

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **3 018 232**

51 Int. Cl.:

**C07D 401/04** (2006.01)

**A01N 43/56** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **02.11.2021 PCT/EP2021/080357**

87 Fecha y número de publicación internacional: **12.05.2022 WO22096445**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **02.11.2021 E 21798727 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.01.2025 EP 4240725**

54 Título: **Derivados de ácido {[1(fenil)5(heteroaril)1hpirazol3il]oxi}acético y sus sales y agentes protectores de plantas útiles o cultivos que los contienen y procedimientos para su preparación, su uso y agentes protectores de plantas útiles o cultivos que los contienen**

30 Prioridad:

**05.11.2020 EP 20206047**

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

**14.05.2025**

73 Titular/es:

**BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (100.00%)  
Kaiser-Wilhelm-Allee 1  
51373 Leverkusen, DE**

72 Inventor/es:

**MÜLLER, THOMAS;  
BUSCATO, ESTELLA;  
HELMKE, HENDRIK;  
JAKOBI, HARALD;  
HOFFMANN, MICHAEL GERHARD y  
DITGEN, JAN**

74 Agente/Representante:

**GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo**

ES 3 018 232 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 ácido {[1-(fenil)-5-(heteroaril)-1H-pirazol-3-il]oxi}acético y sus sales y agentes protectores de plantas útiles o cultivos que los contienen y procedimientos para su preparación, su uso y agentes protectores de plantas útiles o cultivos que los contienen

5 La presente invención se refiere a compuestos y agentes fitosanitarios que contienen compuestos específicos como protectores para reducir los efectos fitotóxicos de los agroquímicos, en particular de los herbicidas. En particular, la invención se refiere a derivados de ácido {[1-(fenil)-5-(heteroaril)-1H-pirazol-3-il]oxi}acético, así como sus sales como protectores y procedimientos para su preparación.

10 Al combatir organismos indeseables en cultivos agrícolas y forestales de plantas útiles con plaguicidas, las plantas útiles a menudo resultan más o menos dañadas por los plaguicidas utilizados, tales como herbicidas, insecticidas, fungicidas y otros. Este efecto secundario fitotóxico indeseable se produce en un grado particular cuando se utilizan numerosos herbicidas –y allí principalmente cuando se aplican después de la emergencia– en cultivos de plantas útiles como maíz, arroz o cereales. Mediante el uso de los llamados "protectores" o "antídotos", las plantas útiles pueden protegerse en algunos casos contra las propiedades fitotóxicas de los plaguicidas sin que la acción plaguicida contra los organismos nocivos se vea disminuida o alterada significativamente. En algunos casos, incluso se ha observado una acción pesticida mejorada contra organismos nocivos como las malezas en presencia de protectores.

Los compuestos que hasta ahora se han conocido como protectores pertenecen a un gran número de clases de estructuras químicas diferentes, en los que su idoneidad para el uso de protectores depende generalmente también de las estructuras químicas de los plaguicidas y de los cultivos de plantas útiles.

20 Los efectos protectores de compuestos del grupo de derivados de ácidos fenoxi- o heteroariloxialcanocarboxílicos, cuando estos compuestos se utilizan en combinación con herbicidas, se conocen desde hace mucho tiempo. Ejemplos de tales compuestos son MCPA y compuestos similares, que también son herbicidamente activos contra plantas dañinas, o cloquintocet-mexilo.

25 También se conocen protectores del grupo de derivados de ésteres de ácidos heteroaril-carboxílicos N-fenil-sustituídos con varios heteroátomos en el compuesto heteroaromático. Ejemplos de tales protectores son los protectores mefenpir-dietilo e isoxadifeno-etilo usados en productos comerciales.

30 El uso de derivados de ácidos carboxílicos aromáticos sustituidos con hidroxilo se conoce por el documento WO 2004/084631. Los derivados especiales del ácido salicílico se describen como protectores en el documento WO 2005/015994. Estos son particularmente adecuados para su uso como protectores en cultivos de maíz y soja. Además, del documento WO 2005/112630 se conocen los derivados de 1,2-dihidroquinoxalin-2-ona y del documento WO 2008/131860 se conocen la piridona carboxamidas como protectores.

Las sustancias activas de la clase química de los derivados de ácido 1,5-difenil-1H-pirazol-3-carboxílico así como derivados de ácido 1,5-difenil-1H-pirazol-3-carboxílico con propiedades activas en plantas como protectores se conocen del documento WO 2006/040016.

35 Las sustancias activas de la clase química de los derivados del ácido 1,5-difenil-1H-pirazol-3-carboxílico con propiedades activas en plantas como protectores se conocen también del documento EP268554.

40 Las sustancias activas de la clase química de los derivados de ácido [(1,5-difenil-1H-pirazol-3-il)oxi]acético con propiedades fungicidas se describen en Molecules 2014, 19(1), 1302-1316, J. of Heterocyclic Chemistry 2012, 49(6) 1370-1375, Acta Crystallographica, Section E: Structure Reports Online 2012, 68(8), o2419, Acta Crystallographica, Section E: Structure Reports Online 2012, 68(1), o123, J. of Heterocyclic Chemistry 2010, 47(4) 897-902. Los derivados agroquímicos antibacterianos del ácido [(1,5-difenil-1H-pirazol-3-il)oxi]acético se describen en los documentos CN102093344 y CN101284815.

45 Varios documentos describen derivados de ácido [(1,5-difenil-1H-1,2,4-triazol-3-il)oxi]acético con propiedades medicinales. De los documentos WO2008073825 y DE2828529, se conocen los derivados de ácido [(1,5-difenil-1H-1,2,4-triazol-3-il)oxi]acético.

La síntesis de los derivados del ácido [(1,5-difenil-1H-pirazol-3-il)oxi]acético se describe en European Journal of Organic Chemistry 2011, 27, 5323-5339.

La síntesis de los derivados sustituidos del ácido {[1-(fenil)-5-(2-tienil)-1H-1,2,4-triazol-3-il]oxi}acético se describen en el documento WO 2008/073825 como intermedios de moduladores de LXR y FXR para la aplicación médica.

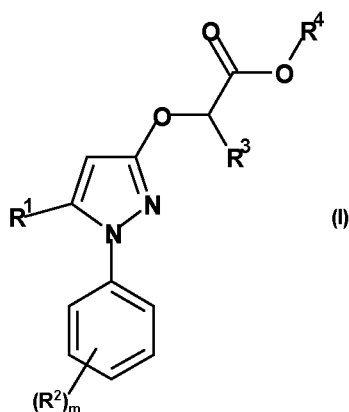
50 Cuando se utilizan protectores para proteger los cultivos de los daños causados por plaguicidas, se ha demostrado que los protectores conocidos pueden tener desventajas en muchos casos. Estas incluyen:

- las propiedades de protección de cultivos no son suficientes,

- en combinación con cierto herbicida, el espectro de cultivos en los que se va a utilizar el protector/herbicida no es suficientemente grande,
- un protector determinado solo es combinable con pocos herbicidas,
- el uso de protectores aumenta la cantidad de aplicación por aplicar y la cantidad de excipientes de formulación y con ello puede ocasionar problemas técnicos en la aplicación.

Por las razones mencionadas, existe una mayor necesidad de proporcionar compuestos alternativos con un efecto protector.

Son objeto de la invención los nuevos compuestos protectores de plantas útiles de la fórmula general (I) o sus sales,



para la reducción de efectos fitotóxicos de plaguicidas, en especial de herbicidas, sobre plantas útiles o de cultivo, en donde

$R^1$  representa heteroarilo, salvo tienilo, en los que el radical de heteroarilo no está sustituido o está sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo (C1–C6), alquenilo (C2–C6), alquinilo (C2–C6), cicloalquilo (C3–C8), cicloalquenilo (C3–C8), alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>, en los que los últimos siete radicales mencionados no están sustituidos o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>,

$R^2$  representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo (C1–C6), alquenilo (C2–C6), alquinilo (C2–C6), cicloalquilo (C3–C8), cicloalquenilo (C3–C8), alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>, en los que los últimos siete radicales mencionados no están sustituido o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>,

$R^3$  representa hidrógeno y alquilo (C1–C6),

$R^4$  representa hidrógeno, alquilo (C1–C18), haloalquilo (C1–C18), cianoalquilo (C1–C18), alquenilo (C2–C18), alquinilo (C2–C18), cicloalquilo (C3–C12), cicloalquenilo (C3–C12), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1–C18)–alquilo (C1–C18), haloalcoxi (C1–C18)–alquilo (C1–C18), alcoxi (C1–C18)–haloalquilo (C1–C18), alquil (C1–C18)–tio–alquilo (C1–C18), haloalquil (C1–C18)–tio–alquilo (C1–C18), haloalquenilo (C2–C18), haloalquinilo (C2–C18), heterociclil–alquilo (C1–C18), aril–alquilo (C1–C18), cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C18), alcoxi (C1–C18)–carbonil–alquilo (C1–C18) y alcoxi (C1–C18)–carbonil–cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C18), o

un radical de la fórmula  $-NR^aR^b$  o  $-N=CR^cR^d$ ,

en el que en los últimos 2 radicales mencionados cada uno de los radicales  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  y  $R^d$  de modo independiente entre sí, hidrógeno, alquilo (C1–C4), alquenilo (C2–C4), alquinilo (C2–C4), bencilo, bencilo sustituido, fenilo o fenilo sustituido

o  $R^a$  y  $R^b$  pueden formar, junto con el átomo de N, un heterociclo de 3 a 8 miembros, que puede contener uno o dos átomos del heteroanillo adicionales del grupo N, O y S y que no está sustituido o que está sustituido con uno o más radicales del grupo alquilo (C1–C4) y haloalquilo (C1–C4),

o  $R^c$  y  $R^d$  forman junto con el átomo de C un radical carbocíclico o heterocíclico de 3 a 8 miembros, que puede contener 1 a 3 átomos del heteroanillo del grupo N, O y S, en el que el radical carbocíclico o heterocíclico no está sustituido o está sustituido con uno o más radicales del grupo alquilo (C1–C4) y haloalquilo (C1–C4),

m significa un número de 0 a 5,

y

p significa 0, 1 o 2.

5 Los compuestos de la fórmula general (I) pueden formar sales por adición de un ácido orgánico o inorgánico adecuado, tal como, por ejemplo, ácidos minerales, tales como, por ejemplo, HCl, HBr, H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> o HNO<sub>3</sub>, o ácidos orgánicos, por ejemplo, ácidos carboxílicos, como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido láctico o ácido salicílico o ácidos sulfónicos, como por ejemplo ácido p-toluensulfónico, a un grupo básico, como por ejemplo amino, alquilamino, dialquilamino, piperidino, morfolino o piridinio. Estas sales contienen entonces la base conjugada del ácido como anión. Los sustituyentes adecuados que están presentes en forma desprotonizada, como por ejemplo

10 ácidos sulfónicos, ciertas sulfonamidas o ácidos carboxílicos, pueden formar sales internas con a su vez grupos protonables, tales como grupos amino. La formación de sales también se puede dar por la acción de una base sobre compuestos de la fórmula general (I). Las bases adecuadas son, por ejemplo, aminas orgánicas, como trialkilaminas, morfolina, piperidina y piridina así como hidróxidos de amonio, de metales alcalinos o alcalinotérreos, carbonatos de amonio y de metales alcalinos o alcalinotérreos y bicarbonatos de amonio, de metales alcalinos o alcalinotérreos, en particular hidróxidos de sodio y de potasio, carbonatos de sodio y de potasio y bicarbonatos de sodio y de potasio. Las sales son compuestos en los que el hidrógeno ácido se sustituye por un catión apropiado para la agricultura, por ejemplo sales metálicas, en particular sales de metales alcalinos o sales de metales alcalinotérreos, en particular sales de sodio y sales de potasio, o también sales de amonio, sales con aminas orgánicas o sales de amonio cuaternarias, por ejemplo con cationes de la fórmula [NR<sup>I</sup>R<sup>II</sup>R<sup>III</sup>R<sup>IV</sup>]<sup>+</sup>, donde R<sup>I</sup> a R<sup>IV</sup> independientemente uno de otro representan un

20 radical orgánico, en particular alquilo, arilo, arilalquilo o alquilarilo. También se consideran las sales de alquilsulfonio y alquilsulfoxonio, tales como sales trialkil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonio y trialkil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfoxonio.

A continuación, los compuestos usados según la invención de la fórmula (I) y sus sales se denominan "compuestos de la fórmula general (I)".

Son un objeto preferido de la invención los compuestos de la fórmula general (I), en donde

25 R<sup>1</sup> representa heteroarilo, salvo tienilo, en el que el radical de heteroarilo no está sustituido o está sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalqueno (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, en el que los últimos siete radicales mencionados no están sustituido o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>p</sub>,

30 R<sup>2</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalqueno (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, en el que los últimos siete radicales mencionados no están sustituidos o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>p</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

35 R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>), cicloalqueno (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>), arilo, heteroarilo, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-tio-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), haloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-tio-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), haloalqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>), haloalquino (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>), heterociclil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), aril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-carbonil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>) y alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)-carbonil-cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>),

40

m significa un número de 0 a 4,

y

p significa 0, 1 o 2.

Son un objeto de la invención muy particularmente preferido los compuestos de la fórmula general (I), en donde

45 R<sup>1</sup> representa heteroarilo, salvo tienilo, en el que el radical de heteroarilo no está sustituido o está mono- o polisustituido con halógeno, ciano, metilo, etilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

R<sup>2</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, metilo, etilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

50 R<sup>3</sup> representa hidrógeno, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y CH<sub>3</sub>,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo (C1-C12), haloalquilo (C1-C12), cianoalquilo (C1-C12), alquenoilo (C2-C12), alquinilo (C2-C12), cicloalquilo (C3-C12), cicloalquenoilo (C3-C12), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1-C12)-alquilo (C1-C12), haloalcoxi (C1-C12)-alquilo (C1-C12), alcoxi (C1-C12)-haloalquilo (C1-C12), alquil (C1-C12)-tio-alquilo (C1-C12), haloalquil (C1-C12)-tio-alquilo (C1-C12), haloalquenoilo (C2-C12), haloalquinilo (C2-C12), heterociclil-alquilo (C1-C12), aril-alquilo (C1-C12), cicloalquil (C3-C12)-alquilo (C1-C12), alcoxi (C1-C12)-carbonil-alquilo (C1-C12) y alcoxi (C1-C12)-carbonil-cicloalquil (C3-C12)-alquilo (C1-C12),

m representa un número de 0, 1, 2 o 3,

y

p significa 0, 1 o 2.

Son un objeto de la invención especialmente preferido los compuestos de la fórmula general (I), en donde

R<sup>1</sup> representa piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirazin-3-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo, 1,2,4-triazin-5-ilo, 1,2,4-triazin-6-ilo, 1,2,3-triazin-4-ilo, 1,2,3-triazin-5-ilo, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1,3-oxazol-2-ilo, 1,3-oxazol-4-ilo, 1,3-oxazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, 1,3-tiazol-2-ilo, 1,3-tiazol-4-ilo, 1,3-tiazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo; 1H-pirrol-2-ilo; 1H-pirrol-3-ilo; furan-2-ilo; furan-3-ilo; 1H-imidazol-1-ilo; 1H-imidazol-2-ilo; 1H-imidazol-4-ilo; 1H-imidazol-5-ilo; 1H-pirazol-1-ilo; 1H-pirazol-3-ilo; 1H-pirazol-4-ilo; 1H-pirazol-5-ilo, 1H-1,2,3-triazol-1-ilo, 1H-1,2,3-triazol-4-ilo, 1H-1,2,3-triazol-5-ilo, 2H-1,2,3-triazol-2-ilo, 2H-1,2,3-triazol-4-ilo, 1H-1,2,4-triazol-1-ilo, 1H-1,2,4-triazol-3-ilo, 4H-1,2,4-triazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,2,3-oxadiazol-4-ilo, 1,2,3-oxadiazol-5-ilo, 1,2,5-oxadiazol-3-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,5-tiadiazol-3-ilo, 1,2,5-tiadiazol-3-ilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 1,2,3-tiadiazol-5-ilo, que no está sustituido o que está mono- o polisustituido con halógeno, ciano, metilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

R<sup>2</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, CN, metilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno y CH<sub>3</sub>,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo (C1-C10), haloalquilo (C1-C10), cianoalquilo (C1-C10), alquenoilo (C2-C10), alquinilo (C2-C10), cicloalquilo (C3-C9), cicloalquenoilo (C3-C9), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1-C10)-alquilo (C1-C10), haloalcoxi (C1-C10)-alquilo (C1-C10), alcoxi (C1-C10)-haloalquilo (C1-C10), alquil (C1-C10)-tio-alquilo (C1-C10), haloalquil (C1-C10)-tio-alquilo (C1-C10), haloalquenoilo (C2-C18), haloalquinilo (C2-C18), heterociclil-alquilo (C1-C10), aril-alquilo (C1-C10), cicloalquil (C3-C9)-alquilo (C1-C10), alcoxi (C1-C10)-carbonil-alquilo (C1-C10) y alcoxi (C1-C10)-carbonil-cicloalquil (C3-C9)-alquilo (C1-C10),

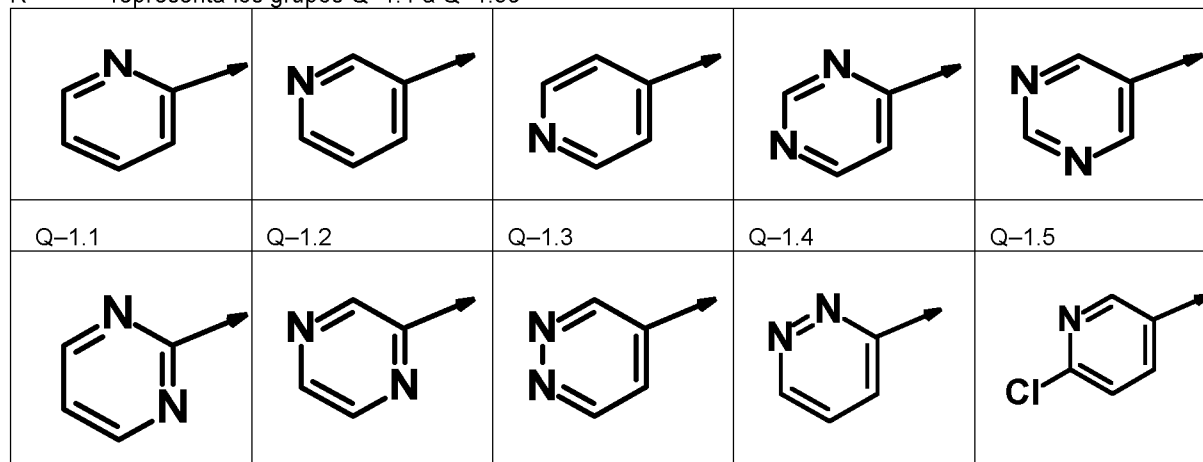
m representa un número de 0, 1, 2 o 3,

y

p significa 0, 1 o 2.

Son un objeto de la invención muy especialmente preferido los compuestos de la fórmula general (I), en donde

R<sup>1</sup> representa los grupos Q-1.1 a Q-1.59



ES 3 018 232 T3

Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20
Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25
Q-1.35				
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45

Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53	Q-1.54	Q-1.55
Q-1.56	Q-1.57	Q-1.58	Q-1.59	

R<sup>2</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, n-pentilo, fenilo, bencilo, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph), 2-metoxietilo, tetrahidrofuran-2-il-metilo, tetrahidrofuran-3-il-metilo, tetrahidropiran-2-il-metilo, tetrahidropiran-3-il-metilo, tetrahidropiran-4-il-metilo, metilpropionat-3-ilo, etilpropionat-3-ilo, metilacet-2-ilo, etilacet-2-ilo, metilpivalat-2-ilo, etilpivalat-3-ilo, metil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2,2-dimetilpropanoat-3-ilo, etil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2-propanoat-2-ilo, etil-2-propanoat-2-ilo, metil-acetat-2-ilo, etil-acetat-2-ilo, metil-1-metilciclopropanocarboxilat-2-ilo, etil-1-metilciclopropanocarboxilat-2-ilo, 2-(dimetilamino)etilo, oxetan-3-ilo, (3-metiloxetan-3-il)metilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, ciclopropilmetilo, 1-ciclopropil-etilo, (1-metil-ciclopropil)-metilo, (2,2-diclorociclopropil)-metilo, (2,2-dimetil-ciclopropil)-metilo, alilo, propargil (prop-2-in-1-il), 2-cloroprop-2-en-1-ilo, 3-fenilprop-2-in-1-ilo, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ilo, 3,3-dicloro-2-fluor-prop-2-en-1-ilo, metilprop-2-in-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 4-cloro-but-2-in-1-ilo, 3-metil-but-2-en-1-ilo, 3-metil-but-1-en-1-ilo, 1-(2E)-1-metilbut-2-en-1-ilo, (E)-pent-3-en-2-ilo o (Z)-pent-3-en-2-ilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, heptan-2-ilo, iso-butilo, 1,3-dioxolan-2-ilmetilo o 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-metilo,

m representa un número de 0, 1, 2 o 3.

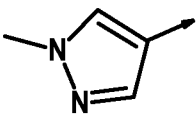
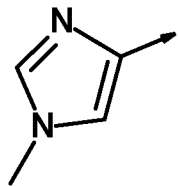
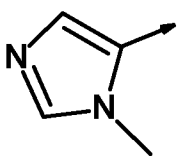
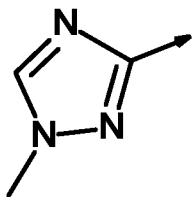
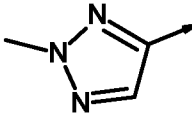
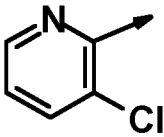
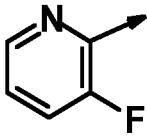
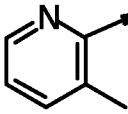
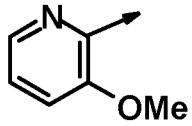
20 Son un objeto de la invención extremadamente preferido en especial los compuestos de la fórmula general (I), en donde

R<sup>1</sup> representa los grupos Q-1.1 a Q-1.59

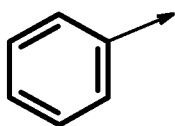
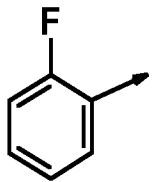
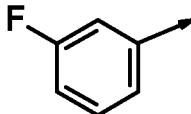
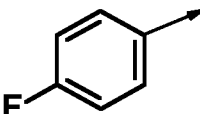
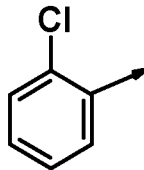
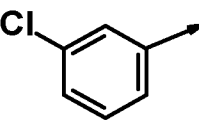
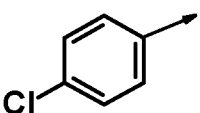
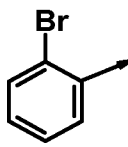
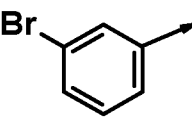
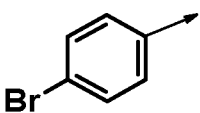
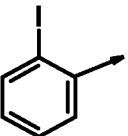
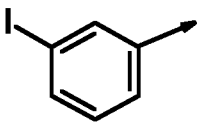
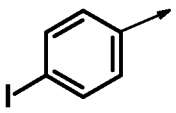
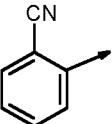
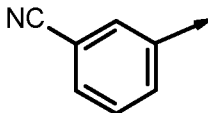
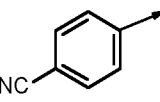
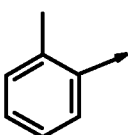
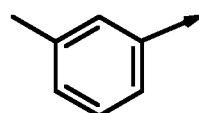
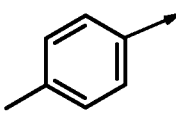
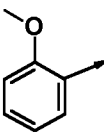
Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5

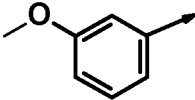
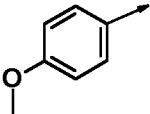
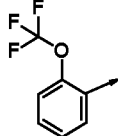
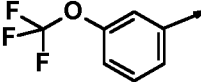
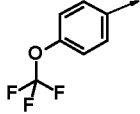
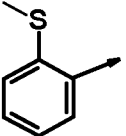
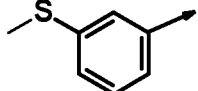
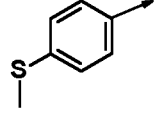
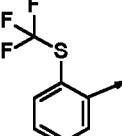
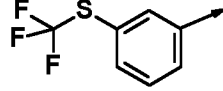
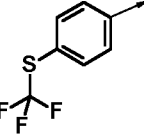
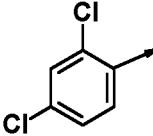
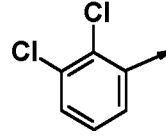
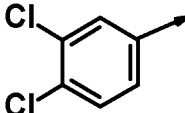
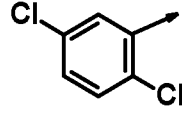
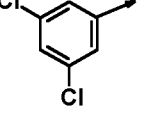
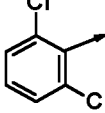
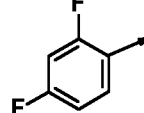
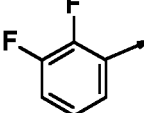
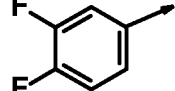
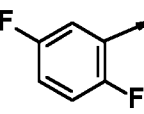

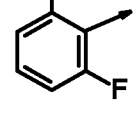
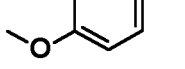
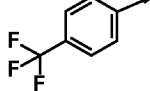
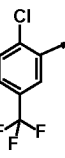
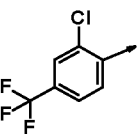
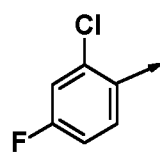
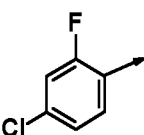
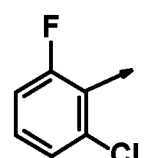
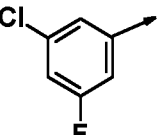
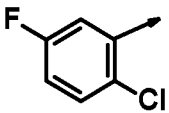
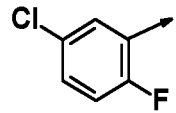
ES 3 018 232 T3

Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20
Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25
Q-1.35				
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45

Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50
				
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53	Q-1.54	Q-1.55
				
Q-1.56	Q-1.57	Q-1.58	Q-1.59	

y (R<sup>2</sup>)<sub>m</sub>-fenilo representa los grupos Q-2.1 a Q-2.53

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10
				
Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20

				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
				
Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
				
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40
				
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45
				
Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
				

Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53
--------	--------	--------

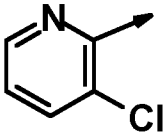
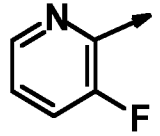
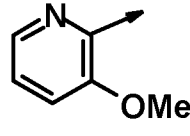
R<sup>3</sup> representa hidrógeno,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, n-pentilo, fenilo, bencilo, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph), 2-metoxietilo, tetrahidrofuran-2-il-metilo, tetrahidrofuran-3-il-metilo, tetrahidropiran-2-il-metilo, tetrahidropiran-3-il-metilo, tetrahidropiran-4-il-metilo, metilpropionat-3-ilo, etilpropionat-3-ilo, metilacetat-2-ilo, etilacetat-2-ilo, metilpivalat-2-ilo, etilpivalat-3-ilo, metil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2,2-dimetilpropanoat-3-ilo, etil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2-propanoat-2-ilo, etil-2-propanoat-2-ilo, metilacet-2-ilo, etilacet-2-ilo, metil-1-metilciclopropanocarboxilat-2-ilo, etil-1-metilciclopropanocarboxilat-2-ilo, 2-(dimetilamino)etilo, oxetan-3-ilo, (3-metiloxetan-3-il)metilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, ciclopropilmetilo, 1-ciclopropil-etilo, (1-metil-ciclopropil)-metilo, (2,2-diclorociclopropil)-metilo, (2,2-dimetil-ciclopropil)-metilo, alilo, propargil (prop-2-in-1-il), 2-cloroprop-2-en-1-ilo, 3-fenilprop-2-in-1-ilo, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ilo, 3,3-dicloro-2-fluor-prop-2-en-1-ilo, metilprop-2-in-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 4-cloro-but-2-in-1-ilo, 3-metil-but-2-en-1-ilo, 3-metil-but-1-en-1-ilo, 1-(2E)-1-metilbut-2-en-1-ilo, (E)-pent-3-en-2-ilo o (Z)-pent-3-en-2-ilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, heptan-2-ilo, iso-butilo, 1,3-dioxolan-2-ilmetilo o 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-metilo.

