ABUTH:	<i>Abutilon theophrasti</i>	ALOMY:	<i>Alopecurus myosuroides</i>
AMARE:	<i>Amaranthus retroflexus</i>	AVEFA:	<i>Avena fatua</i>
CYPES:	<i>Cyperus esculentus</i>	ECHCG:	<i>Echinochloa crus-galli</i>
LOLMU:	<i>Lolium multiflorum</i>	MATIN:	<i>Matricaria inodora</i>
POLCO:	<i>Polygonum convolvulus</i>	SETVI :	<i>Setaria viridis</i>
STEME:	<i>Stellaria media</i>	VERPE:	<i>Veronica persica</i>
VIOTR:	<i>Viola tricolor</i>		

Tabla 1: efecto herbicida en pre-emergencia

Ejemplo N°	Dosificación	ABUTH	ALOMY	AMARE	AVEFA	CYPES	ECHCG	LOLMU	MATIN	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR
1.17	320	100	100	100	90	90	100	100	100		100	100	100	
1.18	320	100	100	100	90	80	100	100	100		100	100	100	
1.26	320	80	100	100	90		100	100	100	90	100	100	100	100
1.30	320		100	100	100		100	100	100	100	100	100	100	100
1.35	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.37	320			100			100	100	90			100	100	
1.46	320	80	80	100			90	100	100		100	100	100	100
1.46	320	100	80	100	80		100	100	100	100	100	100	100	100
1.51	320							100	100			100	100	
1.56	320		100	100	100	80	100	100	100	95	100	100	100	100
1.61	320		100	100	90		100		90	100	90	100	100	100
1.62	320		80				100	80	90		90	100	100	100
1.63	320		100	90	80		100		100	100	100	100	100	100
1.67	320	90	95	100	80		100	95	100	100	100	100	100	100
1.94	320		80	90	80		90	80	85	80	90	100	100	100
1.96	320		100	100	80		100	100	100	100	100	100	100	100
1.97	320		80	100			100	100	100		100	100	100	100
1.98	320			80		100			80		80	100	100	100
1.105	320	100	100	100	80	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1.106	320		100	100			90	100	90		100	100	100	
1.120	320		100	100	80		100	90	100	100	100	100	100	100
1.123	320			100			80		100			100	100	100
1.126	320			100			95		100	90	85	100	100	100
1.129	320	80	100	100	90	80	100	100	100	100	100	100	100	100

Como muestran los resultados, los compuestos de acuerdo con la invención presentan una eficacia de pre-emergencia herbicida buena frente a un amplio espectro de malas hierbas y malezas. Por ejemplo, los compuestos de la Tabla 1 tienen un efecto herbicida muy bueno frente a plantas perjudiciales tales como *Avena fatua*, *Stellaria media*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* y *Alopecurus myosuroides* en el procedimiento de pre-emergencia con una cantidad de aplicación de 0,32 kg y menos sustancia activa por hectárea. Los compuestos de acuerdo con la invención, por tanto, son adecuados en el procedimiento de pre-emergencia para combatir el crecimiento vegetal indeseado.

2. Efecto herbicida o compatibilidad con plantas de cultivo en post-emergencia

Se siembran semillas de malezas o plantas de cultivo mono- o dicotiledóneas en macetas de fibra de madera con fondo de arcilla arenosa, se cubren con tierra y se cultivan en un invernadero en condiciones de crecimiento buenas. De 2 a 3 semanas después de la siembra se tratan las plantas de ensayo en el estadio de una hoja. Los compuestos de acuerdo con la invención formulados en forma de polvos humectables (WP) o como concentrados de emulsión (EC) entonces se pulverizan como suspensión o emulsión acuosa con una cantidad de aplicación de agua de,

calculada, 600 a 800 l/h con adición del 0,2 % de humectante sobre las partes vegetales verdes. La dosificación de los compuestos de acuerdo con la invención está indicada en gramos por hectárea. Después de aproximadamente 3 semanas de tiempo de espera de las plantas de ensayo en el invernadero en condiciones de crecimiento óptimas se valora el efecto de las preparaciones visualmente en comparación con los controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas han muerto, 0 % de efecto = como las plantas de control).