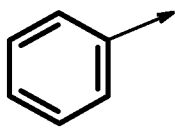
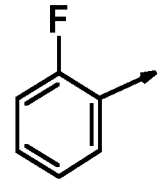
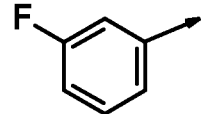
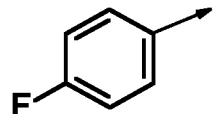
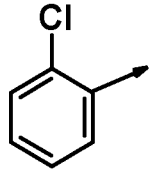
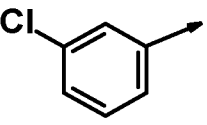
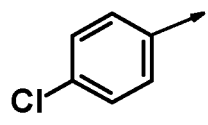
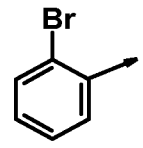
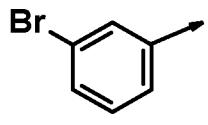
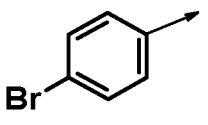
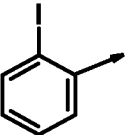
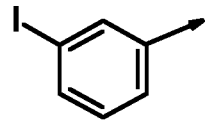
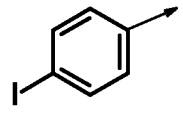
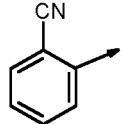
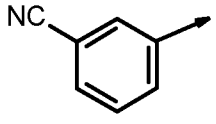
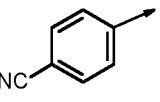
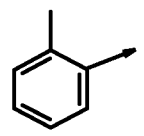
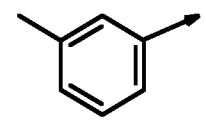
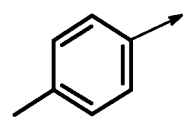
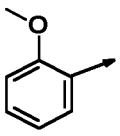
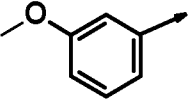
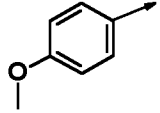
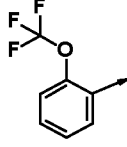
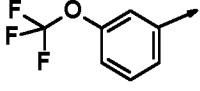
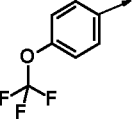
Son un objeto de la invención particularmente preferido en especial los compuestos de la fórmula general (I), en donde

R<sup>1</sup> representa los siguientes grupos seleccionados de Q-1.1 a Q-1.59

Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.10	Q-1.11	Q-1.12
Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15	Q-1.17	Q-1.18
Q-1.19	Q-1.21	Q-1.22	Q-1.24	Q-1.25

		
Q-1.56	Q-1.57	Q-1.59

y (R<sup>2</sup>)<sub>m</sub>-fenilo representa los grupos Q-2.1 a Q-2.53

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10
				
Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20
				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25

Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45
Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53		

R<sup>3</sup> representa hidrógeno,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, n-pentilo, fenilo, bencilo, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-OMe-Ph), 2-metoxietilo, tetrahidrofuran-2-il-metilo, tetrahidrofuran-3-il-metilo, tetrahidropiran-2-il-metilo, tetrahidropiran-3-il-metilo, tetrahidropiran-4-il-metilo, metilpropionat-3-ilo, etilpropionat-3-ilo, metilacetat-2-ilo, etilacetat-2-ilo, metilpivalat-2-ilo, etilpivalat-3-ilo, metil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2,2-dimetilpropanoat-3-ilo, etil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2-propanoat-2-

5 ilo, etil-2-propanoat-2-ilo, metilacet-2-ilo, etilacet-2-ilo, metil-1-metilciclopropan-carboxilat-2-ilo, etil-1-metilciclopropan-carboxilat-2-ilo, 2-(dimetilamino)etilo, oxetan-3-ilo, (3-metiloxetan-3-il)metilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, ciclopropilmetilo, 1-ciclopropil-etilo, (1-metil-ciclopropil)-metilo, (2,2-diclorociclopropil)-metilo, (2,2-dimetil-ciclopropil)-metilo, alilo, propargil  
 10 (prop-2-in-1-il), 2-cloroprop-2-en-1-ilo, 3-fenilprop-2-in-1-ilo, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ilo, 3,3-dicloro-2-fluor-prop-2-en-1-ilo, metilprop-2-in-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 4-cloro-but-2-in-1-ilo, 3-metil-but-2-en-1-ilo, 3-metil-but-1-en-1-ilo, 1-(2E)-1-metilbut-2-en-1-ilo, (E)-pent-3-en-2-ilo o (Z)-pent-3-en-2-ilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, heptan-2-ilo, iso-butilo, 1,3-dioxolan-2-ilmetilo o 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-metilo.

Las definiciones generales dadas anteriormente o indicadas en los intervalos de preferencia de los radicales se aplican tanto a los productos finales de la fórmula (I) así como para los productos de partida o intermedios necesarios para la preparación. Estas definiciones de radicales se pueden combinar arbitrariamente entre sí, por lo tanto también entre los respectivos intervalos preferidos.

15 Sobre todo por razones de una mayor actividad herbicida, de una mejor selectividad y/o una mejor capacidad de producción, los compuestos de la invención de la fórmula general (I) antes mencionada o sus sales o su uso según la invención son de particular interés, en los cuales los radicales individuales tienen uno de los significados preferentes mencionados anteriormente o que se mencionan a continuación, o en particular aquellos, en los cuales uno o más significados preferentes ya mencionados o a mencionarse a continuación aparecen en forma combinada.

20 Con respecto a los compuestos de la invención, las denominaciones antes mencionadas y a mencionarse se explican a continuación. Estos son conocidos por el experto y tienen en particular los significados que se explican a continuación:

25 Salvo que a continuación se defina lo contrario, aplica en forma general para la denominación de grupos químicos, que la unión a la estructura o al radical de la molécula se lleva a cabo a través de la unidad estructural que se mencionó por último del grupo químico en cuestión. Es decir, por ejemplo, en el caso de (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alqueniloxi a través del átomo de oxígeno, y en el caso de heterocicliil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) o alquilO(O)C-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) a través del átomo de carbono del grupo alquilo, respectivamente.

30 De acuerdo con la invención, "alquilsulfonilo" significa -en forma aislada o como parte de un grupo químico- un alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificado, preferentemente con 1 a 8, o con 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo (pero sin limitación, a) alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-sulfonilo como metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, 1-metiletilsulfonilo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimeteletilsulfonilo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo y 1-etil-2-metilpropilsulfonilo.

35 "Alquiltio" según la invención significa un radical S-alquilo -en forma aislada o como parte de un grupo químico- de cadena lineal o ramificado, preferentemente con 1 a 8, o con 1 a 6 átomos de carbono, como alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-tio, por ejemplo (pero sin limitación) alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-tio como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimeteiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metilpropiltio.

45 "Alquilsulfino (alquilo-S(=O)-)", a menos que se defina lo contrario en otra parte, según la invención es un radical alquilo, unido a la estructura a través de S(=O)-, como alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfino, por ejemplo (pero sin limitación) alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-sulfino como metilsulfino, etilsulfino, propilsulfino, 1-metileilsulfino, butilsulfino, 1-metilpropilsulfino, 2-metilpropilsulfino, 1,1-dimetiellsulfino, pentilsulfino, 1-metilbutilsulfino, 2-metilbutilsulfino, 3-metilbutilsulfino, 1,1-dimetilpropilsulfino, 1,2-dimetilpropilsulfino, 2,2-dimetilpropilsulfino, 1-etilpropilsulfino, 50 hexilsulfino, 1-metilpentilsulfino, 2-metilpentilsulfino, 3-metilpentilsulfino, 4-metilpentilsulfino, 1,1-dimetilbutilsulfino, 1,2-dimetilbutilsulfino, 1,3-dimetilbutilsulfino, 2,2-dimetilbutilsulfino, 2,3-dimetilbutilsulfino, 3,3-dimetilbutilsulfino, 1-etilbutilsulfino, 2-etilbutilsulfino, 1,1,2-trimetilpropilsulfino, 1,2,2-trimetilpropilsulfino, 1-etil-1-metilpropilsulfino y 1-etil-2-metilpropilsulfino.

55 "Alcoxi" significa un radical alquilo unido a través de un átomo de oxígeno, por ejemplo (pero sin limitación) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimeteletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi. "Alqueniloxi" significa un radical alquenilo unido a

través de un átomo de oxígeno, "alquiniloxi" significa un radical alquinilo unido a través de un átomo de oxígeno como alquen (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-oxi o alquin (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-oxi.

5 "Alquilcarbonilo" (alquilo-C(=O)-), a menos que se defina lo contrario en otra parte, según la invención es un radical alquilo, unido a la estructura a través de -C(=O)-, como alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-carbonilo. El número de átomos de carbono se refiere al radical alquilo en el grupo alquilcarbonilo.

10 "Alcoxycarbonilo" (alquilo-O-C(=O)-), a menos que se defina lo contrario en otra parte, representa radicales alquilo, que están unidos a la estructura a través de -O-C(=O)-, como alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-carbonilo. El número de átomos de carbono se refiere al radical alquilo en el grupo alcoxycarbonilo. Análogamente, "alquinoxycarbonilo" y "alquiniloxycarbonilo", a menos que se defina lo contrario en otra parte, son de acuerdo a la invención radicales alqueno y alquinilo, que están unidos a la estructura a través de -O-C(=O)-, como alquenoil (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-oxycarbonilo o alquinil (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)- o (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-oxycarbonilo. El número de átomos de carbono se refiere al radical alquenoil o alquinilo en los grupos alquinoxycarbonilo o alquiniloxycarbonilo.






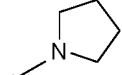
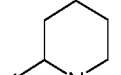
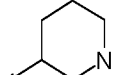
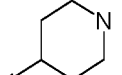
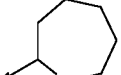
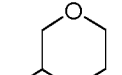
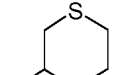
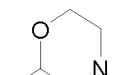
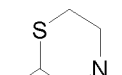
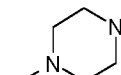
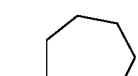
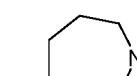
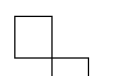
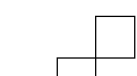
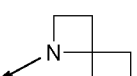

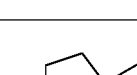
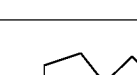
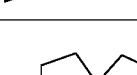

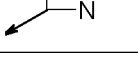




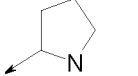
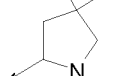
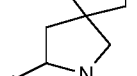

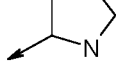

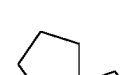
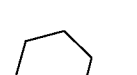
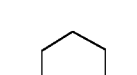
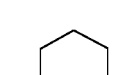
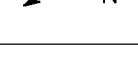
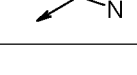
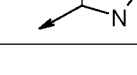


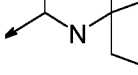
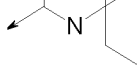
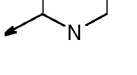
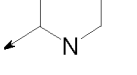
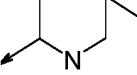
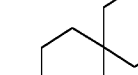
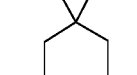
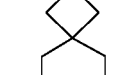
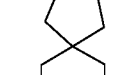
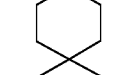

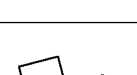
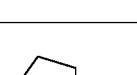
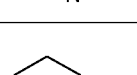
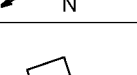
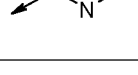
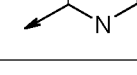
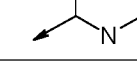
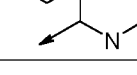
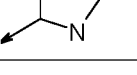
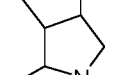
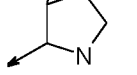
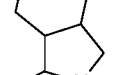
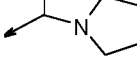
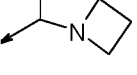
15 El término "arilo" significa un sistema aromático opcionalmente mono-, bi- o policíclico que tiene preferentemente 6 a 14, en particular 6 a 10 átomos de anillo C, por ejemplo fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y similar, preferentemente fenilo.

20 La expresión "arilo opcionalmente sustituido" también abarca sistemas policíclicos, tales como tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, fluorenilo, bifenililo, en los que el sitio de unión se encuentra en el sistema aromático. Como regla general, "arilo" también está abarcado por el término "fenilo opcionalmente sustituido". En la presente memoria los sustituyentes de arilo preferidos son por ejemplo hidrógeno, halógeno, alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquenoil, halocicloalquilo, alquenoil, alquinilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, alcoxialquilo, alquiltio, haloalquiltio, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, cicloalquilalcoxi, ariloxi, heteroariloxi, alcoxialcoxi, alquinilalcoxi, alquenoiloxi, bis-alquilaminoalcoxi, tris-[alquil]sililo, bis-[alquil]arilsililo, bis-[alquil]alquilsililo, tris-[alquil]sililalquinoil, alquilalquinoil, cicloalquilalquinoil, haloalquilalquinoil, heterociclil-N-alcoxi, nitro, ciano, amino, alquilamino, bis-alquilamino, alquilcarbonilamino, cicloalquilcarbonilamino, arilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alcoxycarbonilalquilamino, arilalcoxycarbonilalquilamino, hidroxycarbonilo, alcoxycarbonilo, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, bis-alquilaminocarbonilo, heteroarilalcoxi, arilalcoxi.

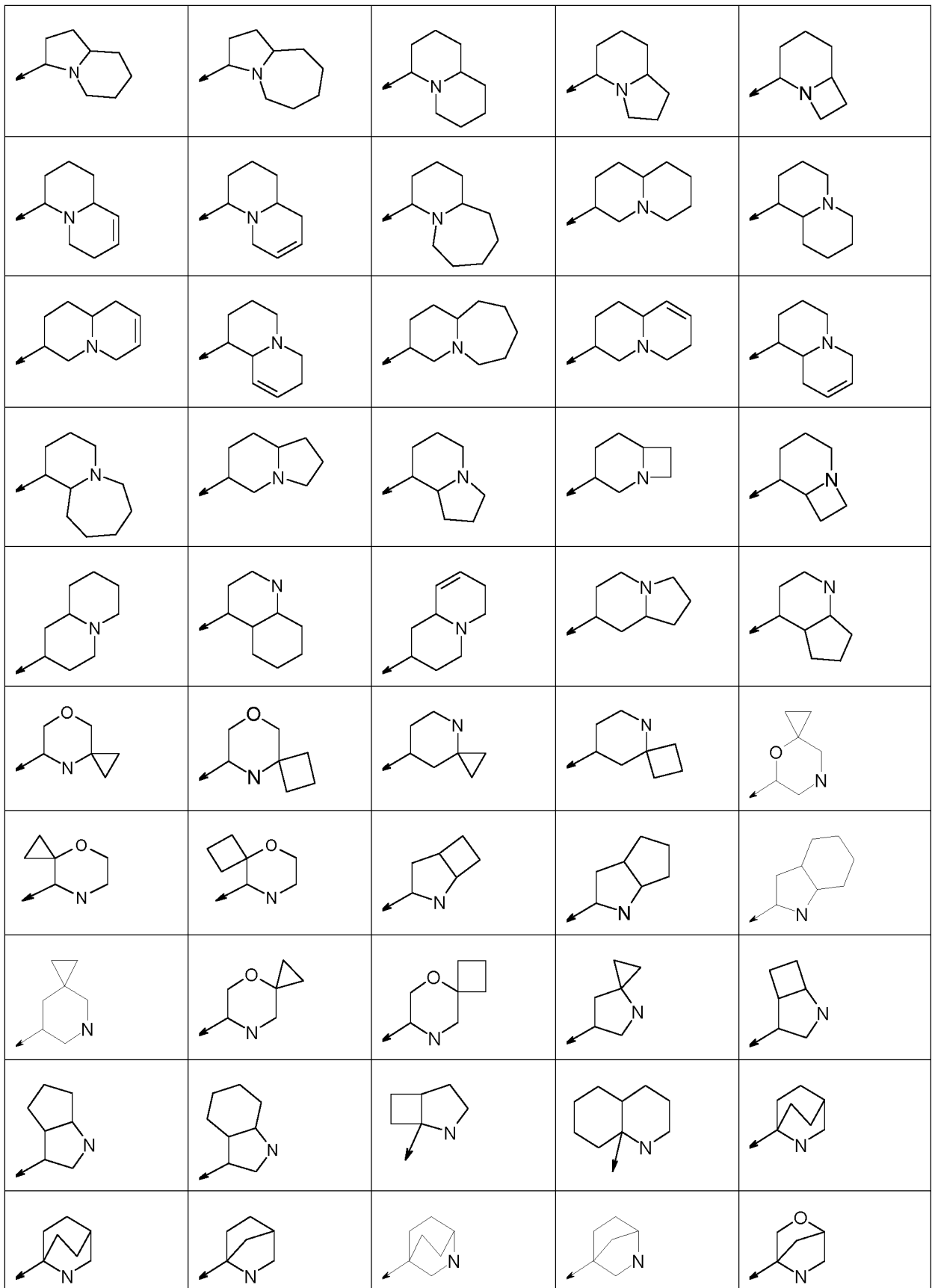
30 Un radical heterocíclico (heterociclilo) contiene al menos un anillo heterocíclico (= anillo carbocíclico en el que al menos un átomo de carbono está sustituido por heteroátomo, preferentemente por al menos un heteroátomo del grupo N, O, S, P) saturado, no saturado, parcialmente saturado o heteroaromático y además puede estar sustituido o no sustituido, en el que el sitio de unión está localizado en el átomo de anillo. Si el radical heterociclilo o el anillo heterocíclico están opcionalmente sustituidos, pueden estar condensados con otros anillos carbocíclicos o heterocíclicos. En el caso de un heterociclilo opcionalmente sustituido, también se incluyen sistemas policíclicos, tal como 8-azabicyclo[3.2.1]octanilo, 8-azabicyclo[2.2.2]octanilo o 1-azabicyclo[2.2.1]heptilo. En el caso de un heterociclilo opcionalmente sustituido, también se incluyen sistemas espirocíclicos, tal como 1-oxa-5-aza-espiro[2.3]hexilo. A menos que se defina otra cosa, el anillo heterocíclico contiene preferentemente 3 a 9 átomos de anillo, en particular 3 a 6 átomos de anillo, y uno o más, preferentemente 1 a 4, en particular 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferentemente del grupo N, O y S, en los que, sin embargo, dos átomos de oxígeno no son directamente adyacentes, como por ejemplo con un heteroátomo del grupo N, O y S 1- o 2- o 3-pirrolidinilo, 3,4-dihidro-2H-pirrol-2- o 3-ilo, 2,3-dihidro-1H-pirrol-1- o 2- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,5-dihidro-1H-pirrol-1- o 2- o 3-ilo, 1- o 2- o 3- o 4-piperidinilo; 2,3,4,5-tetrahidropiridin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2,3,6-tetrahidropiridin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2,3,4-tetrahidropiridin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,4-dihidropiridin-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 2,3-dihidropiridin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 2,5-dihidropiridin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo, 1- o 2- o 3- o 4-azepanilo; 2,3,4,5-tetrahidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,7-tetrahidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,6,7-tetrahidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 3,4,5,6-tetrahidro-2H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5-dihidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 2,5-dihidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,7-dihidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 2,3-dihidro-1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 3,4-dihidro-2H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 3,6-dihidro-2H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 5,6-dihidro-2H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5-dihidro-3H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 1H-azepin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 3H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4H-azepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo, 2- o 3-oxolanil (= 2- o 3-tetrahidrofuranil); 2,3-dihidrofuran-2- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,5-dihidrofuran-2- o 3-ilo, 2- o 3- o 4-oxanil (= 2- o 3- o 4-tetrahidropiranil); 3,4-dihidro-2H-piran-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidro-2H-piran-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 2H-piran-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 4H-piran-2- o 3- o 4-ilo, 2- o 3- o 4-oxepanilo; 2,3,4,5-tetrahidrooxepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,7-tetrahidrooxepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,6,7-tetrahidrooxepin-2- o 3- o 4-ilo; 2,3-dihidrooxepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5-dihidrooxepin-2- o 3- o 4-ilo; 2,5-dihidrooxepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; oxepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2- o 3-tetrahidrotiofenilo; 2,3-dihidrotiofen-2- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,5-dihidrotiofen-2- o 3-ilo; tetrahidro-2H-tiopiran-2- o 3- o 4-ilo; 3,4-dihidro-2H-tiopiran-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidro-2H-tiopiran-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 2H-tiopiran-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 4H-tiopiran-2- o 3- o 4-ilo. Los heterociclos de 3 anillos y de 4 anillos preferidos son, por ejemplo, 1- o 2-aziridinilo, oxiranilo, tiiranilo, 1- o 2- o 3-azetidínulo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo, 1,3-dioxetan-2-ilo. Otros ejemplos para "heterociclilo" son un radical heterocíclico parcial o totalmente hidrogenados con

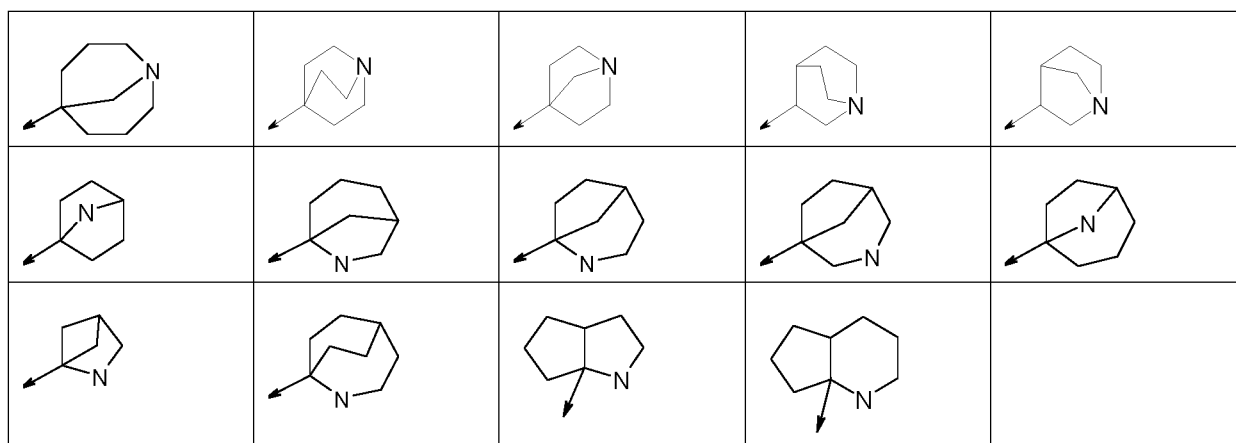
dos heteroátomos del grupo N, O y S, como, por ejemplo, 1- o 2- o 3- o 4- pirazolidinilo; 4,5-dihidro-3H-pirazol- 3- o 4- o 5-ilo; 4,5-dihidro-1H-pirazol-1- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,3-dihidro-1H-pirazol-1- o 2- o 3- o 4- o 5-ilo; 1- o 2- o 3- o 4- imidazolidinilo; 2,3-dihidro-1H-imidazol-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 2,5-dihidro-1H-imidazol-1- o 2- o 4- o 5-ilo; 4,5-dihidro-1H-imidazol-1- o 2- o 4- o 5-ilo; hexahidropiridazin-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 1,2,3,4-tetrahidropiridazin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2,3,6-tetrahidropiridazin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,4,5,6-tetrahidropiridazin-1- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,4,5,6-tetrahidropiridazin-3- o 4- o 5-ilo; 4,5-dihidropiridazin-3- o 4-ilo; 3,4-dihidropiridazin-3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidropiridazin-3- o 4-ilo; 1,6-dihidropiriazin-1- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; hexahidropirimidin-1- o 2- o 3- o 4-ilo; 1,4,5,6-tetrahidropirimidin-1- o 2- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2,5,6-tetrahidropirimidin-1- o 2- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2,3,4-tetrahidropirimidin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,6-dihidropirimidin-1- o 2- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2-dihidropirimidin-1- o 2- o 4- o 5- o 6-ilo; 2,5-dihidropirimidin-2- o 4- o 5-ilo; 4,5-dihidropirimidin- 4- o 5- o 6-ilo; 1,4-dihidropirimidin-1- o 2- o 4- o 5- o 6-ilo; 1- o 2- o 3- piperazinilo; 1,2,3,6-tetrahidropirazin-1- o 2- o 3- o 5- o 6-ilo; 1,2,3,4-tetrahidropirazin-1- o 2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,2-dihidropirazin-1- o 2- o 3- o 5- o 6-ilo; 1,4-dihidropirazin-1- o 2- o 3-ilo; 2,3-dihidropirazin-2- o 3- o 5- o 6-ilo; 2,5-dihidropirazin-2- o 3-ilo; 1,3-dioxolan-2- o 4- o 5-ilo; 1,3-dioxol-2- o 4-ilo; 1,3-dioxan-2- o 4- o 5-ilo; 4H-1,3-dioxin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidro-2H-1,2-oxazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 5,6-dihidro-2H-1,2-oxazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 5,6-dihidro-4H-1,2-oxazin-3- o 4- o 5- o 6-ilo; 2H-1,2-oxazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 6H-1,2-oxazin-3- o 4- o 5- o 6-ilo; 4H-1,2-oxazin-3- o 4- o 5- o 6-ilo; 1,3-oxazinan-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,4-dihidro-2H-1,3-oxazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidro-2H-1,3-oxazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 5,6-dihidro-2H-1,3-oxazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 6H-1,3-oxazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 4H-1,3-oxazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; morfolin-2- o 3- o 4-ilo; 3,4-dihidro-2H-1,4-oxazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidro-2H-1,4-oxazin-2- o 3- o 5- o 6-ilo; 2H-1,4-oxazin-2- o 3- o 5- o 6-ilo; 4H-1,4-oxazin-2- o 3-ilo; 1,2-oxazepan-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,5-tetrahidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,7-tetrahidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,6,7-tetrahidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,5,6,7-tetrahidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5,6,7-tetrahidro-1,2-oxazepin-3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3-dihidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,5-dihidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,7-dihidro-1,2-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5-dihidro-1,2-oxazepin-3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,7-dihidro-1,2-oxazepin-3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 6,7-dihidro-1,2-oxazepin-3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 1,2-oxazepin-3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 1,3-oxazepan-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,5-tetrahidro-1,3-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,7-tetrahidro-1,3-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,6,7-tetrahidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5,6,7-tetrahidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3-dihidro-1,3-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,5-dihidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,7-dihidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5-dihidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,7-dihidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 6,7-dihidro-1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 1,3-oxazepin-2- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 1,4-oxazepan-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,5-tetrahidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,4,7-tetrahidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3,6,7-tetrahidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,5,6,7-tetrahidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5,6,7-tetrahidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3-dihidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,5-dihidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,7-dihidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,5-dihidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 4,7-dihidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 4- o 5- o 6- o 7-ilo; 6,7-dihidro-1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 1,4-oxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; isotiazolidin-2- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,3-dihidroisotiazol-2- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,5-dihidroisotiazol-2- o 3- o 4- o 5-ilo; 4,5-dihidroisotiazol-3- o 4- o 5-ilo; 1,3-tiazolidin-2- o 3- o 4- o 5-ilo; 2,3-dihidro-1,3-tiazol-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 2,5-dihidro-1,3-tiazol-2- o 4- o 5-ilo; 4,5-dihidro-1,3-tiazol-2- o 4- o 5-ilo; 1,3-tiazinan-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,4-dihidro-2H-1,3-tiazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 3,6-dihidro-2H-1,3-tiazin-2- o 3- o 4- o 5- o 6-ilo; 5,6-dihidro-2H-1,3-tiazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 5,6-dihidro-4H-1,3-tiazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 2H-1,3-tiazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 6H-1,3-tiazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo; 4H-1,3-tiazin-2- o 4- o 5- o 6-ilo. Otros ejemplos para "heterociclilo" son un radical heterocíclico parcial o totalmente hidrogenado con 3 heteroátomos del grupo N, O y S como, por ejemplo, 1,4,2-dioxazolidin-2- o 3- o 5-ilo; 1,4,2-dioxazol-3- o 5-ilo; 1,4,2-dioxazinan-2- o 3- o 5- o 6-ilo; 5,6-dihidro-1,4,2-dioxazin-3- o 5- o 6-ilo; 1,4,2-dioxazin-3- o 5- o 6-ilo; 1,4,2-dioxazepan-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 6,7-dihidro-5H-1,4,2-dioxazepin-3- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3-dihidro-7H-1,4,2-dioxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 2,3-dihidro-5H-1,4,2-dioxazepin-2- o 3- o 5- o 6- o 7-ilo; 5H-1,4,2-dioxazepin-3- o 5- o 6- o 7-ilo; 7H-1,4,2-dioxazepin-3- o 5- o 6- o 7-ilo. A continuación, también se enumeran ejemplos de estructuras de heterociclos opcionalmente sustituidos:

ES 3 018 232 T3

ES 3 018 232 T3





Los heterociclos mencionados anteriormente están sustituidos preferentemente por ejemplo por hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, hidroxilo, alcoxi, cicloalcoxi, arilo, cicloalcoxi, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heterociclilo, alqueno, alquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, alcoxycarbonilo, hidroxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, alcoxycarbonilalquilo, arilalcoxycarbonilo, arilalcoxycarbonilalquilo, alquino, alquinalquilo, alquilalquino, tris-alquiloalquino, nitro, amino, ciano, haloalcoxi, haloalquilo, alquilo, hidrotio, hidroxialquilo, oxo, heteroarilalcoxi, arilalcoxi, heterociclilalcoxi, heterociclilalquilo, heterociclilo, heterociclilo, heteroariloxi, bis-alquilamino, alquilamino, cicloalquilamino, hidroxycarbonilalquilamino, alcoxycarbonilalquilamino, arilalcoxycarbonilalquilamino, alcoxycarbonilalquil(amino), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, bis-alquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, hidroxycarbonilalquilaminocarbonilo, alcoxycarbonilalquilaminocarbonilo, arilalcoxycarbonilalquilaminocarbonilo.

Cuando un cuerpo principal está sustituido "por uno o más radicales" de una lista de radicales (= grupo) o de un grupo de radicales genéricamente definido, esto incluye en cada caso la sustitución simultánea por varios radicales idénticos y/o estructuralmente diferentes.

Si se trata de un heterociclo de nitrógeno parcial o totalmente saturado, este puede estar ligado con el radical de la molécula tanto a través de carbono como también a través de nitrógeno.

Los sustituyentes que se consideran para un radical heterocíclico sustituido son los sustituyentes que se mencionan más adelante y adicionalmente también oxo y tioxo. El grupo oxo como sustituyente en un átomo de anillo de carbono significa entonces, por ejemplo, un grupo carbonilo en el anillo heterocíclico. De este modo también se comprenden preferentemente lactonas y lactamas. El grupo oxo también puede aparecer en los heteroátomos de anillo, que pueden existir en diversos niveles de oxidación, por ejemplo en N y S, y forman entonces, por ejemplo, los grupos divalentes N(O), S(O) (en forma abreviada también SO) y S(O)<sub>2</sub> (en forma abreviada también SO<sub>2</sub>) en el anillo heterocíclico. En el caso de grupos -N(O)- y -S(O)- están abarcados ambos enantiómeros respectivamente.

Según la invención, el término "heteroarilo" representa compuestos heteroaromáticos, es decir, compuestos heterocíclicos aromáticos totalmente insaturados, preferentemente representa anillos de 5 a 7 miembros, con 1 a 4, preferentemente 1 o 2 heteroátomos idénticos o diferentes, preferentemente O, S o N. Los heteroarilos según la invención son, por ejemplo 1H-pirrol-1-ilo; 1H-pirrol-2-ilo; 1H-pirrol-3-ilo; furan-2-ilo; furan-3-ilo; tien-2-ilo; tien-3-ilo; 1H-imidazol-1-ilo; 1H-imidazol-2-ilo; 1H-imidazol-4-ilo; 1H-imidazol-5-ilo; 1H-pirazol-1-ilo; 1H-pirazol-3-ilo; 1H-pirazol-4-ilo; 1H-pirazol-5-ilo; 1H-1,2,3-triazol-1-ilo; 1H-1,2,3-triazol-4-ilo; 1H-1,2,3-triazol-5-ilo; 2H-1,2,3-triazol-2-ilo; 2H-1,2,3-triazol-4-ilo; 1H-1,2,4-triazol-1-ilo; 1H-1,2,4-triazol-3-ilo; 4H-1,2,4-triazol-4-ilo; 1,2,4-oxadiazol-3-ilo; 1,2,4-oxadiazol-5-ilo; 1,3,4-oxadiazol-2-ilo; 1,2,3-oxadiazol-4-ilo; 1,2,3-oxadiazol-5-ilo; 1,2,5-oxadiazol-3-ilo; azepinilo; piridin-2-ilo; piridin-3-ilo; piridin-4-ilo; pirazin-2-ilo; pirazin-3-ilo; pirimidin-2-ilo; pirimidin-4-ilo; pirimidin-5-ilo; piridazin-3-ilo; piridazin-4-ilo; 1,3,5-triazin-2-ilo; 1,2,4-triazin-3-ilo; 1,2,4-triazin-5-ilo; 1,2,4-triazin-6-ilo; 1,2,3-triazin-4-ilo; 1,2,3-triazin-5-ilo; 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilo; isoxazol-3-ilo; isoxazol-4-ilo; isoxazol-5-ilo; 1,3-oxazol-2-ilo; 1,3-oxazol-4-ilo; 1,3-oxazol-5-ilo; isotiazol-3-ilo; isotiazol-4-ilo; isotiazol-5-ilo; 1,3-tiazol-2-ilo; 1,3-tiazol-4-ilo; 1,3-tiazol-5-ilo; 1,3,4-tiadiazol-2-ilo; 1,3,4-tiadiazol-5-ilo; 1,2,4-tiadiazol-5-ilo; 1,2,4-tiadiazol-3-ilo; 1,2,5-tiadiazol-3-ilo; 1,2,5-tiadiazol-4-ilo; 1,2,3-tiadiazol-4-ilo; 1,2,3-tiadiazol-5-ilo; oxepinilo; tiepinilo; 1,2,4-triazolil; 1,2,4-diazepinilo; 2H-1,2,3,4-tetrazol-5-ilo; 1H-1,2,3,4-tetrazol-5-ilo; 1,2,3,4-oxatriazol-5-ilo; 1,2,3,4-tiatriazol-5-ilo; 1,2,3,5-oxatriazol-4-ilo; 1,2,3,5-tiatriazol-4-ilo. Los grupos heteroarilo de la invención además pueden estar sustituidos con uno o varios radicales, idénticos o diferentes. Si dos átomos de carbono adyacentes son componente de otro anillo aromático, entonces se trata de sistemas heteroaromáticos condensados, tales como heteroaromáticos benzocondensados o condensados repetidas veces. Son preferentes por ejemplo quinolinas (por ejemplo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo); isoquinolina (por ejemplo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo, isoquinolin-8-ilo); quinoxalina; quinazolina; cinnolina; 1,5-naftiridina; 1,6-naftiridina; 1,7-naftiridina; 1,8-naftiridina; 2,6-naftiridina; 2,7-naftiridina; ftalazina;

piridopirazina; piridopirimidina; piridopiridazina; pteridina; pirimidopirimidina. Los ejemplos de heteroarilo son también anillos benzocondensados de 5 ó 6 miembros del grupo 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-indazol-2-ilo, 2H-indazol-3-ilo, 2H-indazol-4-ilo, 2H-indazol-5-ilo, 2H-indazol-6-ilo, 2H-indazol-7-ilo, 2H-isoindol-2-ilo, 2H-isoindol-1-ilo, 2H-isoindol-3-ilo, 2H-isoindol-4-ilo, 2H-isoindol-5-ilo, 2H-isoindol-6-ilo; 2H-isoindol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, 1H-bencimidazol-5-ilo, 1H-bencimidazol-6-ilo, 1H-bencimidazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo, 1,3-benzoxazol-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzotiazol-4-ilo, 1,3-benzotiazol-5-ilo, 1,3-benzotiazol-6-ilo, 1,3-benzotiazol-7-ilo, 1,2-bencisoxazol-3-ilo, 1,2-bencisoxazol-4-ilo, 1,2-bencisoxazol-5-ilo, 1,2-bencisoxazol-6-ilo, 1,2-bencisoxazol-7-ilo, 1,2-bencisotiazol-3-ilo, 1,2-bencisotiazol-4-ilo, 1,2-bencisotiazol-5-ilo, 1,2-bencisotiazol-6-ilo, 1,2-bencisotiazol-7-ilo.

15 La denominación "halógeno" significa por ejemplo flúor, cloro, bromo o yodo. Si la denominación se utiliza para un radical, entonces "halógeno" significa por ejemplo un átomo de flúor, de cloro, de bromo o de yodo.

Según la invención "alquilo" significa un radical hidrocarburo de cadena lineal o ramificado, de cadena abierta, saturado, que opcionalmente está mono- o polisustituido y en este último caso se define como "alquilo sustituido". Los sustituyentes preferidos son átomos de halógeno, grupos alcoxi, haloalcoxi, ciano, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquilo, alcoxycarbonilo, hidrocycarbonilo, heterociclico, hetarilo, arilo, amino o nitro, con preferencia especial, metoxi, metilo, fluoroalquilo, ciano, nitro, flúor, cloro, bromo o yodo. El prefijo "bis" también incluye la combinación de diferentes radicales alquilo, por ejemplo metilo(etilo) o etilo(metilo).

"Haloalquilo", "haloalqueno" y "haloalquino" son alquilo, alqueno o alquino, por ejemplo monohaloalquilo como por ejemplo  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ ,  $\text{CHClCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$  parcial o totalmente sustituidos por átomos de halógeno idénticos o diferentes; perhaloalquilo como por ejemplo  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ ,  $\text{CHClCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ; perhaloalquilo como, por ejemplo,  $\text{CCl}_3$ ,  $\text{CClF}_2$ ,  $\text{CFCl}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CClF}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CClFCF}_3$ ; polihaloalquilo como, por ejemplo,  $\text{CH}_2\text{CHFCl}$ ,  $\text{CF}_2\text{CClFH}$ ,  $\text{CF}_2\text{CBrFH}$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ; el término perhaloalquilo incluye también el término perfluoroalquilo.

"Haloalcoxi" es por ejemplo  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{OCF}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  y  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ . Lo mismo se aplica para haloalqueno y otros radicales sustituidos por halógeno.

30 El término que en la presente memoria se menciona a modo de ejemplo "alquilo ( $\text{C}_1\text{-C}_4$ )" es una forma abreviada para alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 4 átomos de carbono de acuerdo con la información de intervalo para los átomos de carbono, es decir, abarca los radicales metilo, etilo, 1-propilo, 2-propilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o ter-butilo. Los radicales generales de alquilo con un mayor número especificado de átomos de carbono, por ejemplo "alquilo ( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )", comprenden correspondientemente también radicales alquilo de cadena lineal o ramificada con un número mayor de átomos de carbono, es decir, de acuerdo al ejemplo, también los radicales alquilo que tienen 5 y 6 átomos de carbono.

A menos que se indique específicamente, en los radicales hidrocarbonados como ser los radicales alquilo, alqueno y alquino, incluyendo los radicales compuestos, son preferentes los esqueletos de carbono inferiores, por ejemplo con 1 a 6 átomos de carbono o, en grupos no saturados, con 2 a 6 átomos de carbono. Los radicales alquilo, también los radicales compuestos, tales como alcoxi, haloalquilo etc., significan por ejemplo metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, t- o 2-butilo, pentilos, hexilos, como n-hexilo, i-hexilo y 1,3-dimetilbutilo, heptilos, como n-heptilo, 1-metilhexilo y 1,4-dimetilpentilo; los radicales alqueno y alquino tienen el significado de los radicales insaturados posibles correspondientes a los radicales alquilo, en los que está incluido al menos un enlace doble o un enlace triple. Son preferentes los radicales que contienen un enlace doble o un enlace triple.

45 El término "alqueno" también incluye, en particular, radicales de hidrocarburo de cadena lineal o ramificada abierta con más de un doble enlace, tal como 1,3-butadieno y 1,4-pentadieno, pero también radicales aleno o cumulenilo con uno o más enlaces dobles acumulados, tal como aleno (1,2-propadieno), 1,2-butadieno y 1,2,3-pentatrieno. Alqueno significa por ejemplo vinilo, que puede estar opcionalmente sustituido por otros radicales alquilo, por ejemplo (pero sin limitación) alqueno ( $\text{C}_2\text{-C}_6$ ) como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-

butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenil y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

El término "alquinilo" también incluye, en particular, radicales de hidrocarburo de cadena abierta lineal o ramificada con más de un triple enlace o también con uno o varios triples enlaces y uno o varios dobles enlaces, tal como 1,3-butatrienilo o 3-penten-1-in-1-ilo. Alquinilo ( $C_2-C_6$ ) significa, por ejemplo, 1,3-butatrienilo o bien 3-penten-1-in-1-ilo. Alquinilo ( $C_2-C_6$ ) significa, por ejemplo, etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-di-metil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-3-butenil y 1-etil-1-metil-2-propinilo.

El término "cicloalquilo" significa un sistema de anillos saturado carbocíclico con preferentemente 3 a 8 átomos de anillo de carbono, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo, que está opcionalmente sustituido adicionalmente, de preferencia por hidrógeno, alcoxi, ciano, nitro, alquiltio, haloalquiltio, halógeno, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, amino, alquilamino, bisalquilamino, alcocicarbonilo, hidroxicarbonilo, arilalcoxicarbonilo, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo. En el caso de cicloalquilo opcionalmente sustituido, se comprenden sistemas cíclicos con sustituyentes, en los que también se comprenden sustituyentes con un doble enlace en el radical cicloalquilo, por ejemplo un grupo alquilideno tal como metilideno. En el caso de cicloalquilo opcionalmente sustituido, también se comprende sistemas alifáticos policíclicos, tal como, por ejemplo, biciclo[1,1,0]butan-1-ilo, biciclo[1,1,0]butan-2-ilo, biciclo[2,1,0]pentan-1-ilo, biciclo[1,1,1]pentan-1-ilo, biciclo[2,1,0]pentan-2-ilo, biciclo[2,1,0]pentan-5-ilo, biciclo[2,1,1]hexilo, biciclo[2,2,1]hept-2-ilo, biciclo[2,2,2]octan-2-ilo, biciclo[3,2,1]octan-2-ilo, biciclo[3,2,2]nonan-2-ilo, Adamantan-1-ilo y adamantan-2-ilo, pero también sistemas tales como, por ejemplo, 1,1'-bi(ciclopropil)-1-ilo, 1,1'-bi(ciclopropil)-2-ilo. El término "cicloalquilo ( $C_3-C_7$ )" es una forma abreviada para cicloalquilo con 3 a 7 átomos de carbono correspondiente a la especificación de intervalo para los átomos de carbono.

En el caso de cicloalquilo sustituido, también se comprende sistemas alifáticos espirocíclicos, tales como, por ejemplo, espiro[2,2]pent-1-ilo, espiro[2,3]hex-1-ilo, espiro[2,3]hex-4-ilo, 3-espiro[2,3]hex-5-ilo, espiro[3,3]hept-1-ilo, espiro[3,3]hept-2-ilo.

"Cicloalquenilo" significa un sistema de anillos carbocíclico, no aromático, parcialmente insaturado que tiene preferentemente 4 a 8 átomos de carbono, por ejemplo 1-ciclobutenilo, 2-ciclobutenilo, 1-ciclopentenilo, 2-ciclopentenilo, 3-ciclopentenilo o 1-ciclohexenilo, 2-ciclohexenilo, 3-ciclohexenilo, 1,3-ciclohexadienilo o 1,4-ciclohexadienilo, en los que también se comprenden sustituyentes con un doble enlace en el radical cicloalquenilo, por ejemplo un grupo alquilideno tal como metilideno. En el caso de cicloalquenilo opcionalmente sustituido se aplican en consecuencia las explicaciones para cicloalquilo sustituido.

El término "alquilideno", por ejemplo también en la forma alquilideno ( $C_1-C_{10}$ ), significa un radical de un radical hidrocarburo de cadena abierta lineal o ramificada, que está unido a través de un doble enlace. Como sitio de unión para alquilideno es natural que se consideren solamente posiciones en el cuerpo base, en el que dos átomos de hidrógeno pueden ser reemplazados por un doble enlace; los radicales son por ejemplo  $=CH_2$ ,  $=CH-CH_3$ ,  $=C(CH_3)-CH_3$ ,  $=C(CH_3)-C_2H_5$  o  $=C(C_2H_5)-C_2H_5$ . cicloalquilideno significa un radical carbocíclico, que está unido a través de un doble enlace.

"Alcoxialquilo" representa un radical alcoxi unido a través de un grupo alquilo y "alcoxialcoxi" representa un radical alcoxialquilo unido a través de un átomo de oxígeno, por ejemplo (pero sin limitación) metoximetoxi, metoxietoxi, etoxietoxi, metoxi-n-propiloxi.

"Arilalquilo" representa un radical arilo unido a través de un grupo alquilo, "heteroarilalquilo" representa un radical heteroarilo unido a través de un grupo alquilo, y "heterociclilalquilo" representa un radical heterociclilo unido a través de un grupo alquilo.

"Cicloalquilalquilo" representa un radical cicloalquilo unido a través de un grupo alquilo, por ejemplo (pero sin limitación) ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, 1-ciclopropilet-1-ilo, 2-ciclopropilet-1-ilo, 1-ciclopropilprop-1-ilo, 3-ciclopropilprop-1-ilo.

Según la invención "haloalquiltio" – solo o como parte de un grupo químico – es un S-haloalquilo de cadena lineal o ramificada, que preferentemente tiene de 1 a 8 o 1 a 6 átomos de carbono, como haloalquil ( $C_1-C_8$ )-, ( $C_1-C_6$ )- o ( $C_1-C_4$ )-tio, por ejemplo, (pero sin limitación) trifluorometiltio, pentafluoroetiltio, difluorometilo, 2,2-difluoroet-1-iltio, 2,2,2-difluoroet-1-iltio, 3,3,3-prop-1-iltio.

"Halocicloalquilo" significa cicloalquilo o cicloalquenilo parcial o totalmente sustituidos por átomos de halógeno iguales o diferentes, como por ejemplo F, Cl y Br, o por haloalquilos, como por ejemplo trifluorometilo o difluorometilo, por ejemplo 1-fluorocicloprop-1-ilo, 2-fluorocicloprop-1-ilo, 2,2-difluorocicloprop-1-ilo, 1-fluorociclobut-1-ilo, 1-

trifluorometilcicloprop-1-ilo, 2-trifluorometilcicloprop-1-ilo, 1-cloro-cicloprop-1-ilo, 2-clorcicloprop-1-ilo, 2,2-diclorocicloprop-1-ilo, 3,3-difluorociclobutilo.

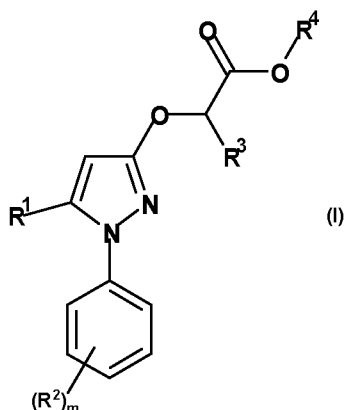
Si los compuestos pueden formar tautómeros por desplazamiento de hidrógeno, que formalmente en lo estructural no estarían cubiertos por la fórmula general (I), entonces estos tautómeros se incluyen no obstante en la definición de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención, a menos que un tautómero específico sea objeto de consideración. Por ejemplo, pueden existir muchos compuestos de carbonilo tanto en forma ceto como en forma enol, en los que ambas formas están incluidas en la definición del compuesto de la fórmula general (I).

Los compuestos de la fórmula general (I) pueden existir como estereoisómeros según el tipo y el enlace de los sustituyentes. Los estereoisómeros posibles mediante su forma espacial específica como enantiómeros, diastereómeros, isómeros Z y E son todos los comprendidos por la fórmula general (I). Si, por ejemplo, hay uno o más grupos alqueno, entonces pueden aparecer diastereómeros (isómeros Z y E). Si, por ejemplo, hay uno o más átomos de carbono asimétricos, entonces pueden aparecer enantiómeros y diastereómeros. Los estereoisómeros se pueden obtener a partir de mezclas que se producen en la producción según procedimientos de separación usuales. La separación por cromatografía se puede producir tanto en escala analítica para la comprobación del excedente enantiomérico o bien del excedente diastereomérico, como también en escala preparativa para la preparación de muestras de ensayo para la comprobación biológica. Asimismo, se pueden preparar selectivamente estereoisómeros por uso de reacciones estereoselectivas usando sustancias de partida y/o excipientes ópticamente activas. La invención se refiere así también a todos los estereoisómeros que están comprendidos por la fórmula general (I), sin embargo, no se indican con su estereoforma específica, así como sus mezclas.