Tabla 2: efecto herbicida en post-emergencia

Ejemplo N°	Dosificación	ABUTH	ALOMY	AMARE	AVEFA	ECHCG	LOLMU	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR
1.17	320	87	90	97	80	93	93	85	90	80	90	97	87	90
1.18	320	85	85	85		87	87	80	80		90	93	83	85
1.26	320	80	85	85		90	90	80	90	80		90	95	85
1.30	320		95	93	100	100	100	80		80	95	80	90	
1.35	320	95	100	93	95	100	90	85	90	90	95	95	95	90
1.37	320	85		100		80			80			95	90	80
1.46	320	100		100							90	90	90	90
1.56	320		85	80	80	90	93		90		80	80	90	
1.61	320	80				90						90	90	80
1.62	320		80			90	90		80	80		80	80	
1.63	320					80					80	80	80	
1.67	320	90	85	90		95	87	80	93	85	87	90	85	80
1.96	320	85	80	85		85	90		90	85	85	95	85	85
1.97	320			80		80	80				80	80	80	
1.105	320	90	80	90	90	100	90	90	90	80	90	90		80
1.106	320		80	80		90	90				80	80	80	
1.120	320	90		90		100		80	100	80	85	85	90	90
1.126	320					80			80			90	85	
1.129	320	90	90	90	80	100	90			90	90	90	90	80

Como muestran los resultados, los compuestos de acuerdo con la invención presentan una eficacia de post-emergencia herbicida buena frente a un amplio espectro de malas hierbas y malezas. Por ejemplo, los compuestos de la Tabla 2 tienen un efecto herbicida muy bueno frente a plantas perjudiciales tales como *Avena fatua*, *Stellaria media*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* y *Alopecurus myosuroides* en el procedimiento de post-emergencia con una cantidad de aplicación de 0,32 kg y menos sustancia activa por hectárea. Los compuestos de acuerdo con la invención, por tanto, son adecuados en el procedimiento de post-emergencia para combatir el crecimiento vegetal indeseado.

(I)

50

(C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquilitio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfoniloxi, haloalquil-(C₁-C₆)-sulfoniloxi, alquilitio-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquilitio-(C₁-C₆)-carbonilo, alquilitio-(C₁-C₆)-carboniloxi, haloalquilitio-(C₁-C₆)-carboniloxi, alquilitio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilitio-(C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquilitio-(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, alquilitio-(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi; aril-(C₄-C₁₄)-sulfonilo, arilitio (C₆-C₁₄), aril-(C₆-C₁₄)-sulfonilo, cicloalquilitio (C₃-C₈), alquenilitio (C₃-C₈), cicloalquenilitio (C₃-C₈), alquinilitio (C₃-C₆);

- los restos R^1 y R^2 forman juntos un grupo alquileo (C_2-C_6) que puede contener uno o varios átomos de oxígeno y/o azufre, pudiendo estar el grupo alquileo (C_2-C_6) mono- o polisustituido con halógeno y pudiendo ser los respectivos sustituyentes halógeno iguales o distintos; y

R^2 está seleccionado del grupo compuesto por

- hidrógeno, halógeno, hidroxil, ciano, nitro, amino, $\text{C}(\text{O})\text{OH}$, $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$;

- alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil-(C₁-C₆) carbonilo, alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, alquil-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₄);

- alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alquilo (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-haloalquilo (C₁-C₆);

- alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquenil-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquenil-(C₂-C₆)-carbonilo, alqueniloxi (C₂-C₆), haloalqueniloxi (C₂-C₆), alqueniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalqueniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo;

- alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), alquinil-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquinil-(C₂-C₆)-carbonilo, alquiniloxi (C₂-C₆), haloalquiniloxi (C₂-C₆), alquiniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo, haloalquiniloxi-(C₂-C₆)-carbonilo;

- tri-alkil-(C₁-C₆)-silil-alkinilo (C₂-C₆), di-alkil-(C₁-C₆)-silil-alkinilo (C₂-C₆), mono-alkil-(C₁-C₆)-silil-alkinilo (C₂-C₆); fenilsilil-alkinilo (C₂-C₆);

- arilo (C_6-C_{14}), ariloxi (C_6-C_{14}), aril- (C_6-C_{14}) -carbonilo y ariloxi- (C_6-C_{14}) -carbonilo, que pueden estar sustituidos respectivamente en la parte arilo con halógeno, alquilo (C_1-C_6) y/o haloalquilo (C_1-C_6);

- aril-(C₆-C₁₄)-alquilo (C₁-C₆), aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi (C₁-C₆), aril-(C₆-C₁₄)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, aril-(C₆-C₁₄)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, aril-(C₆-C₁₄)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;

- mono-(alquil-(C₁-C₆))-amino, mono-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino, di-(alquil-(C₁-C₆))-amino, di-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino, (alquil-(C₁-C₆))-haloalquil-(C₁-C₆))-amino, *N*-(alcanoil-(C₁-C₆))-amino, *N*-(haloalcanoil-(C₁-C₆))-amino, aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆), di-alquil-(C₁-C₆))-aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆);

- mono-(alquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, mono-(haloalquil-(C₁-C₆))-aminocarbonilo, di-(alquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, di-(haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, (alquil-(C₁-C₆))-haloalquil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, *N*-(alcanoil-(C₁-C₆))-amino-carbonilo, *N*-(haloalcanoil-(C₁-C₆))-aminocarbonilo, mono-(aril-(C₆-C₁₄))-amino-carbonilo, di-(aril-(C₆-C₁₄))-amino-carbonilo.

- alcoxi-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-carbonil-alcoxi (C₁-C₆);

- cicloalquilo (C₃-C₈) que puede estar sustituido eventualmente en el resto cicloalquilo con alquilo (C₁-C₆) y/o halógeno; cicloalcoxi (C₃-C₈), cicloalquil-(C₃-C₈)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquil-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalcoxi-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquil-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;

- cicloalquenilo (C₃-C₈), cicloalqueniloxi (C₃-C₈), cicloalquenil-(C₃-C₈)-alquilo (C₁-C₆), cicloalquenil-(C₃-C₈)-haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquenil-(C₃-C₈)-alcoxi (C₁-C₆), cicloalquenil-(C₃-C₈)-haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquenil-(C₃-C₈)-carbonilo, cicloalquenil-(C₃-C₈)-oxicarbonilo, cicloalquenil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carbonilo, cicloalquenil-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalqueniloxi-(C₃-C₈)-carboniloxi, cicloalquenil-(C₃-C₈)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenil-(C₃-C₈)-haloalquil-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenil-(C₃-C₈)-alcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi, cicloalquenil-(C₃-C₈)-haloalcoxi-(C₁-C₆)-carboniloxi;

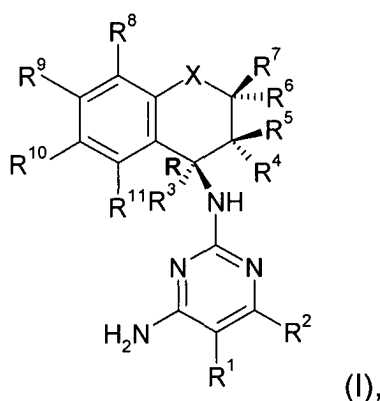
- hidroxi-alquilo (C₁-C₆), hidroxi-alcoxi (C₁-C₆), ciano-alcoxi (C₁-C₆), ciano-alquilo (C₁-C₆);

- alquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, alquiltio (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquiltio (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfinilo, alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfinil-alquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo (C₁-C₆), haloalquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfinil-alquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfinil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfonil-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquiltio-(C₁-C₆)-haloalquilo (C₁-C₆), haloalquil-(C₁-C₆)-sulfinil-haloalquilo (C₁-C₆), alquil-(C₁-C₆)-sulfoniloxi, haloalquil-(C₁-C₆)-sulfoniloxi, alquiltio-(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquiltio-(C₁-C₆)-carbonilo, alquiltio-(C₁-C₆)-carboniloxi, haloalquiltio-(C₁-C₆)-carboniloxi, alquiltio-(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquiltio-(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-carbonilo, alquiltio-(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-carboniloxi; aril-(C₄-C₁₄)-sulfonilo, ariltio (C₆-C₁₄), aril-(C₆-C₁₄)-sulfinilo, cicloalquiltio (C₃-C₈), alqueniltio (C₃-C₈), cicloalqueniltio (C₃-C₈), alquiniltio (C₃-C₆);

- los restos R¹ y R² forman juntos un grupo alquileo (C₂-C₆) que puede contener uno o varios átomos de oxígeno y/o azufre, pudiendo estar el grupo alquileo (C₂-C₆) mono- o polisustituido con halógeno y pudiendo ser los respectivos sustituyentes halógeno iguales o distintos; y