Siempre que los compuestos se obtengan como sólidos, se puede producir la purificación también por recristalización o digestión. Siempre que compuestos (I) individuales no sean accesibles satisfactoriamente por las vías descritas más abajo, se pueden preparar por derivatización de otros compuestos (I).

Como procedimientos de aislamiento, purificación y separación de estereoisómeros de compuestos de la fórmula (I) se tienen en cuenta procedimientos que son conocidos por el experto en la técnica a partir de casos análogos, por ejemplo, por procedimientos físicos como cristalización, procedimientos de cromatografía, sobre todo cromatografía en columna y HPLC (cromatografía líquida de alta presión), destilación, opcionalmente a presión reducida, extracción y otros procedimientos, se pueden separar las mezclas opcionalmente restantes por lo general por separación cromatográfica, por ejemplo, en fases sólidas quirales. Para cantidades preparativas o en escala industrial, se tienen en cuenta procedimientos tales como cristalización, por ejemplo, de sales diastereoméricas que se pueden obtener a partir de mezclas diastereoméricas con ácidos ópticamente activos y opcionalmente en grupos ácidos existentes con bases ópticamente activas.

Síntesis de derivados de ácido {[1-(fenil)-5-(heteroaril)-1H-pirazol-3-il]oxi}acético de la fórmula general (I)

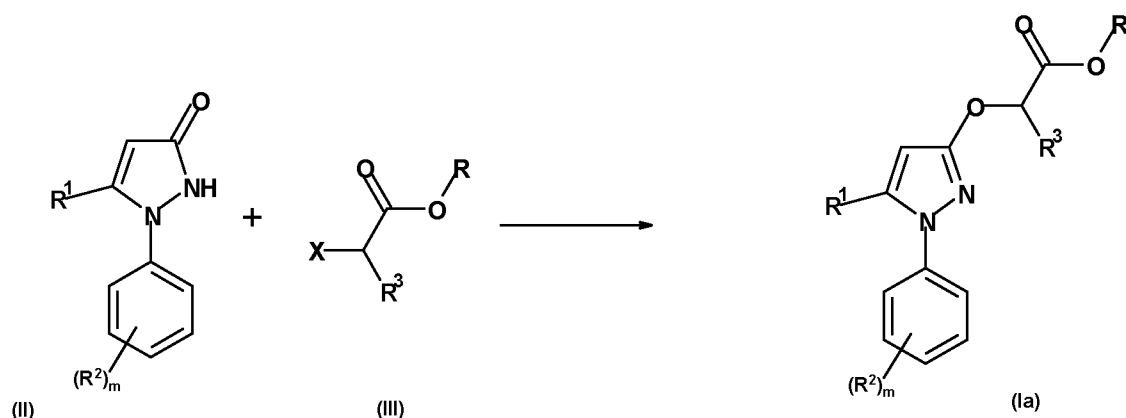


Los derivados de ácido {[1-(fenil)-5-(heteroaril)-1H-pirazol-3-il]oxi}acético según la invención de la fórmula general (I) se pueden preparar a partir de procedimientos conocidos. Las vías de síntesis empleadas e investigadas parten en este caso de ácidos 3-heteroarilprop-2-inoicos sustituidos asequibles en comercios o fácilmente preparables o bien ácidos heteroarilcinámicos sustituidos, de ésteres de ácido 3-heteroarilprop-2-inoico correspondientemente sustituidos o bien de ésteres de ácido heteroarilcinámico sustituidos y de productos químicos asequibles en comercios tales como fenilhidrazinas sustituidas y yodobencenos sustituidos.

Los grupos  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $m$  de la fórmula general (I) tienen los significados previamente definidos en los siguientes esquemas, a condición que no se den definiciones ilustrativas, pero no limitativas.

La síntesis de los compuestos de la fórmula general (Ia) según la invención se realiza mediante una reacción del compuesto de la fórmula general (II) con un compuesto de la fórmula general (III) en presencia de una base, como por

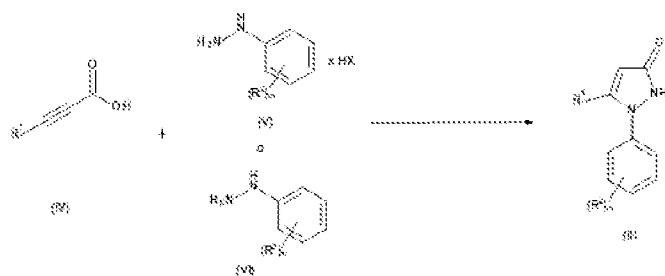
ejemplo carbonato de potasio. La reacción tiene lugar preferentemente en el intervalo de temperatura entre 0 °C y 120 °C, en un disolvente adecuado como, por ejemplo, acetonitrilo (véase el Esquema 1)



con X = halógeno y R= alquilo (C1–C4).

#### 5 Esquema 1.

La síntesis de los compuestos de la fórmula general (II) se produce a través de un acoplamiento de amida con posterior ciclación de un ácido de la fórmula general (IV) con un hidrohalegeno de fenilhidrazina de la fórmula general (V) en presencia de un reactivo de acoplamiento tales como, por ejemplo, T3P, dicitohexilcarbodiimida, *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida, *N,N'*-carbonildiimidazol, cloruro de 2-cloro-1,3-dimetil-imidazol o yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio (ver Chemistry of Peptide Synthesis, Ed. N. Leo Benoiton, Taylor & Francis, 2006, ISBN-10: 1-57444-454-9). Los reactivos unidos a polímero tales como, por ejemplo, dicitohexilcarbodiimida unida a polímero, también son apropiados para esta reacción de acoplamiento. La reacción tiene lugar preferentemente en un intervalo de temperaturas de entre 0 °C y 80 °C, en un disolvente adecuado tales como, por ejemplo, diclorometano, acetonitrilo, *N,N*-dimetil-formamida o acetato de etilo y en presencia de una base tales como, por ejemplo, trietilamina, *N,N*-diisopropilietilamina o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ceno (ver el Esquema 2). Para las condiciones de acoplamiento de T3P, ver *Organic Process Research & Development* 2009, 13, 900–906. Alternativamente al hidrohalegeno de fenilhidrazina de la fórmula general (V), se puede usar una fenilhidrazina (VI) correspondientemente sustituida en la reacción.



20 con X = halógeno.

#### Esquema 2.

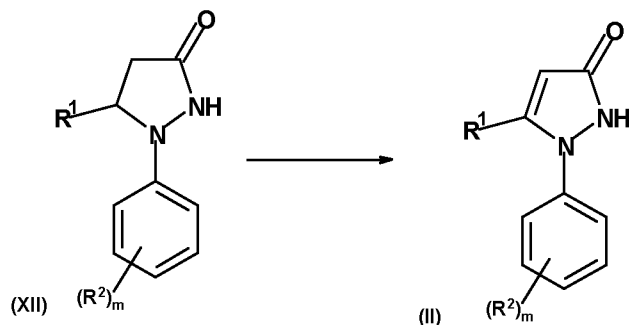
La síntesis de los compuestos de la fórmula general (IV) se puede llevar a cabo por reacción del compuesto de la fórmula general (VII) con ácido propiólico (VIII) con adición de una cantidad adecuada de un catalizador de metal de transición, en especial catalizadores de paladio tales como tetrakis-(trifenilfosfina)paladio (0) o diacetato de paladio o dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio (II) o catalizadores de níquel tales como acetilacetonato de níquel (II) o cloruro de bis(trifenilfosfina)níquel (II) preferentemente a temperatura elevada en un disolvente orgánico tales como, por ejemplo, 1,2-dimetoxietano o *N,N*-dimetilformamida (Esquema 3). El radical "M" representa, por ejemplo, magnesio, zinc, litio o sodio. En general, son apropiados procedimientos de acoplamientos cruzados que se describen en R. D. Larsen, *Organometallics in Process Chemistry* 2004 Springer Verlag, o en I. Tsuji, *Palladium Reagents and Catalysts* 2004 Wiley, o en M. Belier, C. Bolm, *Transition Metals for Organic Synthesis* 2004 VCH-Wiley. Otros procedimientos de síntesis apropiados se describen en Chem. Rev. 2006, 106, 2651; Platinum Metals Review, 2009, 53, 183; Platinum Metals Review 2008, 52, 172 y Acc. Chem. Res. 2008, 41, 1486.



con R' = alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)

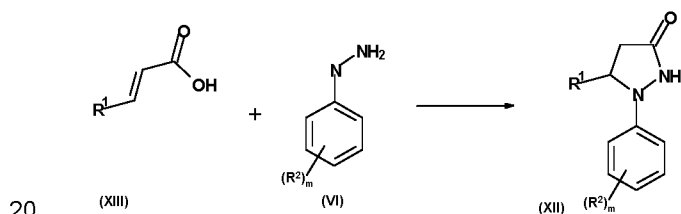
Esquema 5.

La síntesis de los compuestos de la fórmula general (II) se produce alternativamente por oxidación de los compuestos de la fórmula general (XII) en presencia de un halogenuro de hierro tales como, por ejemplo, cloruro de hierro (III). La reacción tiene lugar preferentemente en el intervalo de temperaturas de entre 0 °C y 120 °C, en un disolvente adecuado tales como, por ejemplo, 1,2-dicloroetano, acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida o acetato de etilo (Esquema 6).



Esquema 6.

Los compuestos de la fórmula general (XII) se pueden preparar por medio de un acoplamiento de amida de un ácido de la fórmula general (XIII) con una arilhidrazina de la fórmula general (VI) en presencia de un reactivo de acoplamiento de amida tales como, por ejemplo, T3P, dicitclohexilcarbodiimida, *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida, *N,N'*-carbonildiimidazol, cloruro de 2-cloro-1,3-dimetilimidazol o yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio (ver Chemistry of Peptide Synthesis, Ed. N. Leo Benoiton, Taylor & Francis, 2006, ISBN-10: 1-57444-454-9) y posterior ciclación. Los reactivos unidos a polímero tales como, por ejemplo, dicitclohexilcarbodiimida unida a polímero también son apropiados para esta reacción de acoplamiento. La reacción tiene lugar preferentemente en el intervalo de temperaturas de entre 0 °C y 80 °C, en un disolvente adecuado tales como, por ejemplo, diclorometano, acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida o acetato de etilo y en presencia de una base tales como, por ejemplo, trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ceno (ver el Esquema 7). Para las condiciones de acoplamiento de péptidos T3P, ver *Organic Process Research & Development* 2009, 13, 900-906.



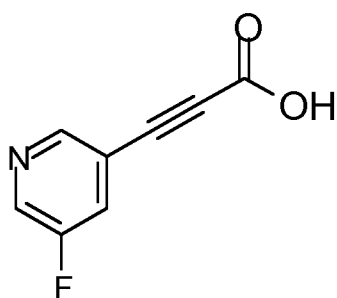
Esquema 7.

Los ejemplos de síntesis detallados seleccionados para los compuestos de la fórmula general (I) según la invención se enumeran a continuación. Los números de ejemplo indicados corresponden a las numeraciones mencionadas en las siguientes Tablas I.1 a I.77. Los datos espectroscópicos <sup>1</sup>H-RMN, <sup>13</sup>C-RMN y <sup>19</sup>F-RMN, dados para los ejemplos químicos descritos en las siguientes secciones, (400 MHz para <sup>1</sup>H-RMN y 150 MHz para <sup>13</sup>C-RMN y 375 MHz para <sup>19</sup>F-RMN, disolvente CDCl<sub>3</sub>, CD<sub>3</sub>OD o d<sub>6</sub>-DMSO, estándar interno: tetrametilsilano δ = 0.00 ppm), se obtuvieron con un dispositivo de la empresa Bruker y las señales tienen los significados que se indican a continuación: br = amplio; s = singlete, d = doblete, t = triplete, dd = doblete de dobletes, ddd = doblete de un doblete de doblete, m = multiplete, q = cuarteto, quint = quinteto, sext = sexteto, sept = septeto, dq = doblete de cuarteto, dt = doblete de triplete. Cuando existen mezclas diastereoisoméricas se indican o bien las respectivas señales significativas de ambos diastereómeros o la señal característica del diastereómero principal. Las abreviaturas utilizadas para los grupos químicos tienen por ejemplo los siguientes significados: Me = CH<sub>3</sub>, Et = CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, t-Hex = C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, t-Bu = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-Bu = butilo no ramificado, n-Pr = propilo no ramificado, i-Pr = propilo ramificado, c-Pr = ciclopropilo, c-Hex = ciclohexilo.

Ejemplos de síntesis:

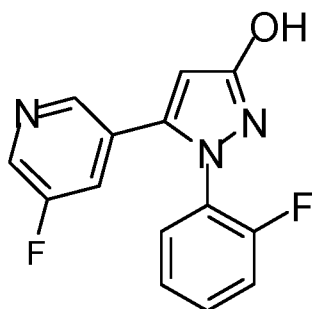
35 Ejemplo de síntesis N.º: I.50-2

Etapa de síntesis 1: ácido 3-(5-fluoropiridin-3-il)prop-2-inoico



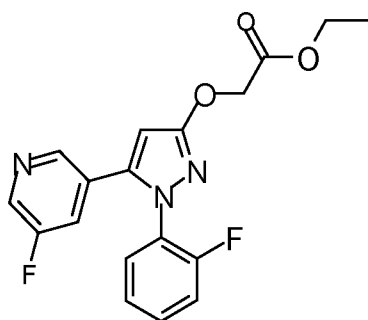
3-fluoro-5-yodopiridina (5,00 g, 22,40 mmol, 1,0 equiv) se disolvió bajo una atmósfera de argón en THF (105 ml). La solución se mezcló a continuación, con ácido propiónico (1,58 g, 22,40 mmol, 1,0 equiv), dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio (II) (310 mg, 0,89 mmol, 0,04 equiv), yoduro de cobre (I) (310 mg, 0,04 equiv) y diisopropilamina (7,9 g, 78,4 mmol, 3,5 equiv). La mezcla de reacción se agitó durante 2 h a temperatura ambiente, se vertió posteriormente gota a gota en agua (100 ml) y la mezcla se acidificó con ácido clorhídrico 2 M (30 ml). La mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo (150 ml). Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y el disolvente se eliminó al vacío. El residuo se mezcló con éter dietílico (50 ml) y se trató durante 10 min en baño ultrasónico a temperatura ambiente y, a continuación, se filtró. El filtrado se concentró al vacío. El ácido 3-(5-fluoropiridin-3-il)prop-2-inoico se aisló en forma de un sólido (4,38 g, 75 % del teórico). <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, DMSO-d<sup>6</sup> δ, ppm) 14.00 (bs, 1H), 8.57 (m, 1H), 8.32–8.28 (m, 1H), 7.52 (m, 1H).

Etapa de síntesis 2: 1-(2-fluorofenil)-5-(5-fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-3-ol



El ácido 3-(5-fluoropiridin-3-il)prop-2-inoico (4,38 g, 26,50 mmol, 1,0 equiv) se disolvió en THF (20 ml). La solución se mezcló con clorhidrato de (2-fluorofenil)hidrazina (1:1) (4,90 g, 29,10 mmol, 1,1 equiv) y trietilamina (9,20 ml, 66,3 mmol). A continuación, se vertió gota a gota una solución al 50% de T3P en THF (31 ml, 53 mmol, 2,0 equiv.) y la mezcla de reacción se agita durante 1 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se extrajo con agua (50 ml) y dos veces con acetato de etilo (100 ml). Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y el disolvente se eliminó al vacío. 1-(2-fluorofenil)-5-(5-fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-3-ol se aisló en forma de un aceite (7,00 g, 85 % del teórico). El producto de reacción se usó sin ulterior purificación en la siguiente etapa de síntesis.

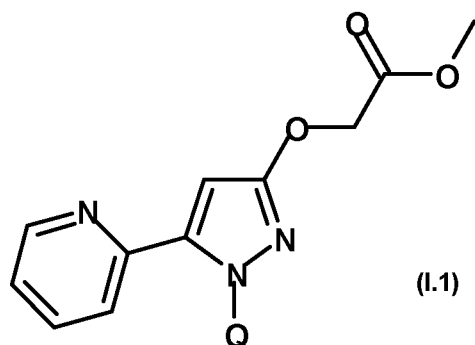
Etapa de síntesis 3: {[1-(2-fluorofenil)-5-(5-fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-3-il]oxi}acetato de etilo (Ejemplo de síntesis I.50-2)



1-(2-fluorofenil)-5-(5-fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-3-ol (2,45 g, 8,96 mmol, 1,0 equiv) y carbonato de potasio (3,78 g, 26,91 mmol, 3 equiv) se suspendieron en acetona (10 ml) y a continuación, se mezclaron con éster etílico de ácido

5 bromoacético (1,49 g, 8,96 mmol, 1,0 equiv). Posteriormente se calentó la suspensión 2 h hasta 80 °C, se filtró el sólido y la mezcla de reacción se concentró al vacío. El residuo se extrajo con DCM y agua y a continuación, se purificó por cromatografía en columna (gradiente de acetato de etilo/heptano). {[1-(2-fluorofenil)-5-(5-fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-3-il]oxi}acetato de etilo se aisló en forma de un sólido incoloro (14,20 g, 44 % del teórico). <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 1.23 (t, 3H), 4.31 (q, 2H), 6.21 (s, 1H), 5.1 (t, 1H), 7.2 (m, 2H), 7.4 (m, 1H), 7.5 (m, 1H), 8.4 (s, 1H), 8.5 (s, 1H).

Análogamente a los ejemplos de preparación antes mencionados y citados en el lugar correspondiente, y teniendo en cuenta los datos generales para la preparación de derivados de ácido {[1-(fenil)-5-(heteroaril)-1H-pirazol-3-il]oxi}acético se obtienen los compuestos mencionados a continuación:



10

Tabla I.1: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.1) son los compuestos I.1-1 a I.1-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.1-1 a I.1-53 de la Tabla I.1 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

Tabla 1:

N.º	Q
1	Q-2.1
2	Q-2.2
3	Q-2.3
4	Q-2.4
5	Q-2.5
6	Q-2.6
7	Q-2.7
8	Q-2.8
9	Q-2.9
10	Q-2.10
11	Q-2.11
12	Q-2.12
13	Q-2.13
14	Q-2.14
15	Q-2.15
16	Q-2.16
17	Q-2.17
18	Q-2.18

# ES 3 018 232 T3

N.º	Q
19	Q-2.19
20	Q-2.20
21	Q-2.21
22	Q-2.22
23	Q-2.23
24	Q-2.24
25	Q-2.25
26	Q-2.26
27	Q-2.27
28	Q-2.28
29	Q-2.29
30	Q-2.30
31	Q-2.31
32	Q-2.32
33	Q-2.33
34	Q-2.34
35	Q-2.35
36	Q-2.36
37	Q-2.37
38	Q-2.38
39	Q-2.39
40	Q-2.40
41	Q-2.41
42	Q-2.42
43	Q-2.43
44	Q-2.44
45	Q-2.45
46	Q-2.46
47	Q-2.47
48	Q-2.48
49	Q-2.49
50	Q-2.50
51	Q-2.51
52	Q-2.52

N.º	Q
53	Q-2.53

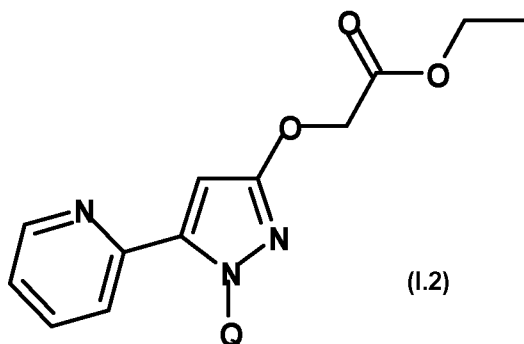
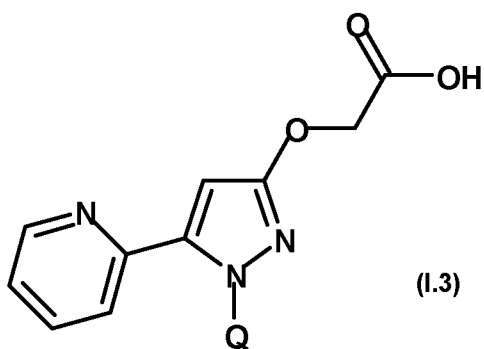
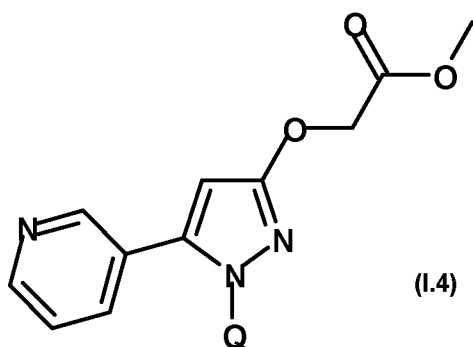


Tabla I.2: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.2) son los compuestos I.2-1 a I.2-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.2-1 a I.2-53 de la Tabla I.2 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.3: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.3) son los compuestos I.3-1 a I.3-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.3-1 a I.3-53 de la Tabla I.3 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.4: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.4) son los compuestos I.4-1 a I.4-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.4-1 a I.4-53 de la Tabla I.4 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

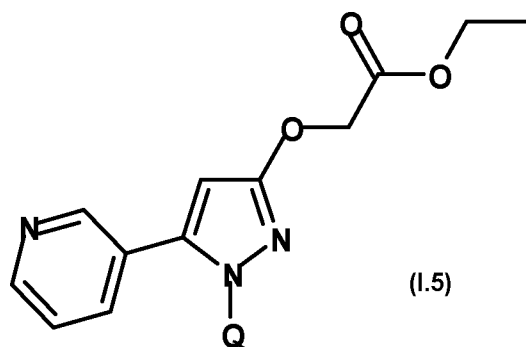
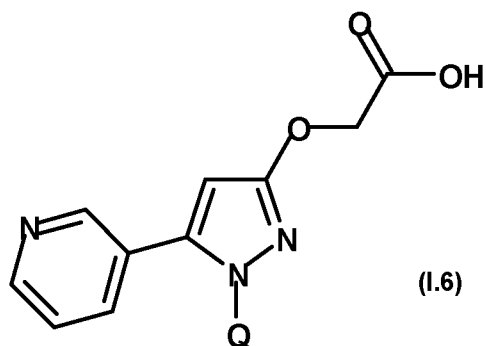
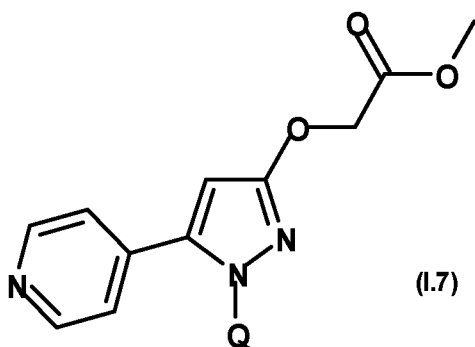


Tabla I.5: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.5) son los compuestos I.5-1 a I.5-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.5-1 a I.5-53 de la Tabla I.5 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.6: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.6) son los compuestos I.6-1 a I.6-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.6-1 a I.6-53 de la Tabla I.6 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.7: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.7) son los compuestos I.7-1 a I.7-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.7-1 a I.7-53 de la Tabla I.7 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

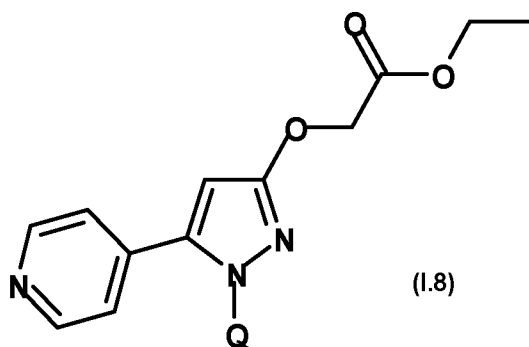
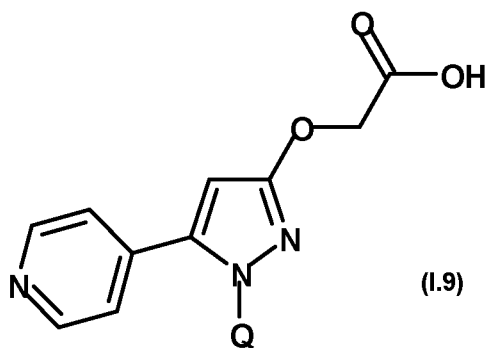
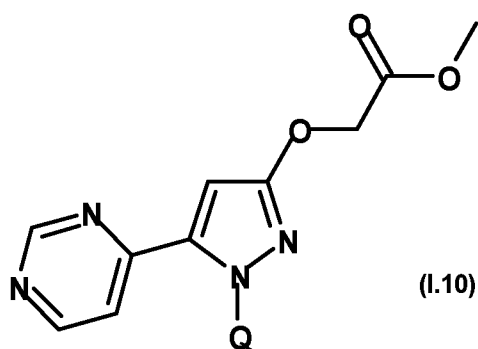


Tabla I.8: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.8) son los compuestos I.8-1 a I.8-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.8-1 a I.8-53 de la Tabla I.8 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.9: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.9) son los compuestos I.9-1 a I.9-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.9-1 a I.9-53 de la Tabla I.9 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.10: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.10) son los compuestos I.10-1 a I.10-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.10-1 a I.10-53 de la Tabla I.10 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