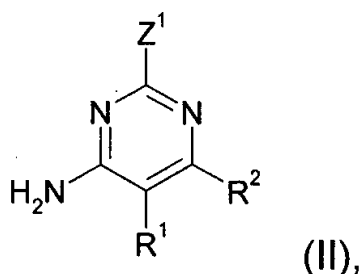
R³ está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆); R⁴ y R⁵ respectivamente, de forma independiente entre sí, están seleccionados del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), hidroxilo, alcoxi (C₁-C₆) y haloalcoxi (C₁-C₆); o los restos R⁴ y R⁵

- forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de tres a siete miembros;
 R^6 y R^7 respectivamente, de forma independiente entre sí, están seleccionados del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), arilo (C_6-C_{14}), ariloxi (C_6-C_{14}), aril- (C_6-C_{14}) -carbonilo y ariloxi- (C_6-C_{14}) -carbonilo; o los restos R^6 y R^7 forman juntos un grupo alquileo (C_2-C_7), que puede contener uno o varios átomos de oxígeno y/o azufre, pudiendo estar el grupo alquileo (C_2-C_7) mono-
 5 polisustituido con halógeno y pudiendo ser los respectivos sustituyentes halógeno iguales o distintos,
 R^8 , R^9 , R^{10} y R^{11} , independientemente entre sí, están seleccionados respectivamente del grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_6), alquil- (C_1-C_6) -carbonilo, alquiloxi- (C_1-C_6) -carbonilo, alquil- (C_1-C_6) -aminocarbonilo, di-alquil- (C_1-C_6) -aminocarbonilo, haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alquinilo
 10 (C_2-C_6), haloalquinilo (C_2-C_6), alquinil- (C_2-C_6) -carbonilo, haloalquinil- (C_2-C_6) -carbonilo, alquiniloxi (C_2-C_6), haloalquiniloxi (C_2-C_6), alquiniloxi- (C_2-C_6) -carbonilo y haloalquiniloxi- (C_2-C_6) -carbonilo y nitro;
 X representa un enlace, CH_2 y O;
 R^{12} y R^{13} respectivamente, de forma independiente entre sí, están seleccionados del grupo compuesto por
 15 hidrógeno, alquilo (C_1-C_6) y haloalquilo (C_1-C_6); y
 R^{14} está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6).
2. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados porque** el resto R^1 está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, $C(=O)NH_2$, NO_2 , alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), ciclopropilo (C_3-C_6), alcoxi (C_1-C_6), tioalquilo (C_1-C_6), alquiltio (C_1-C_6), alquinilo (C_2-C_6), mono-alquil- (C_1-C_6) -amino, di-alquil- (C_1-C_6) -amino y tri-alquil- (C_1-C_6) -silil- (C_2-C_6) -alquinilo.
- 20 3. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 2, **caracterizados porque** el resto R^2 se selecciona del grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, alquil- (C_1-C_6) -fenilo; arilo (C_6-C_{14}), que puede estar sustituido en el resto arilo con alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_6-C_{14}) y/o halógeno; aril- C_6 -haloalquilo (C_1-C_6), alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), alcoxi- (C_1-C_6) -alquilo (C_1-C_6); cicloalquilo (C_3-C_6), que puede estar
 25 sustituido en el resto cicloalquilo con alquilo (C_1-C_6), haloarilo (C_6-C_{14}) y/o halógeno; 1-alquil- (C_1-C_6) -ciclopropilo, 1-(alquil- (C_1-C_6) -aril- C_6)-ciclopropilo, 1-(monohalofenil)-ciclopropilo, 1-(dihalofenil)-ciclopropilo, mono-alquil- (C_1-C_6) -amino, di-alquil- (C_1-C_6) -amino, tioalquilo (C_1-C_6), alquiltio (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6) y amino.
4. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 2, **caracterizados porque** los restos R^1 y R^2 forman, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo de cinco o seis miembros que puede estar interrumpido por uno o dos heteroátomos seleccionados del grupo compuesto por oxígeno y azufre.
- 30 5. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4, **caracterizados porque** el resto R^3 es hidrógeno o alquilo (C_1-C_6).
6. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizados porque** los restos R^4 y R^5 respectivamente, de forma independiente entre sí, se seleccionan del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), hidroxilo, ciclopropilo y alcoxi (C_1-C_6).
- 35 7. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizados porque** los restos R^4 y R^5 forman, junto con el átomo de carbono al cual están unidos, un anillo de tres a siete miembros.
8. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 7, **caracterizados porque** los restos R^6 y R^7 , independientemente entre sí, están seleccionados del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6) y arilo (C_6-C_{14}).
- 40 9. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 8, **caracterizados porque** el resto R^8 está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6) y halógeno.
10. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizados porque** el resto R^9 está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno y alquilo (C_1-C_6).
- 45 11. Compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 10, **caracterizados porque** el resto R^{10} está seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), di-alquil- (C_1-C_6) -amino, halógeno, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquil- (C_1-C_6) -alquinilo (C_2-C_6), alcoxi- (C_1-C_6) -alquil- (C_1-C_6) -alquinilo (C_2-C_6); ciano, alcoxi- (C_1-C_6) -carbonilo y aminocarbonilo.
12. Compuesto de fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 11, **caracterizado porque** el resto R^{11} se selecciona del grupo compuesto por hidrógeno y alquilo (C_1-C_6).
- 50 13. Procedimiento para la preparación de compuestos ópticamente activos de fórmula general (I)