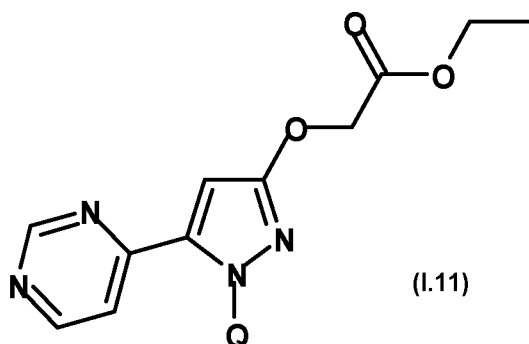
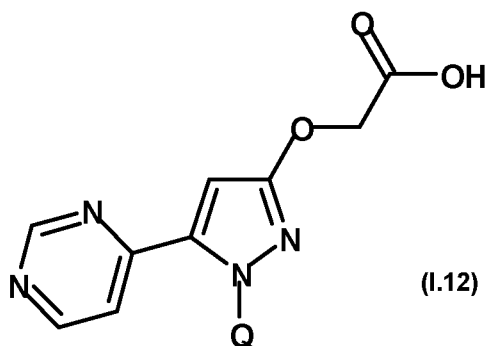
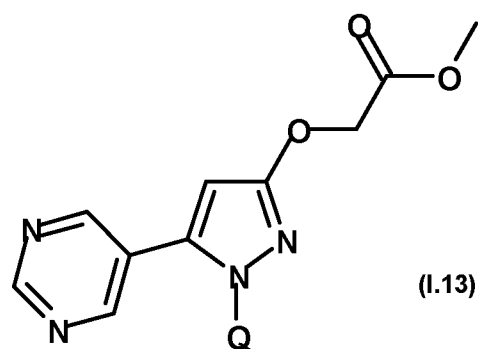


Tabla I.11: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.11) son los compuestos I.11-1 a I.11-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.11-1 a I.11-53 de la Tabla I.11 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.12: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.12) son los compuestos I.12-1 a I.12-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.12-1 a I.12-53 de la Tabla I.12 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.13: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.13) son los compuestos I.13-1 a I.13-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.13-1 a I.13-53 de la Tabla I.13 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

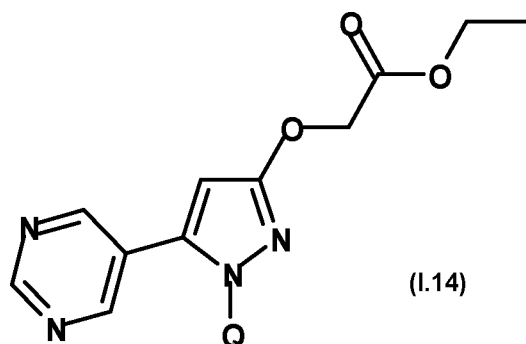
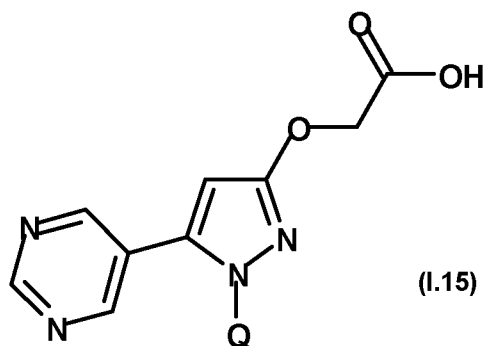
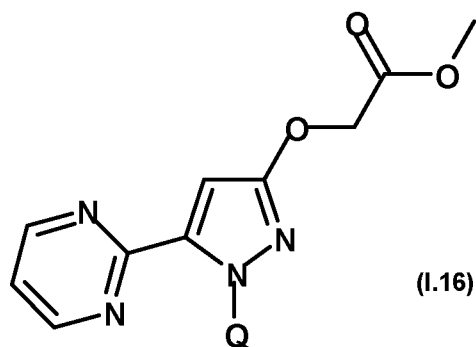


Tabla I.14: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.14) son los compuestos I.14-1 a I.14-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.14-1 a I.14-53 de la Tabla I.14 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.15: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.15) son los compuestos I.15-1 a I.15-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.15-1 a I.15-53 de la Tabla I.15 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.16: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.16) son los compuestos I.16-1 a I.16-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.16-1 a I.16-53 de la Tabla I.16 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

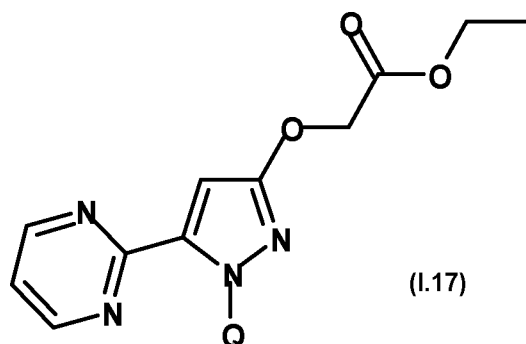
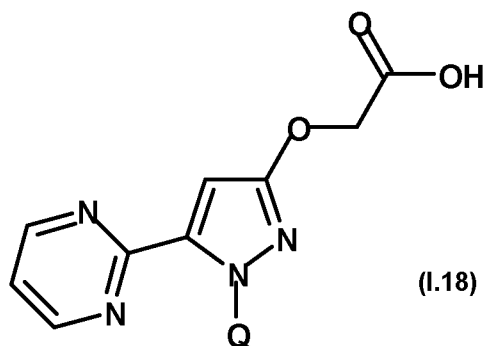
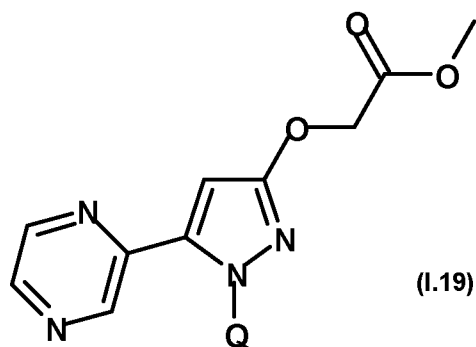


Tabla I.17: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.17) son los compuestos I.17-1 a I.17-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.17-1 a I.17-53 de la Tabla I.17 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.18: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.18) son los compuestos I.18-1 a I.18-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.18-1 a I.18-53 de la Tabla I.18 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.19: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.19) son los compuestos I.19-1 a I.19-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.19-1 a I.19-53 de la Tabla I.19 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

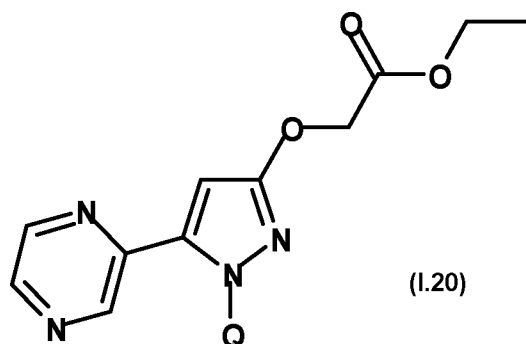
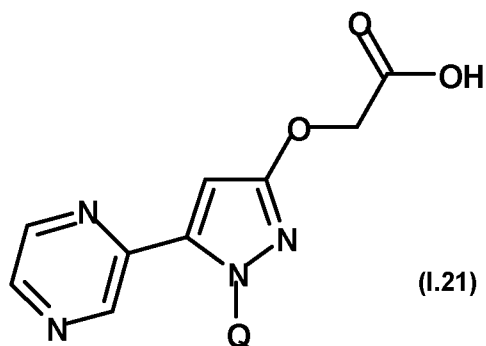
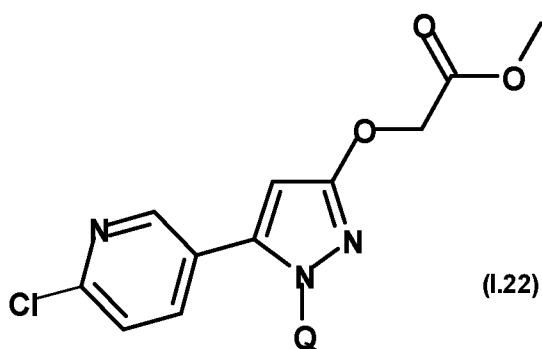


Tabla I.20: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.20) son los compuestos I.20-1 a I.20-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.20-1 a I.20-53 de la Tabla I.20 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.21: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.21) son los compuestos I.21-1 a I.21-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.21-1 a I.21-53 de la Tabla I.21 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.22: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.22) son los compuestos I.22-1 a I.22-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.22-1 a I.22-53 de la Tabla I.22 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

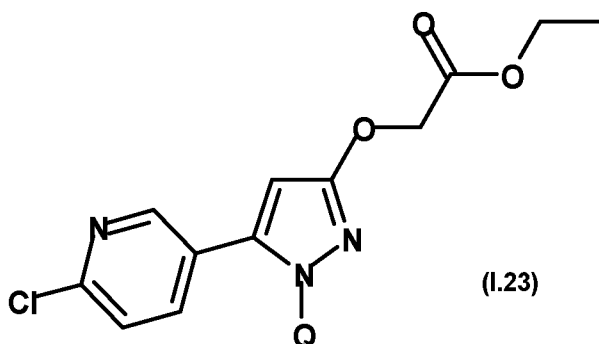
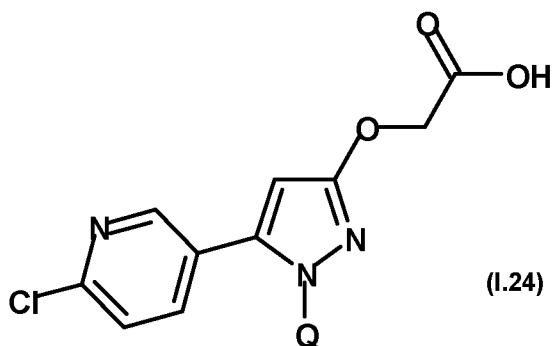
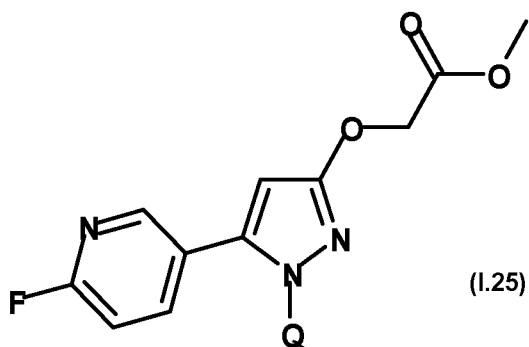


Tabla I.23: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.23) son los compuestos I.23-1 a I.23-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.23-1 a I.23-53 de la Tabla I.23 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.24: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.24) son los compuestos I.24-1 a I.24-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.24-1 a I.24-53 de la Tabla I.24 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.25: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.25) son los compuestos I.25-1 a I.25-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.25-1 a I.25-53 de la Tabla I.25 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

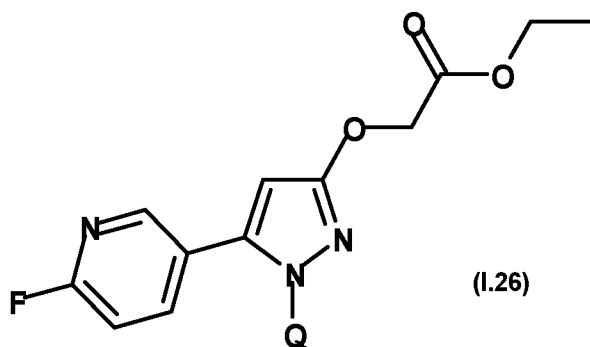
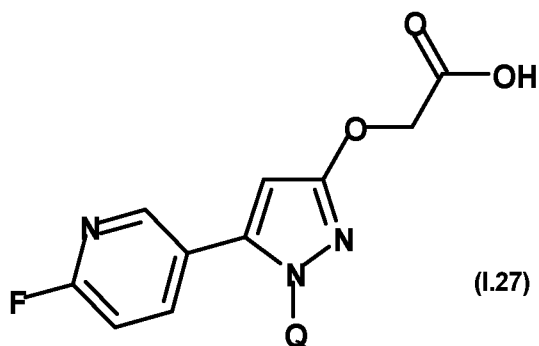
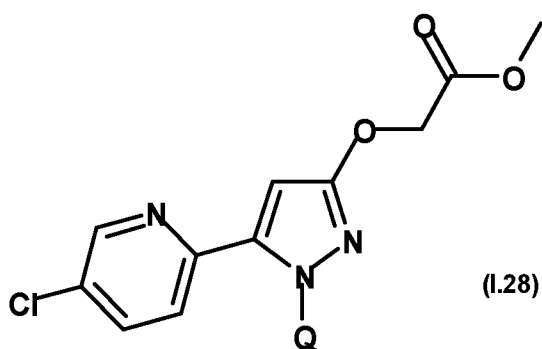


Tabla I.26: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.26) son los compuestos I.26-1 a I.26-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.26-1 a I.26-53 de la Tabla I.26 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.27: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.27) son los compuestos I.27-1 a I.27-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.27-1 a I.27-53 de la Tabla I.27 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.28: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.28) son los compuestos I.28-1 a I.28-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.28-1 a I.28-53 de la Tabla I.28 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

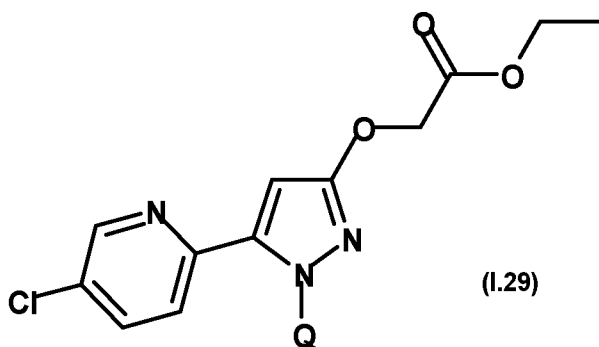
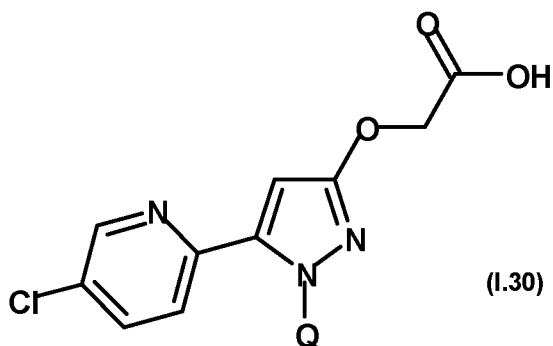
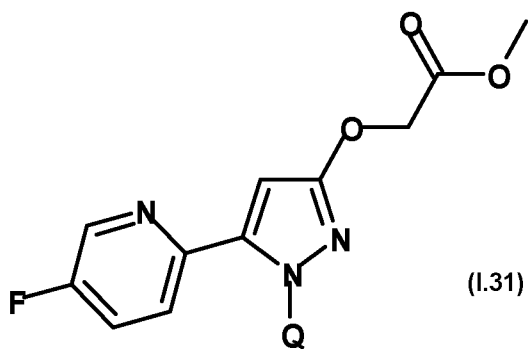


Tabla I.29: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.29) son los compuestos I.29-1 a I.29-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.29-1 a I.29-53 de la Tabla I.29 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.30: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.30) son los compuestos I.30-1 a I.30-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.30-1 a I.30-53 de la Tabla I.30 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.31: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.31) son los compuestos I.31-1 a I.31-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.31-1 a I.31-53 de la Tabla I.31 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

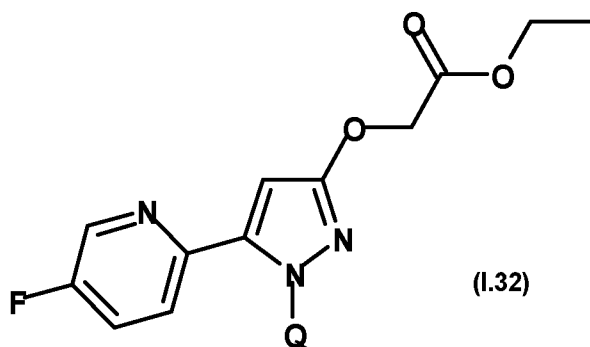


Tabla I.32: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.32) son los compuestos I.32-1 a I.32-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.32-1 a I.32-53 de la Tabla I.32 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

5

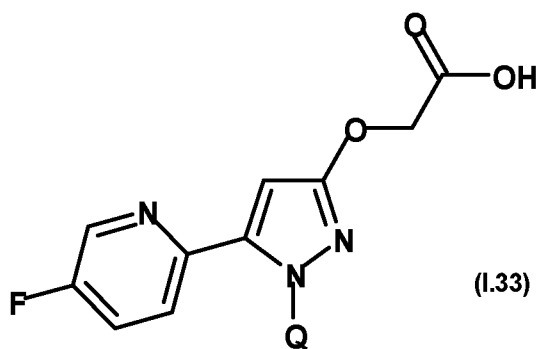
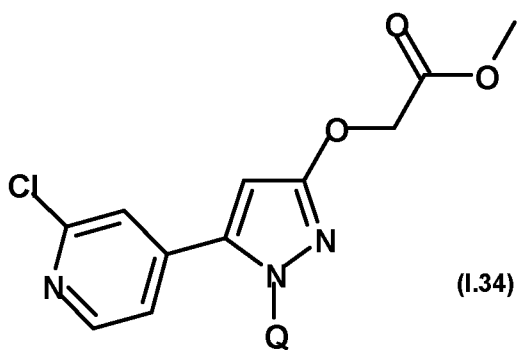


Tabla I.33: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.33) son los compuestos I.33-1 a I.33-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.33-1 a I.33-53 de la Tabla I.33 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10

Tabla I.34: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.34) son los compuestos I.34-1 a I.34-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.34-1 a I.34-53 de la Tabla I.34 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

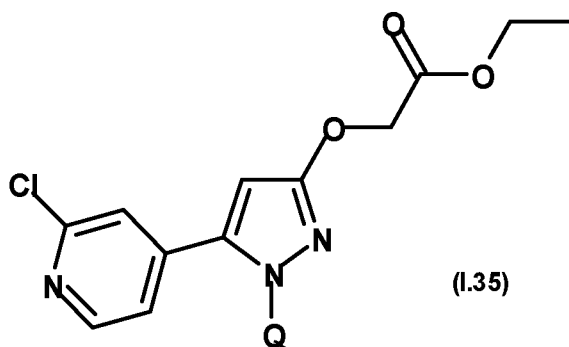
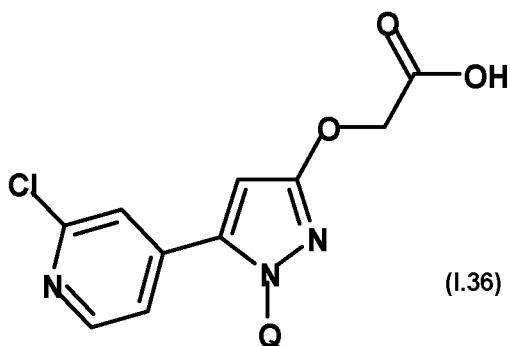
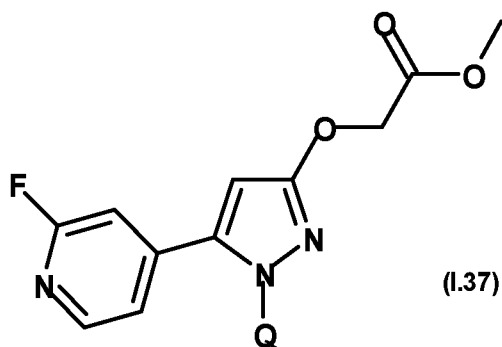


Tabla I.35: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.35) son los compuestos I.35-1 a I.35-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.35-1 a I.35-53 de la Tabla I.35 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.36: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.36) son los compuestos I.36-1 a I.36-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.36-1 a I.36-53 de la Tabla I.36 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.37: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.37) son los compuestos I.37-1 a I.37-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.37-1 a I.37-53 de la Tabla I.37 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

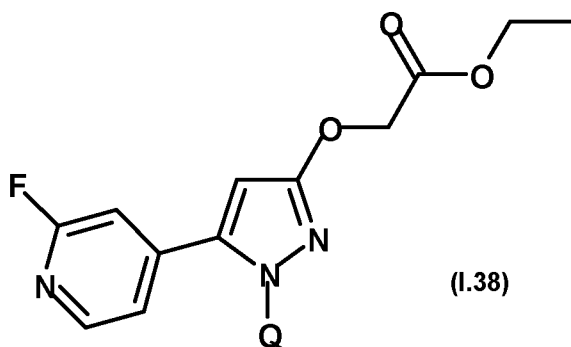
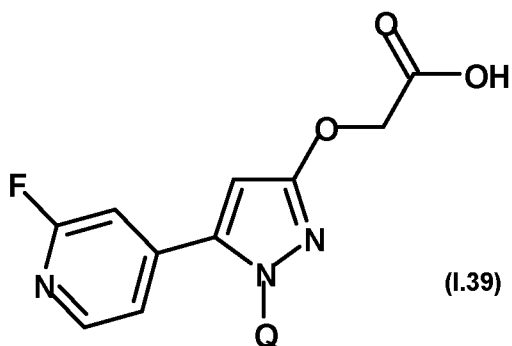
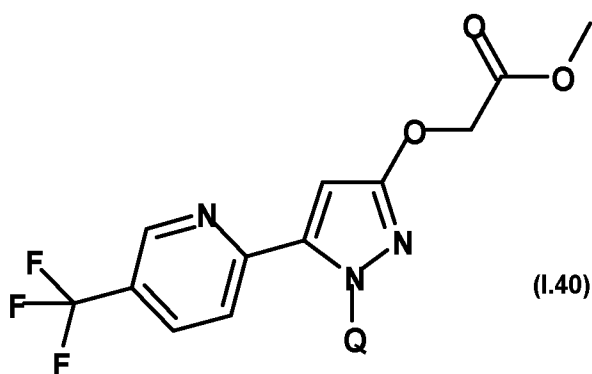


Tabla I.38: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.38) son los compuestos I.38-1 a I.38-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.38-1 a I.38-53 de la Tabla I.38 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.39: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.39) son los compuestos I.39-1 a I.39-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.39-1 a I.39-53 de la Tabla I.39 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.40: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.40) son los compuestos I.40-1 a I.40-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.40-1 a I.40-53 de la Tabla I.40 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

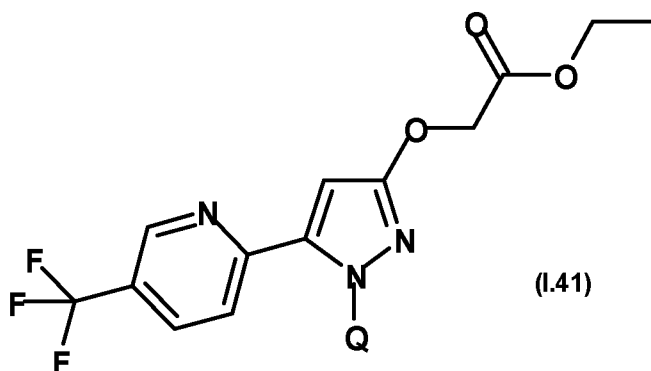
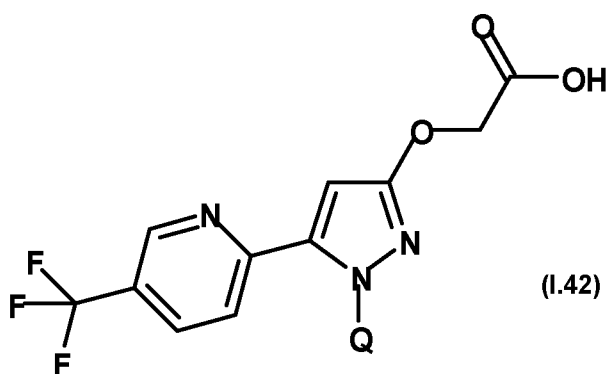
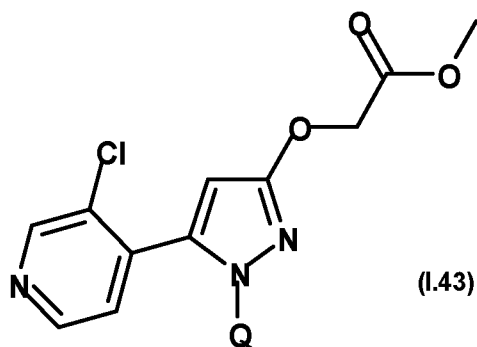


Tabla I.41: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.41) son los compuestos I.41-1 a I.41-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.41-1 a I.41-53 de la Tabla I.41 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.42: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.42) son los compuestos I.42-1 a I.42-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.42-1 a I.42-53 de la Tabla I.42 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.43: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.4) son los compuestos I.43-1 a I.43-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.43-1 a I.43-53 de la Tabla I.43 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

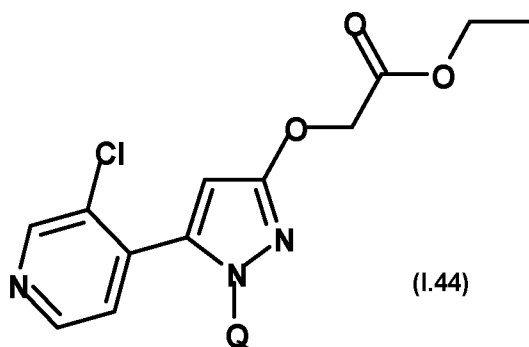
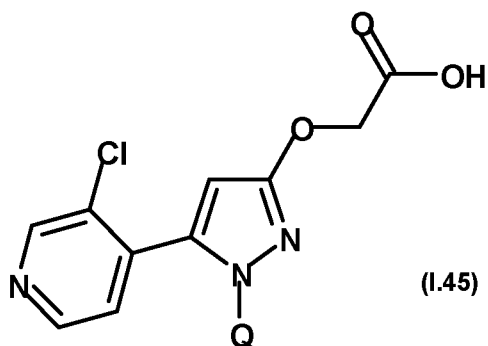
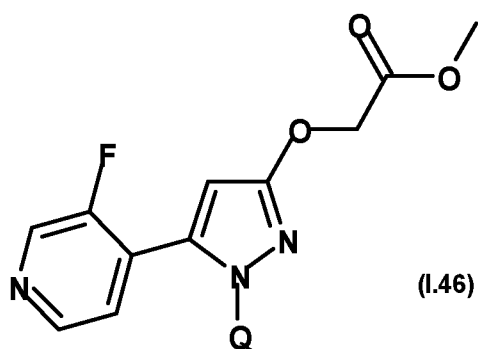


Tabla I.44: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.44) son los compuestos I.44-1 a I.44-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.44-1 a I.44-53 de la Tabla I.44 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.45: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.45) son los compuestos I.45-1 a I.45-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.45-1 a I.45-53 de la Tabla I.45 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.46: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.46) son los compuestos I.46-1 a I.46-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.46-1 a I.46-53 de la Tabla I.46 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

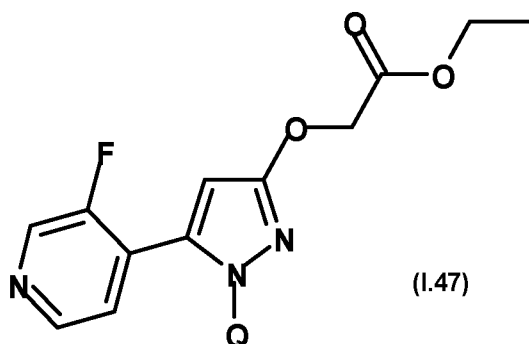
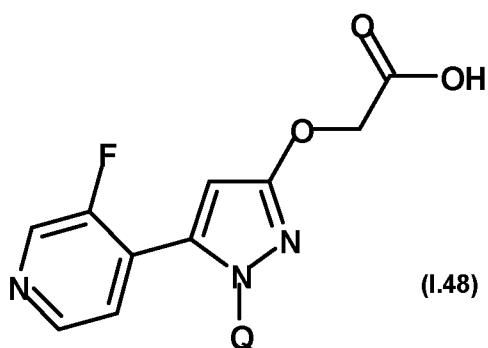
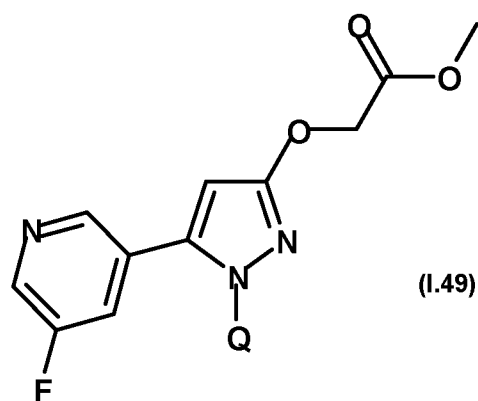


Tabla I.47: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.47) son los compuestos I.47-1 a I.47-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.47-1 a I.47-53 de la Tabla I.47 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.48: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.48) son los compuestos I.48-1 a I.48-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.48-1 a I.48-53 de la Tabla I.48 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.49: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.49) son los compuestos I.49-1 a I.49-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.49-1 a I.49-53 de la Tabla I.49 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

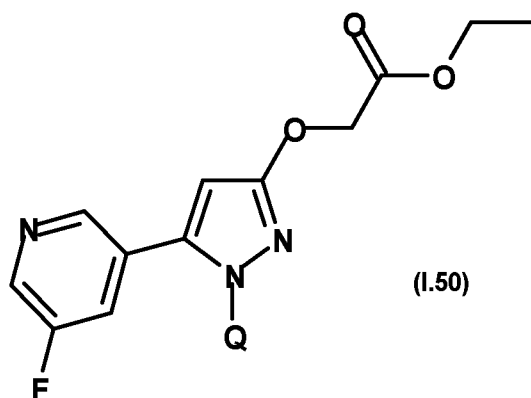
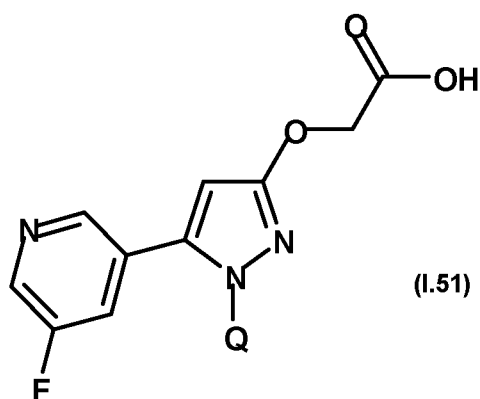
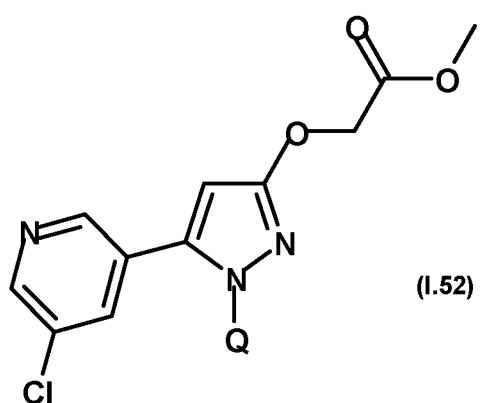


Tabla I.50: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.50) son los compuestos I.50-1 a I.50-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.50-1 a I.50-53 de la Tabla I.50 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.51: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.51) son los compuestos I.51-1 a I.51-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.51-1 a I.51-53 de la Tabla I.51 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.52: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.52) son los compuestos I.52-1 a I.52-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.52-1 a I.52-53 de la Tabla I.52 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

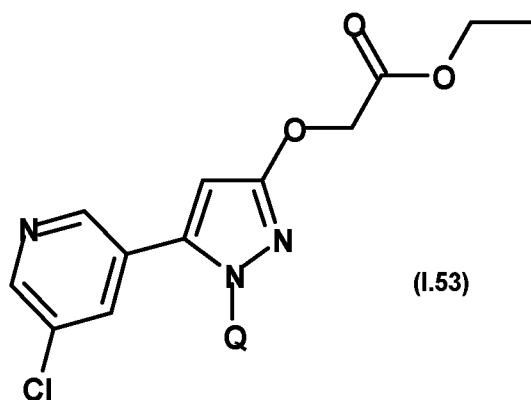
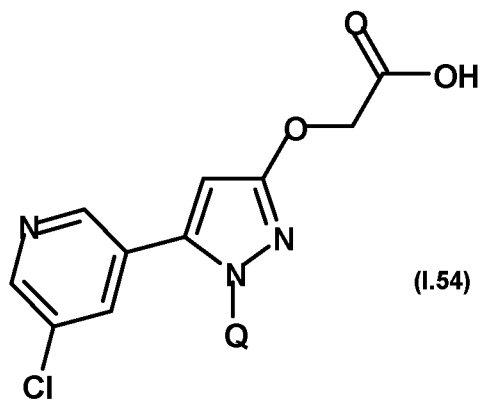
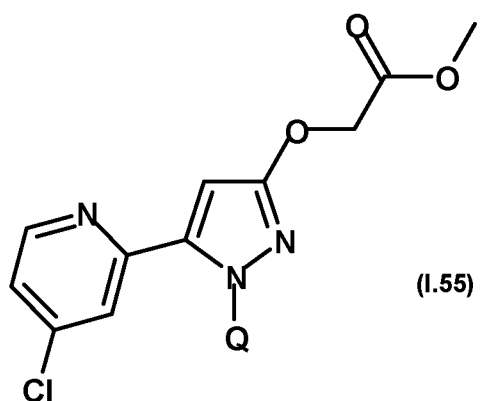


Tabla I.53: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.53) son los compuestos I.53-1 a I.53-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.53-1 a I.53-53 de la Tabla I.53 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.54: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.54) son los compuestos I.54-1 a I.54-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.54-1 a I.54-53 de la Tabla I.54 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.55: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.55) son los compuestos I.55-1 a I.55-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.55-1 a I.55-53 de la Tabla I.55 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

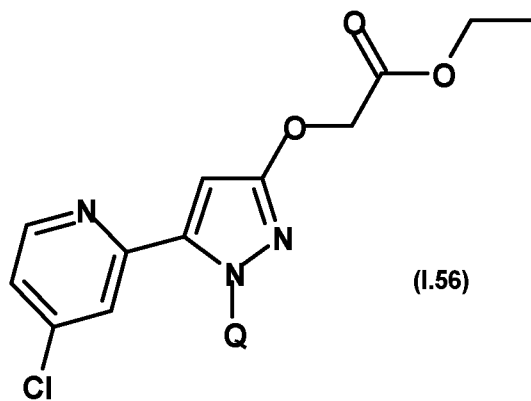
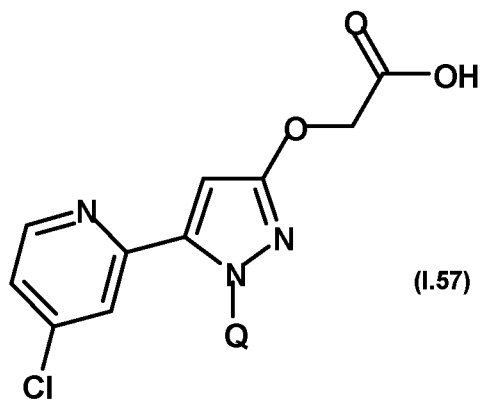
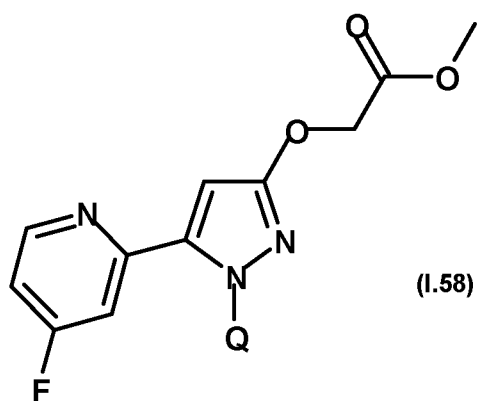


Tabla I.56: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.56) son los compuestos I.56-1 a I.56-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.56-1 a I.56-53 de la Tabla I.56 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.57: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.57) son los compuestos I.57-1 a I.57-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.57-1 a I.57-53 de la Tabla I.57 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.58: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.58) son los compuestos I.58-1 a I.58-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.58-1 a I.58-53 de la Tabla I.58 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

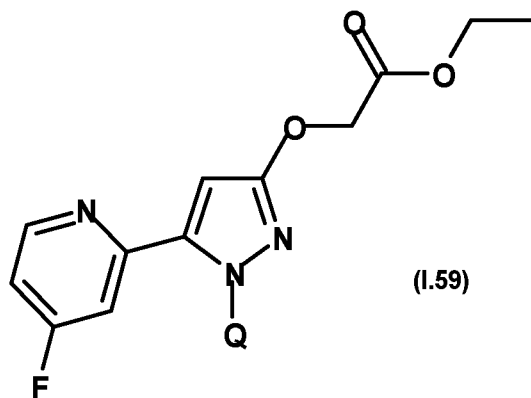
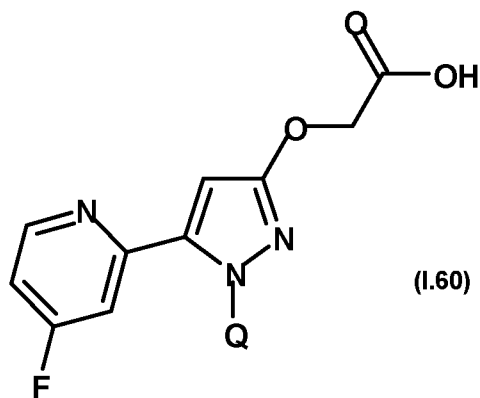
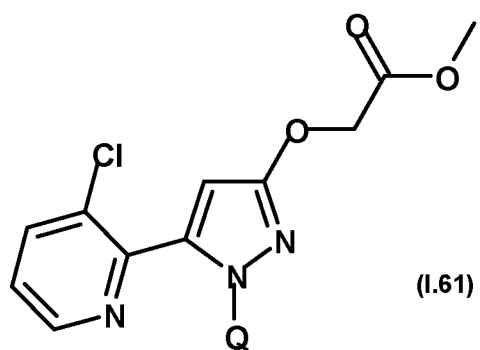


Tabla I.59: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.59) son los compuestos I.59-1 a I.59-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.59-1 a I.59-53 de la Tabla I.59 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.60: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.60) son los compuestos I.60-1 a I.60-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.60-1 a I.60-53 de la Tabla I.60 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.61: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.61) son los compuestos I.61-1 a I.61-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.61-1 a I.61-53 de la Tabla I.61 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

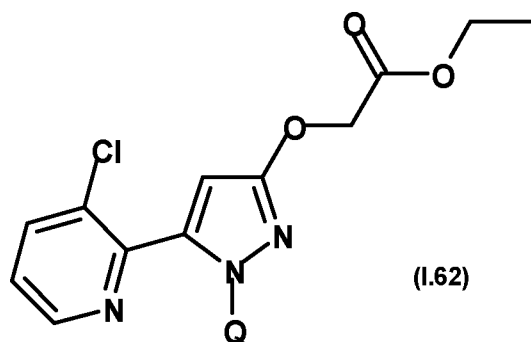
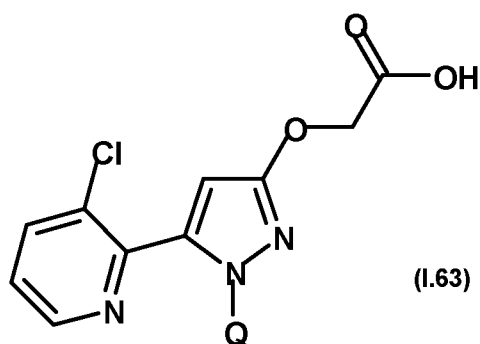
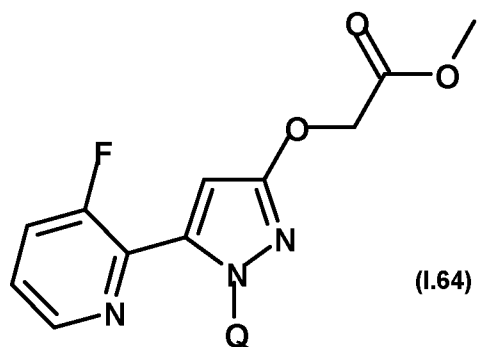


Tabla I.62: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.62) son los compuestos I.62-1 a I.62-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.62-1 a I.62-53 de la Tabla I.62 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.63: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.63) son los compuestos I.63-1 a I.63-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.63-1 a I.63-53 de la Tabla I.63 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.64: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.64) son los compuestos I.64-1 a I.64-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.64-1 a I.64-53 de la Tabla I.64 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

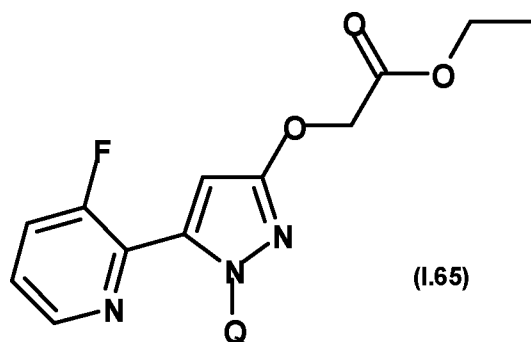
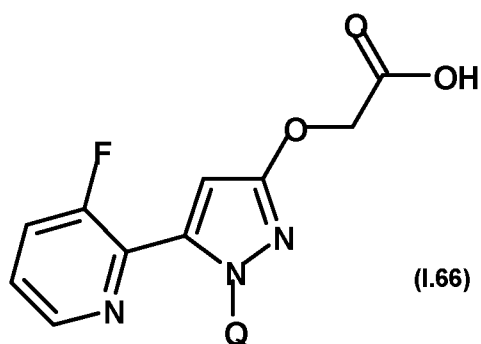
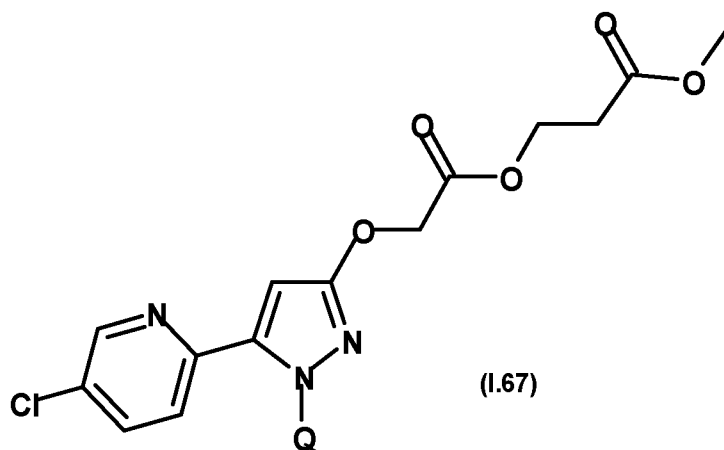


Tabla I.65: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.65) son los compuestos I.65-1 a I.65-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.65-1 a I.65-53 de la Tabla I.65 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.66: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.66) son los compuestos I.66-1 a I.66-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.66-1 a I.66-53 de la Tabla I.66 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.67: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.67) son los compuestos I.67-1 a I.67-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.67-1 a I.67-53 de la Tabla I.67 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

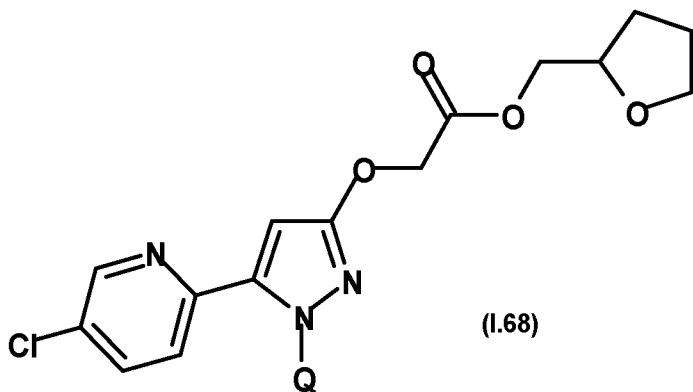
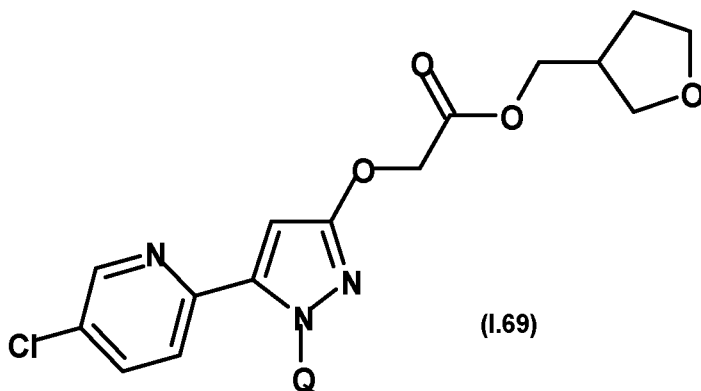
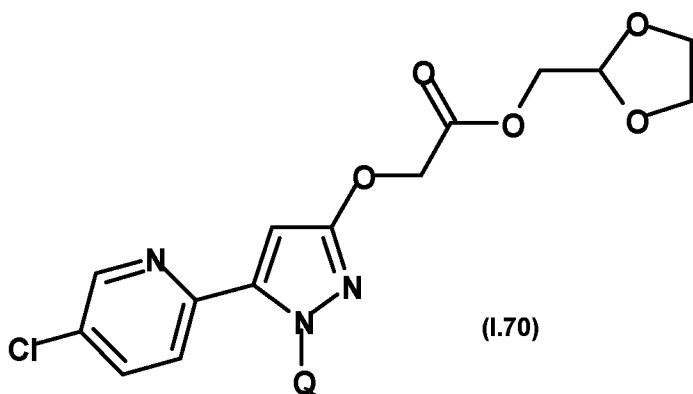


Tabla I.68: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.68) son los compuestos I.68-1 a I.68-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.68-1 a I.68-53 de la Tabla I.68 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.69: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.69) son los compuestos I.69-1 a I.69-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.69-1 a I.69-53 de la Tabla I.69 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.70: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.70) son los compuestos I.70-1 a I.70-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.70-1 a I.70-53 de la Tabla I.70 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

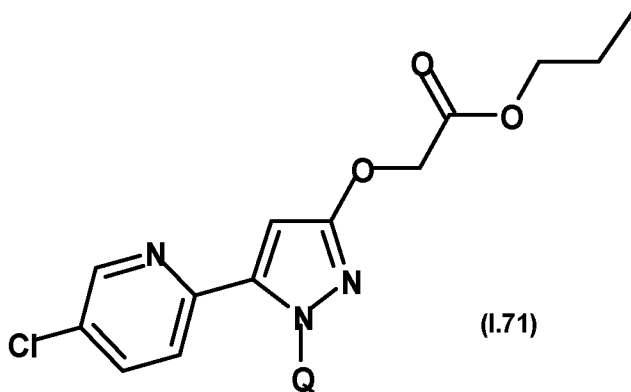
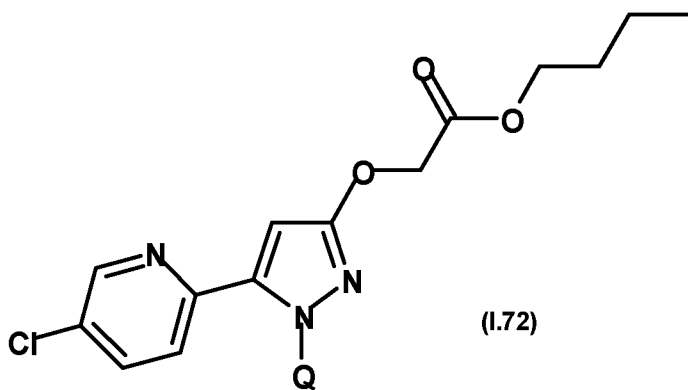
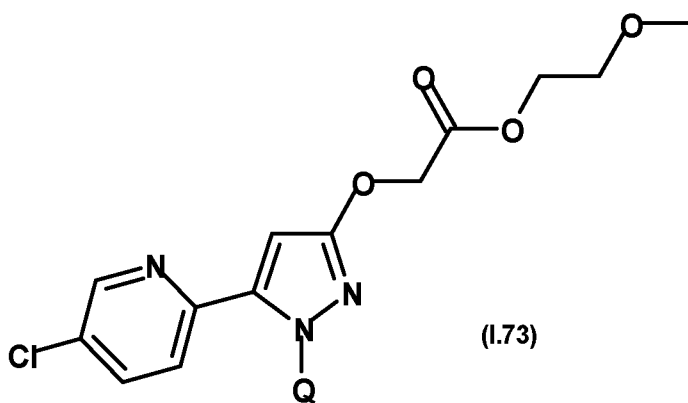


Tabla I.71: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.71) son los compuestos I.71-1 a I.71-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.71-1 a I.71-53 de la Tabla I.71 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.72: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.72) son los compuestos I.72-1 a I.72-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.72-1 a I.72-53 de la Tabla I.72 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.73: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.73) son los compuestos I.73-1 a I.73-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.73-1 a I.73-53 de la Tabla I.73 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

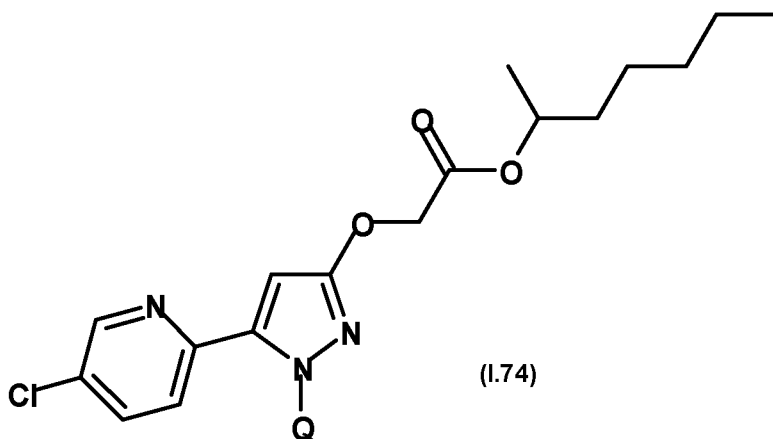
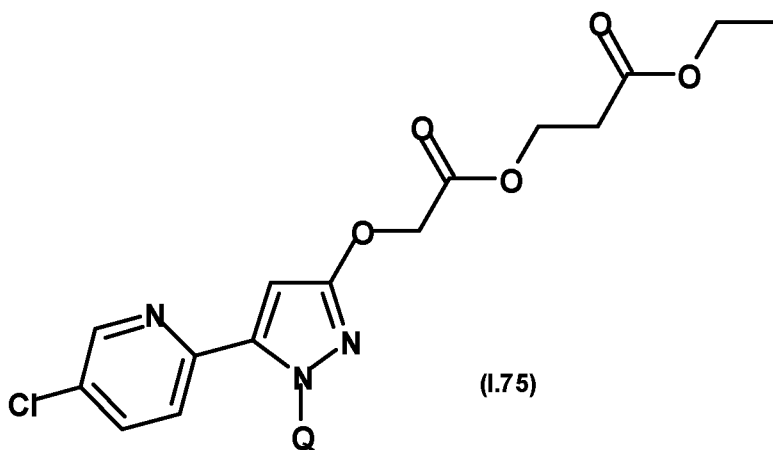
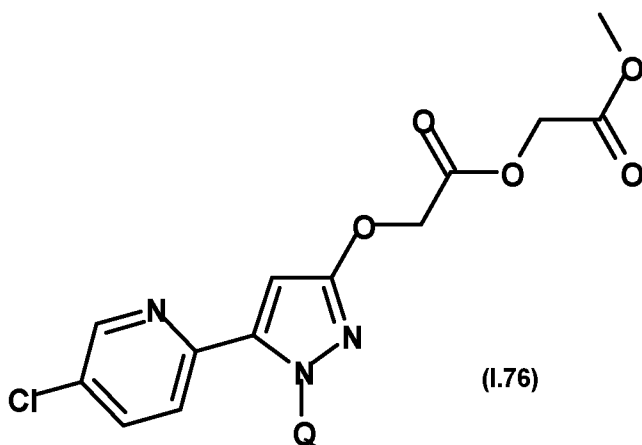