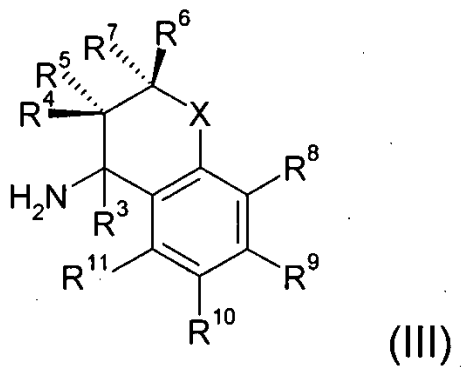


en la que los restos R^1 a R^{11} y X presentan los significados de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 10, **caracterizado porque**

(1) se hace reaccionar un compuesto de fórmula general (II)



en la que R^1 y R^2 presentan un significado de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 11 y Z^1 representa un resto sustituible o un grupo saliente tal como, en particular, cloro, triclorometilo, alquil-(C₁-C₄)-sulfonilo, fenil-alquil-(C₁-C₄)-sulfonilo no sustituido o sustituido o alquil-(C₁-C₄)-fenilsulfonilo, con una amina de fórmula general (III) o una sal de adición de la misma



(2) se hacen reaccionar derivados de fórmula general (I) con R^1 , R^2 o R^{10} = halógeno, en particular yodo o bromo, con acetileno o acetileno protegido con trimetilsililo con catálisis con metal de transición, en particular con catálisis de cloruro de bis-(trifenilfosfina)-paladio (II) en disolventes próticos o apróticos y adición de base a temperaturas entre 20 y 150 °C para dar compuestos de fórmula (I) con R^1 , R^2 o R^{10} = alquínilo;

(3) se saponifican derivados de fórmula general (I) con R^1 = CN catalizados por ácidos o bases y los ácidos carboxílicos obtenidos de este modo, según procedimientos conocidos, se transforman en cloruros de ácido y estos a su vez en amidas;

(4) se hacen reaccionar derivados de fórmula general (I) con R^2 = halógeno en disolventes próticos o apróticos y adición de base a temperaturas entre 100 y 200 °C mediante reacción con alcoholatos o aminas para dar compuestos de fórmula general (I) con R^2 = alcoxilalquilo o aminoalquilo o diaminoalquilo.

14. Agente herbicida o regulador del crecimiento vegetal, **caracterizado porque** contiene uno o varios compuestos de fórmula general (I) o sus sales de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 12.

15. Procedimiento para combatir plantas perjudiciales o para la regulación del crecimiento de plantas, **caracterizado porque** se aplica una cantidad eficaz de uno o varios compuestos de fórmula general (I) o de sus sales de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 12 sobre plantas, partes de plantas, semillas de plantas o sobre una superficie

de cultivo.

16. Uso de compuestos de fórmula general (I) o sus sales de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 12 como herbicidas o reguladores del crecimiento vegetal.

5 17. Uso de acuerdo con la reivindicación 16, **caracterizado porque** los compuestos de fórmula general (I) o sus sales se emplean para combatir plantas perjudiciales o para la regulación del crecimiento de plantas en cultivos de plantas útiles o decorativas.

18. Uso de acuerdo con la reivindicación 17, **caracterizado porque** las plantas de cultivo son plantas de cultivo transgénicas.

10 19. Uso de acuerdo con la reivindicación 17 o 18, **caracterizado porque** las plantas de cultivo están seleccionadas de cultivos de plantaciones.