Tabla I.74: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.74) son los compuestos I.74-1 a I.74-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.74-1 a I.74-53 de la Tabla I.74 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.75: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.75) son los compuestos I.75-1 a I.75-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.75-1 a I.75-53 de la Tabla I.75 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.76: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.76) son los compuestos I.76-1 a I.76-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.76-1 a I.76-53 de la Tabla I.76 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

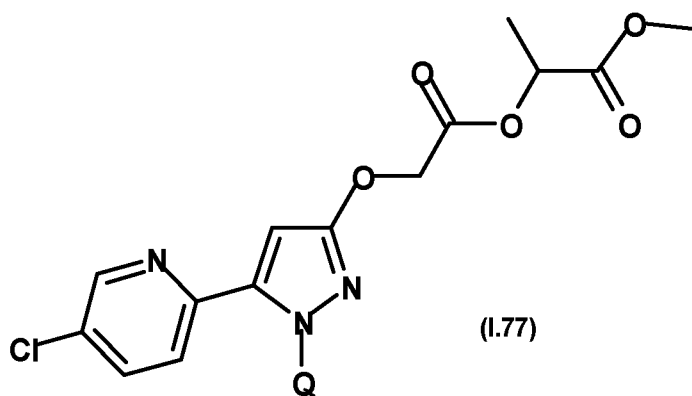
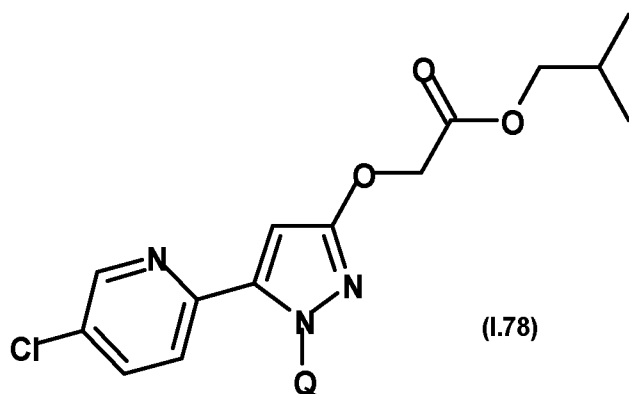
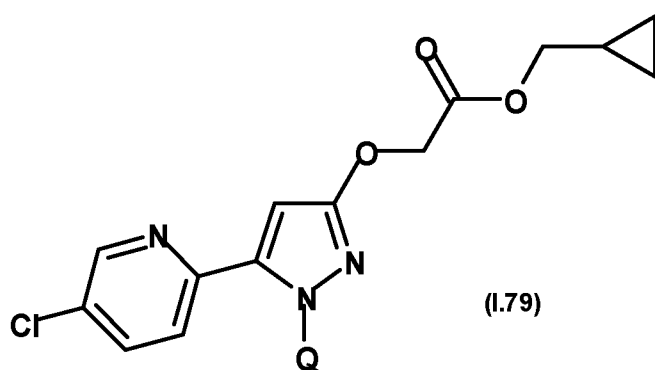


Tabla I.77: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.77) son los compuestos I.77-1 a I.77-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.77-1 a I.77-53 de la Tabla I.77 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.78: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.78) son los compuestos I.78-1 a I.78-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.78-1 a I.78-53 de la Tabla I.78 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.79: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.79) son los compuestos I.79-1 a I.79-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.79-1 a I.79-53 de la Tabla I.79 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

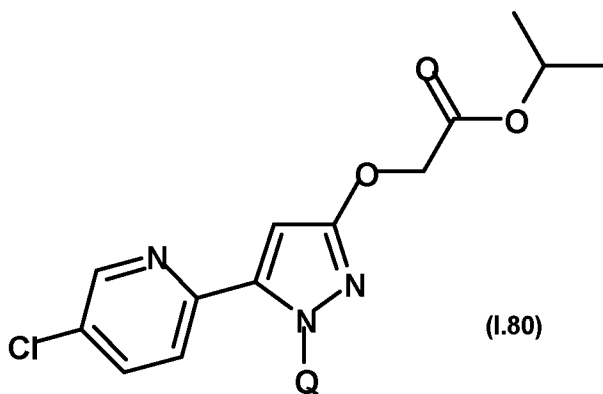
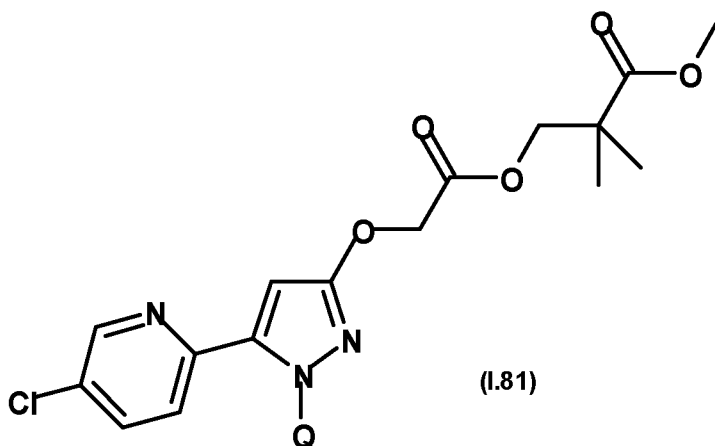
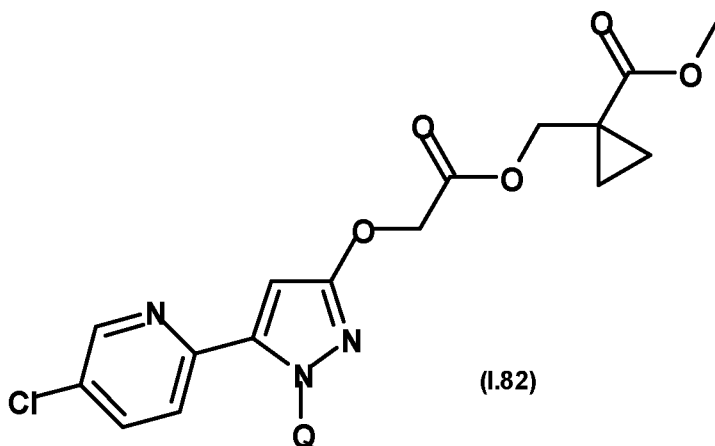


Tabla I.80: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.80) son los compuestos I.80-1 a I.80-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.80-1 a I.80-53 de la Tabla I.80 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



5

Tabla I.81: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.81) son los compuestos I.81-1 a I.81-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.81-1 a I.81-53 de la Tabla I.81 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.



10 Tabla I.82: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.82) son los compuestos I.82-1 a I.82-53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.82-1 a I.82-53 de la Tabla I.82 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

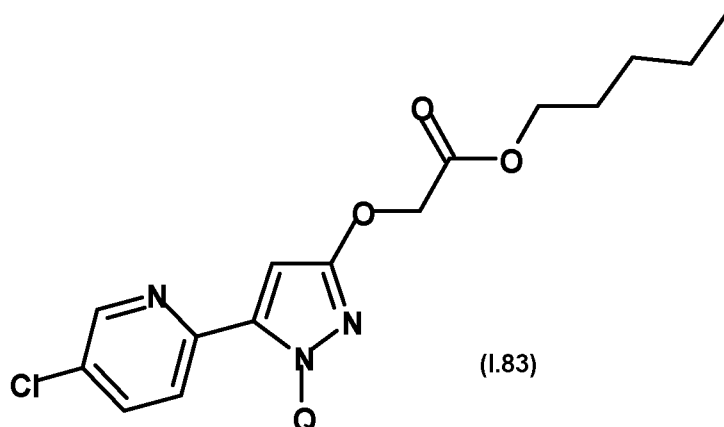


Tabla I.83: Los compuestos preferidos de la fórmula (I.83) son los compuestos I.83–1 a I.83–53, en donde Q tiene los significados indicados en cada línea de la Tabla 1. Los compuestos I.83–1 a I.83–53 de la Tabla I.83 se definen así por el significado de cada entrada N.º 1 a 53 para Q de la Tabla 1.

5 Datos espectroscópicos de ejemplos seleccionados de la tabla:

A continuación se enumeran ejemplos de síntesis detallados seleccionados para los compuestos de la fórmula general (I) según la invención. Los datos espectroscópicos de RMN de  $^1\text{H}$ , RMN de  $^{13}\text{C}$  y RMN de  $^{19}\text{F}$  dados para los ejemplos químicos descritos en las siguientes secciones (400 MHz para RMN de  $^1\text{H}$  y 150 MHz para RMN de  $^{13}\text{C}$  y 375 MHz para RMN de  $^{19}\text{F}$ , disolvente  $\text{CDCl}_3$ ,  $\text{CD}_3\text{OD}$  o  $d_6$ -DMSO, patrón interno: tetrametilsilano  $\delta = 0,00$  ppm), se obtuvieron con un dispositivo de Bruker, y las señales indicadas tienen los significados enumerados a continuación: br = ancho (es); s = singlete, d = doblete, t = triplete, dd = doblete, ddd = doblete de un doblete, m = multiplete, q = cuartete, quint = quintete, sext = sextete, sept = septete, dq = doble cuartete, dt = doble triplete. En el caso de mezclas de diastereómeros, se dan las señales significativas de ambos diastereómeros o la señal característica del diastereómero principal. Las abreviaturas utilizadas para los grupos químicos tienen, por ejemplo, los siguientes significados: Me =  $\text{CH}_3$ , Et =  $\text{CH}_2\text{CH}_3$ , t-Hex =  $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ , t-Bu =  $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ , n-Bu = butilo no ramificado, n-Pr = propilo no ramificado, i-Pr = propilo ramificado, c-Pr = ciclopropilo, c-Hex = ciclohexilo.

Los datos espectroscópicos de los ejemplos de tablas seleccionados que se enumeran a continuación se evaluaron usando la interpretación clásica de RMN de  $^1\text{H}$  o usando procedimientos de lista de picos de RMN.

20 Interpretación clásica de  $^1\text{H}$ -RMN

Ejemplo N.º I.77–49:

$^1\text{H}$ -RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 7.59 (m, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.97 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 4.92 (s, 2H), 4.20 (t, 2H), 1.67–1.63 (m, 2H), 1.32–1.26 (m, 4H), 0.87 (t, 3H).

Ejemplo N.º I.71–49:

25  $^1\text{H}$ -RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 7.59 (m, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.22 (dd, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.97 (dt, 1H), 6.77 (dt, 1H), 5.24 (q, 1H), 5.01 (s, 2H), 3.74 (s, 3H).

Ejemplo N.º I.70–49:

$^1\text{H}$ -RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 7.60 (m, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.21 (m, 1H), 7.14 (m, 1H), 6.96 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 5.05 (s, 2H), 4.75 (s, 2H), 3.77 (s, 3H).

30 Ejemplo N.º I.72–49:

$^1\text{H}$ -RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 7.57 (m, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.21 (m, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.96 (dt, 1H), 6.77 (dt, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.99 (d, 2H), 1.95 (m, 1H), 0.90 (d, 6H).

Procedimientos para lista de picos RMN

35 Los datos  $^1\text{H}$ -RMN de ejemplos seleccionados se mencionan en forma de listas de picos de  $^1\text{H}$ -RMN. Para cada pico de la señal, se lista primero el valor  $\delta$  en ppm y posteriormente la intensidad de señal entre paréntesis. Los pares números de valor  $\delta$ -intensidad de señal para los diferentes picos de señal se listan con separación entre sí con punto y coma.

## ES 3 018 232 T3

La lista de picos para un ejemplo por lo tanto tiene la forma:

$\delta_1$  (intensidad<sub>1</sub>);  $\delta_2$  (intensidad<sub>2</sub>); .....;  $\delta_i$  (intensidad<sub>i</sub>); .....;  $\delta_n$  (intensidad<sub>n</sub>)

- 5 La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm, y muestra las proporciones verdaderas de las intensidades de señal. En el caso de las señales anchas, se pueden mostrar varios picos o la señal media y la intensidad relativa de los mismos en comparación con la señal más intensa en el espectro.

La calibración del desplazamiento químico de los espectros de 1H-RMN se lleva a cabo usando tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del solvente, particularmente en el caso de los espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, el pico de tetrametilsilano puede estar, aunque no necesariamente, en las listas de picos de RMN.

- 10 Las listas de los picos de 1H-RMN son similares a las impresiones convencionales de 1H-RMN y por lo tanto usualmente contienen todos los picos listados en una interpretación convencional de RMN.

Además, como en las impresiones convencionales de 1H-RMN, se muestran las señales de solvente, señales de estereoisómeros de los compuestos diana que probablemente sean provistos por la invención, y/o los picos de impurezas.

- 15 En el informe de las señales de los compuestos dentro del intervalo delta de solventes y/o agua, en nuestras listas de picos de 1H-RMN se muestran los picos estándar del solvente, por ejemplo los picos de DMSO en DMSO-  $d_6$  y el pico de agua, que usualmente tiene una alta intensidad en promedio.

Los picos de los estereoisómeros de los compuestos diana y/o los picos de las impurezas usualmente tienen una menor intensidad, en promedio, que los picos de los compuestos diana (por ejemplo con una pureza de > 90%).

- 20 Dichos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del procedimiento particular de preparación. De esa forma los picos pueden ayudar a identificar la reproducción del procedimiento de preparación de los inventores con referencia a "huellas de productos secundarios".

- 25 Un experto, mediante el cálculo de los picos de los compuestos diana mediante procedimientos conocidos (MestreC, ACD simulation, pero también con valores esperados evaluados en forma empírica) puede, si se requiere, aislar los picos de los compuestos diana, opcionalmente usando filtros adicionales de intensidad. Este aislamiento sería similar a la elección de picos en cuestión en la interpretación convencional del 1H-RMN.

Pueden hallarse detalles adicionales de las listas de picos de 1H-RMN en la Research Disclosure Database Number 564025.

I.15-2: 1H-RMN (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

$\delta$ = 9.1400 (2.9); 8.6611 (6.7); 7.5917 (0.6); 7.5874 (0.6); 7.5272 (1.5); 7.5255 (1.6); 7.4632 (0.6); 7.4597 (0.6); 7.4150 (0.7); 7.3819 (0.6); 7.3784 (0.6); 7.3622 (0.7); 7.3591 (0.8); 7.3473 (0.6); 7.3440 (0.7); 7.3267 (0.6); 7.3211 (0.7); 7.3181 (0.6); 7.3003 (0.6); 7.2971 (0.6); 7.2891 (1.1); 7.2867 (1.1); 6.4864 (3.0); 5.9281 (0.6); 5.8395 (0.5); 5.1558 (0.6); 4.8406 (0.5); 4.4983 (2.8); 4.0385 (1.3); 4.0206 (2.4); 3.1836 (1.0); 3.1657 (1.1); 2.9442 (1.2); 2.9262 (3.4); 2.9083 (3.4); 2.8904 (1.3); 2.5274 (0.8); 2.5227 (1.2); 2.5140 (15.0); 2.5095 (32.0); 2.5049 (44.3); 2.5003 (31.1); 2.4958 (14.4); 1.9886 (5.8); 1.9013 (1.6); 1.3240 (0.7); 1.3060 (1.4); 1.2879 (0.6); 1.1925 (1.7); 1.1747 (3.4); 1.1570 (1.7); 1.1407 (7.9); 1.1226 (16.0); 1.1045 (7.6); -0.0002 (3.8)

I.25-2: 1H-RMN (400.0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

$\delta$ = 8.0855 (1.2); 8.0812 (1.0); 8.0792 (1.2); 7.6130 (0.7); 7.6067 (0.7); 7.5942 (0.8); 7.5918 (0.8); 7.5879 (0.8); 7.5855 (0.8); 7.5730 (0.7); 7.5667 (0.7); 7.4657 (0.5); 7.4613 (0.6); 7.4465 (1.0); 7.4421 (1.1); 7.4275 (0.6); 7.4231 (0.7); 7.3506 (0.5); 7.3422 (0.5); 7.2619 (6.8); 7.2408 (0.6); 7.2392 (0.6); 7.2374 (0.6); 7.2362 (0.6); 7.2179 (1.0); 7.0817 (0.7); 7.0784 (0.7); 7.0609 (0.6); 7.0570 (1.1); 7.0533 (0.7); 7.0358 (0.6); 7.0325 (0.6); 6.8719 (0.9); 6.8705 (0.9); 6.8644 (0.9); 6.8630 (0.9); 6.8506 (0.9); 6.8492 (0.9); 6.8431 (0.8); 6.8417 (0.8); 6.1255 (6.2); 4.8781 (9.1); 3.8097 (16.0); 2.0053 (1.2); -0.0002 (7.0)

I.26-4: 1H-RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

$\delta$ = 8.1389 (1.2); 8.1370 (1.7); 8.1349 (1.4); 8.1328 (1.4); 8.1307 (1.8); 8.1286 (1.3); 7.5656 (1.1); 7.5592 (1.1); 7.5468 (1.2); 7.5444 (1.2); 7.5405 (1.2); 7.5381 (1.2); 7.5256 (1.1); 7.5194 (1.3); 7.2610 (29.4); 7.1938 (2.4); 7.1881 (0.8); 7.1819 (2.6); 7.1766 (1.4); 7.1710 (3.3); 7.1649 (1.0); 7.1628 (0.6); 7.1591 (3.2); 7.0508 (3.4); 7.0449 (1.0); 7.0337 (1.0); 7.0306 (3.7); 7.0280 (2.8); 7.0248 (1.1); 7.0136 (0.9); 7.0078 (2.5); 6.8985 (1.3); 6.8970 (1.4); 6.8910 (1.4); 6.8894 (1.4); 6.8774 (1.3); 6.8757 (1.3); 6.8697 (1.3); 6.8681 (1.3); 6.0919 (10.2); 4.8579 (14.6); 4.3079 (1.8); 4.2901 (5.6); 4.2723 (5.7); 4.2545 (1.9); 1.5486 (7.1); 1.3227 (7.7); 1.3049 (16.0); 1.2871 (7.5); 0.0079 (1.1); -0.0002 (40.3); -0.0027 (2.0); -0.0052 (0.6); -0.0059 (0.6); -0.0085 (1.2)

### ES 3 018 232 T3

<p>I.26–38: <sup>1</sup>H–RMN (400.2 MHz, d<sub>6</sub>–DMSO):</p> <p>δ = 8.1838 (3.4); 8.1778 (3.5); 7.8232 (1.2); 7.8169 (1.2); 7.8024 (2.0); 7.7965 (1.8); 7.7826 (1.3); 7.7762 (1.3); 7.6657 (1.0); 7.6506 (1.1); 7.6436 (2.0); 7.6286 (2.0); 7.6215 (1.2); 7.6065 (1.0); 7.4513 (1.0); 7.4443 (1.1); 7.4285 (1.3); 7.4247 (1.6); 7.4221 (1.6); 7.4182 (1.4); 7.4024 (1.1); 7.3955 (1.1); 7.2720 (0.8); 7.2687 (0.9); 7.2652 (0.9); 7.2624 (0.8); 7.2484 (1.6); 7.2291 (2.9); 7.2224 (2.8); 7.2076 (2.1); 7.2010 (2.0); 6.4670 (0.8); 6.4521 (11.1); 4.9750 (0.8); 4.8352 (14.5); 4.7697 (0.8); 4.1867 (2.2); 4.1689 (6.9); 4.1512 (7.0); 4.1335 (2.4); 4.1187 (0.5); 3.3202 (36.1); 3.2967 (0.5); 2.5091 (15.2); 2.5048 (30.2); 2.5003 (40.6); 2.4959 (30.1); 2.4916 (15.1); 1.2340 (0.4); 1.2058 (7.8); 1.1880 (16.0); 1.1703 (7.6); 1.1489 (0.5); 0.0066 (0.9); –0.0015 (18.8); –0.0096 (0.9)</p>
<p>I.25–43: <sup>1</sup>H–RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p>δ = 8.1102 (1.1); 8.1040 (1.1); 7.6728 (0.6); 7.6665 (0.6); 7.6541 (0.7); 7.6517 (0.7); 7.6478 (0.7); 7.6454 (0.7); 7.6330 (0.6); 7.6267 (0.6); 7.3829 (0.6); 7.3615 (1.2); 7.3402 (0.7); 7.2616 (10.5); 6.9859 (0.6); 6.9832 (1.7); 6.9647 (2.2); 6.9618 (2.1); 6.9435 (1.5); 6.9406 (0.5); 6.8925 (0.9); 6.8909 (0.9); 6.8850 (0.9); 6.8834 (0.9); 6.8713 (0.8); 6.8698 (0.8); 6.8638 (0.9); 6.8622 (0.8); 6.1577 (6.4); 4.8680 (8.6); 3.8020 (16.0); 3.7732 (0.6); 1.5555 (5.3); –0.0002 (13.8)</p>
<p>I.26–2: <sup>1</sup>H–RMN (400.2 MHz, d<sub>6</sub>–DMSO):</p> <p>δ = 8.3755 (4.2); 8.3684 (4.2); 7.8429 (1.1); 7.8357 (1.1); 7.8211 (2.6); 7.8138 (2.5); 7.7993 (1.7); 7.7920 (1.6); 7.7333 (2.5); 7.7223 (2.7); 7.7113 (1.8); 7.7003 (1.7); 7.4886 (1.1); 7.4847 (1.3); 7.4691 (2.8); 7.4653 (3.3); 7.4562 (1.2); 7.4497 (2.7); 7.4459 (2.8); 7.4368 (1.7); 7.4305 (1.5); 7.4253 (1.0); 7.4169 (1.1); 7.4127 (0.8); 7.3103 (1.7); 7.3076 (1.9); 7.2913 (2.7); 7.2883 (3.1); 7.2801 (2.0); 7.2723 (1.5); 7.2692 (1.5); 7.2595 (1.7); 7.2539 (2.0); 7.2329 (1.4); 6.5840 (0.4); 6.5693 (10.8); 4.9853 (0.4); 4.8447 (15.4); 4.7760 (0.4); 4.1900 (2.3); 4.1723 (7.1); 4.1545 (7.3); 4.1367 (2.6); 3.3319 (14.4); 2.5069 (36.9); 2.5025 (48.5); 2.4982 (35.7); 1.2065 (7.8); 1.1888 (16.0); 1.1710 (7.7); 1.1486 (0.4); 0.0000 (4.5)</p>
<p>I.26–17: <sup>1</sup>H–RMN (400.0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p>δ = 8.0535 (2.1); 8.0471 (2.1); 7.4836 (1.1); 7.4772 (1.1); 7.4648 (1.3); 7.4623 (1.4); 7.4584 (1.3); 7.4559 (1.3); 7.4435 (1.2); 7.4371 (1.2); 7.3253 (0.6); 7.3217 (0.6); 7.3064 (1.5); 7.3031 (1.5); 7.2883 (1.6); 7.2848 (1.6); 7.2613 (45.0); 7.2418 (1.0); 7.2202 (0.7); 7.2011 (1.4); 7.1969 (1.3); 7.1821 (0.9); 7.1788 (0.8); 7.1464 (2.2); 7.1431 (2.2); 7.1269 (1.2); 7.1235 (1.2); 6.8055 (1.5); 6.7991 (1.6); 6.7841 (1.5); 6.7777 (1.5); 6.1237 (10.2); 4.8511 (15.8); 4.7564 (2.6); 4.2830 (2.3); 4.2650 (6.4); 4.2471 (6.3); 4.2292 (2.0); 2.0270 (16.0); 1.3322 (1.2); 1.3143 (2.5); 1.3039 (7.8); 1.2965 (1.5); 1.2861 (15.7); 1.2682 (8.4); 0.8989 (0.7); 0.8819 (2.3); 0.8641 (0.9); 0.0080 (0.7); –0.0002 (25.3); –0.0085 (0.8)</p>
<p>I.27–2: <sup>1</sup>H–RMN (400.0 MHz, d<sub>6</sub>–DMSO):</p> <p>δ = 8.1486 (1.2); 8.1422 (1.2); 7.8137 (0.5); 7.8073 (0.5); 7.7942 (0.7); 7.7924 (0.7); 7.7879 (0.7); 7.7860 (0.7); 7.7729 (0.6); 7.7666 (0.6); 7.5681 (0.8); 7.5637 (1.0); 7.5485 (0.5); 7.5441 (0.6); 7.3613 (0.5); 7.3583 (0.7); 7.3425 (0.8); 7.3389 (1.4); 7.3196 (0.6); 7.3156 (0.6); 7.3102 (0.7); 7.3069 (0.6); 7.2145 (0.8); 7.2087 (0.8); 7.1930 (0.8); 7.1874 (0.7); 7.1860 (0.7); 6.4261 (6.4); 4.7472 (6.6); 2.5234 (0.7); 2.5187 (1.0); 2.5100 (13.3); 2.5054 (28.6); 2.5008 (39.7); 2.4962 (27.6); 2.4916 (12.2); 2.0730 (16.0); 1.9880 (0.6); 1.9084 (1.6); 1.3557 (0.6); 0.0080 (0.9); –0.0002 (31.1); –0.0085 (0.9)</p>
<p>I.25–41: <sup>1</sup>H–RMN (400.0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p>δ = 8.0970 (1.3); 8.0907 (1.3); 7.6405 (0.7); 7.6342 (0.6); 7.6218 (0.8); 7.6193 (0.8); 7.6155 (0.8); 7.6130 (0.8); 7.6006 (0.7); 7.5943 (0.7); 7.2621 (7.0); 7.2426 (0.5); 7.2357 (0.5); 7.2285 (0.9); 7.2223 (0.5); 7.2076 (0.5); 7.0615 (0.5); 7.0539 (0.6); 7.0520 (0.6); 7.0437 (0.8); 7.0358 (0.6); 7.0321 (0.8); 7.0196 (0.7); 7.0091 (0.9); 6.9970 (0.9); 6.9092 (0.9); 6.9079 (0.9); 6.9017 (0.9); 6.9004 (0.9); 6.8880 (0.9); 6.8867 (0.9); 6.8805 (0.9); 6.8791 (0.8); 6.1286 (6.2); 4.8717 (9.0); 3.8181 (16.0); 2.0451 (1.1); 1.5586 (2.0); 1.2594 (0.9); 0.8818 (0.8); –0.0002 (9.0)</p>
<p>I.37–41: <sup>1</sup>H–RMN (400.0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p>δ = 8.1677 (1.6); 8.1546 (1.7); 7.2758 (0.6); 7.2599 (34.7); 7.2478 (0.6); 7.2411 (0.5); 7.2333 (0.5); 7.0952 (0.6); 7.0866 (0.8); 7.0786 (0.6); 7.0690 (1.0); 7.0568 (0.7); 7.0464 (0.9); 7.0345 (0.9); 6.9863 (0.8); 6.9822 (1.2); 6.9786 (0.8); 6.9734 (0.8); 6.9694 (1.2); 6.9655 (0.7); 6.7395 (1.9); 6.2291 (6.2); 4.8705 (9.2); 3.8176 (16.0); 1.5397 (16.0); 0.0080 (1.4); –0.0002 (40.5); –0.0085 (1.2)</p>
<p>I.32–38: <sup>1</sup>H–RMN (400.2 MHz, d<sub>6</sub>–DMSO):</p>

## ES 3 018 232 T3

$\delta$ = 8.3869 (4.8); 8.3802 (4.7); 7.8591 (0.9); 7.8521 (0.9); 7.8373 (2.6); 7.8303 (2.4); 7.8157 (2.0); 7.8088 (1.9); 7.7931 (3.1); 7.7818 (3.3); 7.7712 (1.7); 7.7599 (1.4); 7.5526 (1.0); 7.5373 (1.2); 7.5306 (2.2); 7.5155 (2.2); 7.5088 (1.3); 7.4936 (1.1); 7.3928 (1.2); 7.3860 (1.2); 7.3652 (2.0); 7.3438 (1.2); 7.3371 (1.2); 7.2074 (1.1); 7.2035 (1.1); 7.1865 (2.0); 7.1651 (1.0); 6.6184 (0.8); 6.6045 (10.7); 4.9806 (0.9); 4.8401 (16.0); 4.7738 (1.0); 4.1855 (2.3); 4.1678 (7.2); 4.1500 (7.3); 4.1323 (2.5); 4.1189 (0.5); 3.3457 (59.8); 2.5018 (34.9); 1.2022 (7.7); 1.1844 (16.0); 1.1666 (8.3); 1.1481 (0.6); -0.0023 (2.2)

I.26-2: 1H-RMN (400.0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

$\delta$ = 8.0839 (2.2); 8.0778 (2.2); 7.6117 (1.1); 7.6054 (1.1); 7.5929 (1.4); 7.5905 (1.4); 7.5866 (1.3); 7.5842 (1.3); 7.5717 (1.2); 7.5654 (1.1); 7.4650 (0.9); 7.4606 (1.0); 7.4457 (1.7); 7.4414 (1.8); 7.4267 (1.1); 7.4223 (1.2); 7.3791 (0.5); 7.3748 (0.5); 7.3670 (0.6); 7.3623 (0.7); 7.3603 (0.9); 7.3559 (0.8); 7.3480 (0.9); 7.3437 (0.9); 7.3417 (0.8); 7.3396 (0.9); 7.3352 (0.7); 7.3274 (0.8); 7.3230 (0.6); 7.2602 (21.0); 7.2369 (1.1); 7.2351 (1.2); 7.2158 (1.7); 7.1984 (0.8); 7.0794 (1.2); 7.0762 (1.1); 7.0586 (1.2); 7.0548 (1.9); 7.0511 (1.2); 7.0336 (1.0); 7.0303 (1.0); 6.8696 (1.6); 6.8621 (1.6); 6.8484 (1.6); 6.8470 (1.5); 6.8409 (1.5); 6.1251 (9.9); 4.8553 (16.0); 4.3023 (1.9); 4.2845 (6.0); 4.2666 (6.1); 4.2488 (2.0); 2.0442 (1.1); 1.5430 (4.6); 1.3131 (7.4); 1.2952 (15.3); 1.2774 (7.7); 1.2655 (0.8); 1.2590 (1.1); 0.8821 (1.2); 0.0080 (1.1); -0.0002 (27.7); -0.0085 (0.9)

I.47-1: 1H-RMN (400.6 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

$\delta$ = 8.6105 (3.1); 8.6060 (3.1); 8.4835 (2.2); 8.4810 (1.9); 8.4713 (2.2); 8.4687 (2.0); 7.4147 (1.7); 7.4066 (1.0); 7.4027 (3.1); 7.3988 (2.4); 7.3858 (5.0); 7.3813 (1.9); 7.3703 (1.4); 7.3665 (3.6); 7.3650 (2.4); 7.3597 (0.5); 7.3480 (1.0); 7.3445 (2.2); 7.3410 (1.3); 7.3325 (0.7); 7.3266 (2.1); 7.3082 (0.7); 7.2071 (3.0); 7.2034 (4.9); 7.1980 (1.0); 7.1900 (1.7); 7.1859 (3.1); 7.1842 (2.6); 7.1831 (2.4); 6.4246 (5.4); 6.4230 (5.1); 5.7571 (1.9); 4.8832 (12.0); 4.2072 (1.9); 4.1895 (6.1); 4.1717 (6.2); 4.1540 (2.0); 3.3202 (14.7); 2.5240 (1.1); 2.5193 (1.5); 2.5106 (20.6); 2.5060 (46.0); 2.5014 (65.0); 2.4969 (45.8); 2.4923 (20.7); 1.2234 (7.5); 1.2142 (0.6); 1.2057 (16.0); 1.1965 (0.8); 1.1880 (7.3); 0.0080 (1.4); -0.0002 (56.7); -0.0085 (1.8)

I.50-41: 1H-RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

$\delta$ = 8.4354 (2.4); 8.4288 (2.4); 8.2962 (2.8); 7.2610 (21.6); 7.2512 (2.6); 7.2446 (2.6); 7.2371 (1.4); 7.2337 (1.7); 7.2294 (2.3); 7.2225 (2.1); 7.0878 (0.5); 7.0796 (0.7); 7.0744 (1.0); 7.0667 (1.1); 7.0567 (1.4); 7.0441 (1.5); 7.0390 (0.9); 7.0319 (1.3); 7.0213 (1.7); 7.0093 (1.6); 6.9984 (0.7); 6.9864 (0.5); 6.1767 (9.7); 4.8520 (16.0); 4.3111 (2.0); 4.2933 (6.0); 4.2755 (6.1); 4.2577 (2.0); 2.0454 (1.8); 1.5586 (1.0); 1.3226 (7.4); 1.3048 (14.8); 1.2870 (7.4); 1.2773 (1.0); 1.2596 (1.7); 1.2417 (0.6); 0.8986 (0.5); 0.8819 (1.5); 0.8643 (0.6); 0.0079 (1.6); -0.0002 (31.4); -0.0084 (1.2)

I.26-39: 1H-RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

$\delta$ = 8.0878 (1.9); 8.0858 (1.6); 8.0836 (1.6); 8.0815 (2.1); 7.6393 (1.1); 7.6330 (1.1); 7.6206 (1.2); 7.6181 (1.3); 7.6143 (1.2); 7.6118 (1.3); 7.5995 (1.1); 7.5932 (1.1); 7.2615 (15.0); 7.2238 (0.6); 7.2210 (0.6); 7.2167 (0.5); 7.2110 (0.5); 7.2048 (1.8); 7.2006 (2.5); 7.1952 (0.6); 7.1932 (0.6); 7.1885 (1.6); 7.1860 (2.4); 7.1790 (0.7); 7.1726 (1.3); 7.1698 (1.5); 7.1595 (1.5); 7.1573 (1.3); 7.1511 (0.6); 7.1414 (0.6); 7.1380 (0.8); 6.9111 (1.4); 6.9096 (1.5); 6.9036 (1.5); 6.9021 (1.5); 6.8899 (1.3); 6.8884 (1.5); 6.8824 (1.4); 6.8808 (1.4); 6.1434 (10.6); 4.8486 (15.8); 4.3040 (1.9); 4.2862 (6.0); 4.2684 (6.1); 4.2506 (2.0); 2.0452 (0.6); 1.5525 (4.6); 1.3157 (7.8); 1.2979 (16.0); 1.2800 (7.6); 1.2595 (0.6); 0.8818 (0.5); 0.0079 (0.5); -0.0002 (22.1); -0.0085 (0.8)

I.27-5: 1H-RMN (400.6 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

$\delta$ = 12.9229 (1.6); 8.1123 (2.8); 8.1078 (2.3); 8.1060 (2.9); 7.7682 (1.4); 7.7618 (1.3); 7.7487 (1.7); 7.7468 (1.8); 7.7423 (1.7); 7.7404 (1.8); 7.7274 (1.5); 7.7210 (1.5); 7.6501 (2.1); 7.6452 (1.8); 7.6426 (1.8); 7.6324 (3.2); 7.6265 (3.0); 7.5858 (1.5); 7.5804 (2.2); 7.5688 (2.2); 7.5661 (2.6); 7.5622 (3.8); 7.5430 (1.1); 7.5377 (1.7); 7.5246 (3.7); 7.5194 (3.0); 7.5117 (3.2); 7.5068 (3.4); 7.5054 (3.4); 7.5001 (2.1); 7.4933 (3.1); 7.4885 (2.4); 7.4749 (1.0); 7.4702 (0.7); 7.1991 (1.9); 7.1980 (1.9); 7.1922 (2.0); 7.1909 (1.9); 7.1779 (1.8); 7.1765 (1.9); 7.1708 (1.9); 7.1695 (1.8); 6.4309 (15.4); 5.7575 (6.3); 4.7331 (16.0); 3.3271 (1.0); 2.5210 (0.7); 2.5122 (9.8); 2.5077 (21.9); 2.5031 (30.8); 2.4985 (21.6); 2.4940 (9.8); 0.0080 (0.8); -0.0002 (28.8); -0.0085 (0.8)

I.26-5: 1H-RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

$\delta$ = 8.0606 (0.8); 8.0589 (1.1); 8.0566 (0.9); 8.0545 (0.9); 8.0526 (1.1); 8.0505 (0.7); 7.5757 (0.7); 7.5694 (0.7); 7.5570 (0.7); 7.5545 (0.8); 7.5507 (0.8); 7.5481 (0.8); 7.5358 (0.7); 7.5294 (0.7); 7.4245 (1.2); 7.4188 (1.2); 7.4153 (0.8); 7.4088 (1.1); 7.4062 (1.4); 7.4013 (2.5); 7.4001 (2.3); 7.3766 (0.7); 7.3639 (1.8); 7.3575 (1.0); 7.3534 (1.6); 7.3476 (1.4); 7.3464 (1.7); 7.3392 (0.8); 7.3354 (1.2); 7.3305 (0.9); 7.2651 (2.6); 6.8417 (0.9); 6.8401 (0.8); 6.8341 (0.9); 6.8326 (0.8); 6.8204 (0.8); 6.8188 (0.8); 6.8128 (0.8); 6.8113 (0.8); 6.1361 (6.0); 5.2995 (16.0); 4.8556 (8.5); 4.2910 (1.1); 4.2732 (3.4); 4.2553 (3.4); 4.2375 (1.1); 1.3058 (4.5); 1.2880 (9.3); 1.2701 (4.4); -0.0002 (3.5)

I.27-2: 1H-RMN (400.0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

## ES 3 018 232 T3

<p><math>\delta</math>= 8.1486 (1.2); 8.1422 (1.2); 7.8137 (0.5); 7.8073 (0.5); 7.7942 (0.7); 7.7924 (0.7); 7.7879 (0.7); 7.7860 (0.7); 7.7729 (0.6); 7.7666 (0.6); 7.5681 (0.8); 7.5637 (1.0); 7.5485 (0.5); 7.5441 (0.6); 7.3613 (0.5); 7.3583 (0.7); 7.3425 (0.8); 7.3389 (1.4); 7.3196 (0.6); 7.3156 (0.6); 7.3102 (0.7); 7.3069 (0.6); 7.2145 (0.8); 7.2087 (0.8); 7.1930 (0.8); 7.1874 (0.7); 7.1860 (0.7); 6.4261 (6.4); 4.7472 (6.6); 2.5234 (0.7); 2.5187 (1.0); 2.5100 (13.3); 2.5054 (28.6); 2.5008 (39.7); 2.4962 (27.6); 2.4916 (12.2); 2.0730 (16.0); 1.9880 (0.6); 1.9084 (1.6); 1.3557 (0.6); 0.0080 (0.9); -0.0002 (31.1); -0.0085 (0.9)</p>
<p>I.50–39: 1H–RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.4341 (2.4); 8.4273 (2.4); 8.2897 (1.6); 8.2862 (2.6); 7.2616 (13.6); 7.2535 (1.2); 7.2490 (1.3); 7.2465 (1.7); 7.2421 (1.7); 7.2371 (0.6); 7.2312 (1.7); 7.2267 (2.0); 7.2244 (2.0); 7.2201 (3.6); 7.2136 (0.7); 7.2061 (2.5); 7.1997 (1.2); 7.1947 (0.6); 7.1899 (1.3); 7.1875 (1.2); 7.1846 (1.2); 7.1764 (1.8); 7.1648 (0.5); 7.1587 (0.6); 7.1552 (0.8); 6.1912 (10.0); 4.8516 (16.0); 4.3054 (1.9); 4.2876 (6.0); 4.2697 (6.1); 4.2519 (2.0); 1.5668 (2.2); 1.3163 (7.3); 1.2985 (14.8); 1.2807 (7.2); 0.0080 (0.6); -0.0002 (20.0); -0.0085 (0.6)</p>
<p>I.26–7: 1H–RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.1546 (1.9); 8.1526 (1.6); 8.1504 (1.6); 8.1483 (2.0); 7.5822 (1.1); 7.5758 (1.1); 7.5635 (1.2); 7.5610 (1.3); 7.5572 (1.3); 7.5547 (1.3); 7.5423 (1.2); 7.5360 (1.2); 7.3166 (0.5); 7.3094 (5.4); 7.3040 (1.9); 7.2926 (2.0); 7.2871 (7.2); 7.2800 (0.8); 7.2614 (15.4); 7.1492 (0.8); 7.1420 (7.1); 7.1366 (2.0); 7.1252 (1.8); 7.1199 (5.4); 7.1126 (0.5); 6.9167 (1.4); 6.9152 (1.5); 6.9091 (1.5); 6.9076 (1.5); 6.8955 (1.4); 6.8940 (1.4); 6.8879 (1.4); 6.8864 (1.3); 6.0966 (10.1); 5.3001 (0.9); 4.8573 (15.5); 4.3085 (1.9); 4.2906 (6.0); 4.2728 (6.0); 4.2550 (2.0); 1.5509 (3.7); 1.3241 (7.7); 1.3063 (16.0); 1.2885 (7.6); 0.0697 (0.7); 0.0080 (0.7); -0.0002 (24.7); -0.0085 (0.7)</p>
<p>I.50–43: 1H–RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.4137 (2.7); 8.4068 (2.7); 8.3193 (1.6); 8.3155 (2.7); 8.3117 (1.5); 7.3974 (1.0); 7.3911 (0.8); 7.3822 (0.5); 7.3760 (1.9); 7.3699 (0.6); 7.3606 (0.8); 7.3547 (1.1); 7.3395 (0.5); 7.2774 (1.1); 7.2729 (1.2); 7.2705 (1.3); 7.2660 (1.3); 7.2614 (19.2); 7.2552 (1.2); 7.2507 (1.3); 7.2483 (1.2); 7.2438 (1.1); 7.0031 (0.7); 7.0013 (0.9); 6.9985 (2.8); 6.9801 (3.6); 6.9771 (3.4); 6.9588 (2.5); 6.9558 (0.8); 6.9540 (0.6); 6.2073 (10.8); 4.8487 (16.0); 4.2951 (1.9); 4.2773 (6.0); 4.2595 (6.0); 4.2417 (2.0); 1.5842 (0.9); 1.3020 (7.7); 1.2842 (16.0); 1.2664 (7.7); 0.0080 (0.8); -0.0002 (28.0); -0.0085 (0.8)</p>
<p>I.26–20: 1H–RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.0933 (1.2); 8.0913 (1.0); 8.0893 (1.0); 8.0870 (1.2); 8.0851 (0.9); 7.5662 (0.7); 7.5599 (0.7); 7.5473 (0.8); 7.5450 (0.9); 7.5410 (0.8); 7.5387 (0.9); 7.5261 (0.8); 7.5198 (0.8); 7.4111 (1.1); 7.4068 (1.3); 7.3917 (1.3); 7.3875 (1.4); 7.3613 (0.7); 7.3570 (0.7); 7.3425 (1.0); 7.3406 (1.0); 7.3382 (0.9); 7.3363 (0.9); 7.3217 (0.9); 7.3174 (0.8); 7.2612 (12.1); 7.0448 (0.9); 7.0418 (1.0); 7.0257 (1.4); 7.0226 (1.5); 7.0067 (0.8); 7.0036 (0.8); 6.8537 (1.2); 6.8508 (1.2); 6.8329 (1.1); 6.8300 (1.1); 6.8134 (0.9); 6.8119 (1.0); 6.8059 (0.9); 6.8044 (0.9); 6.7923 (0.8); 6.7907 (0.9); 6.7847 (0.8); 6.7832 (0.9); 6.0891 (6.5); 5.2998 (0.7); 4.8615 (8.8); 4.2969 (1.2); 4.2791 (3.8); 4.2613 (3.8); 4.2435 (1.2); 3.4897 (16.0); 1.5579 (0.7); 1.3115 (4.9); 1.2938 (10.2); 1.2759 (4.9); 0.0695 (0.7); 0.0080 (0.5); -0.0002 (18.8); -0.0084 (0.6)</p>
<p>I.50–17: 1H–RMN (400.6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.3443 (2.6); 8.3376 (2.5); 8.2719 (2.7); 7.3455 (0.7); 7.3421 (0.7); 7.3267 (1.6); 7.3235 (1.7); 7.3086 (1.7); 7.3052 (1.7); 7.2771 (2.3); 7.2619 (9.0); 7.2362 (0.9); 7.2320 (0.7); 7.2168 (1.6); 7.2138 (1.4); 7.1988 (1.0); 7.1947 (0.9); 7.1563 (2.2); 7.1533 (2.2); 7.1369 (1.3); 7.1339 (1.2); 7.0708 (1.2); 7.0662 (1.3); 7.0642 (1.3); 7.0595 (1.1); 7.0475 (1.2); 7.0430 (1.2); 7.0409 (1.3); 7.0363 (1.1); 6.1817 (9.3); 4.8540 (14.9); 4.2837 (2.0); 4.2658 (5.9); 4.2480 (6.0); 4.2302 (2.0); 2.0370 (16.0); 1.3043 (7.1); 1.2864 (14.1); 1.2686 (7.5); 0.8983 (0.6); 0.8816 (1.7); 0.8639 (0.7); -0.0002 (10.7)</p>
<p>I.26–17: 1H–RMN (400.0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):</p> <p><math>\delta</math>= 8.0535 (2.1); 8.0471 (2.1); 7.4836 (1.1); 7.4772 (1.1); 7.4648 (1.3); 7.4623 (1.4); 7.4584 (1.3); 7.4559 (1.3); 7.4435 (1.2); 7.4371 (1.2); 7.3253 (0.6); 7.3217 (0.6); 7.3064 (1.5); 7.3031 (1.5); 7.2883 (1.6); 7.2848 (1.6); 7.2613 (45.0); 7.2418 (1.0); 7.2202 (0.7); 7.2011 (1.4); 7.1969 (1.3); 7.1821 (0.9); 7.1788 (0.8); 7.1464 (2.2); 7.1431 (2.2); 7.1269 (1.2); 7.1235 (1.2); 6.8055 (1.5); 6.7991 (1.6); 6.7841 (1.5); 6.7777 (1.5); 6.1237 (10.2); 4.8511 (15.8); 4.7564 (2.6); 4.2830 (2.3); 4.2650 (6.4); 4.2471 (6.3); 4.2292 (2.0); 2.0270 (16.0); 1.3322 (1.2); 1.3143 (2.5); 1.3039 (7.8); 1.2965 (1.5); 1.2861 (15.7); 1.2682 (8.4); 0.8989 (0.7); 0.8819 (2.3); 0.8641 (0.9); 0.0080 (0.7); -0.0002 (25.3); -0.0085 (0.8)</p>
<p>I.27–50: 1H–RMN (400.6 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math>= 12.9575 (0.6); 8.1243 (2.4); 8.1225 (2.0); 8.1200 (2.0); 8.1179 (2.6); 7.7840 (1.2); 7.7775 (1.2); 7.7647 (1.4); 7.7626 (1.6); 7.7583 (1.4); 7.7562 (1.6); 7.7434 (1.3); 7.7369 (1.3); 7.6396 (1.0); 7.6248 (1.0); 7.6188 (2.4); 7.6041</p>

(2.5); 7.5979 (1.7); 7.5833 (1.7); 7.5263 (1.7); 7.5230 (3.3); 7.5200 (2.0); 7.5057 (1.3); 7.5024 (2.2); 7.4994 (1.2); 7.4773 (1.6); 7.4740 (1.4); 7.4562 (1.5); 7.4540 (2.1); 7.4508 (1.8); 7.4332 (1.3); 7.4298 (1.2); 7.2412 (1.7); 7.2397 (1.9); 7.2341 (1.8); 7.2326 (1.8); 7.2198 (1.7); 7.2183 (1.8); 7.2127 (1.7); 7.2112 (1.7); 6.5033 (16.0); 5.7576 (6.6); 4.7336 (14.6); 3.3256 (0.7); 2.5256 (0.6); 2.5209 (0.7); 2.5121 (12.4); 2.5075 (27.6); 2.5029 (39.3); 2.4983 (27.5); 2.4937 (12.4); 0.0080 (1.5); -0.0002 (59.5); -0.0085 (1.8)
---

La invención también se refiere al procedimiento para proteger plantas cultivadas o útiles de los efectos fitotóxicos de agroquímicos, tales como plaguicidas, o en particular herbicidas que causan daño a las plantas cultivadas o útiles, caracterizado porque se usan los compuestos de la fórmula general (I) o sus sales como protectores, preferentemente se aplica una cantidad eficaz de los compuestos de la fórmula general (I) o sus sales a las plantas, partes de las plantas o sus semillas (o simientes).

Los compuestos de la fórmula general (I) (= protector) como se mencionó anteriormente son adecuados para su uso junto con ingredientes activos (plaguicidas) para el control selectivo de organismos nocivos en varios cultivos vegetales, por ejemplo, en cultivos de importancia económica como cereales (trigo, cebada, Triticale, centeno, arroz, maíz, mijo), remolacha azucarera, caña de azúcar, colza, algodón, girasol, guisantes, frijoles y soja. Las combinaciones de herbicidas-protectores con protectores de la fórmula general (I) también son adecuadas para controlar plantas nocivas en macizos y áreas de plantas útiles y ornamentales, tales como, por ejemplo, céspedes con céspedes útiles u ornamentales, especialmente raigrás, bluegrass o bermuda grass.

En las plantas útiles y de cultivo en las que se pueden usar las combinaciones de herbicida-protector con los compuestos de la fórmula general (I) antes mencionados, son de interés cultivos mutantes que son total o parcialmente tolerantes o cultivos transgénicos que son total o parcialmente tolerantes a algunos pesticidas, por ejemplo, cultivos de maíz resistentes al glufosinato o glifosato, o cultivos de soja resistentes a imidazolinonas que son perjudiciales para las plantas. La ventaja particular de los nuevos protectores de la fórmula general (I) utilizados, sin embargo, es su acción eficaz en cultivos que normalmente no son suficientemente tolerantes a los plaguicidas que se van a utilizar.

Los compuestos de la fórmula general (I) se pueden aplicar junto con plaguicidas al mismo tiempo o en cualquier orden con los ingredientes activos y luego son capaces de reducir o eliminar por completo los efectos secundarios dañinos de estos ingredientes activos en plantas cultivadas sin perjudicar o reducir significativamente la efectividad de estos ingredientes activos contra los organismos nocivos no deseados. En este caso, los daños causados por el uso de varios plaguicidas, por ejemplo, por varios herbicidas o por herbicidas en combinación con insecticidas o fungicidas, puede reducirse significativamente o eliminarse por completo. Esto permite ampliar considerablemente el campo de aplicación de plaguicidas convencionales. En el caso de que los agentes según la invención contengan plaguicidas, estos agentes, después de una dilución adecuada, se aplican directamente a la zona de cultivo, a las plantas nocivas y/o útiles que ya han germinado o a las plantas nocivas y/o útiles que ya han emergido. En el caso de que los agentes de acuerdo con la invención no contengan un plaguicida, estos agentes se pueden usar en el llamado procedimiento de mezcla en tanque, es decir, inmediatamente antes de la aplicación a la superficie por tratar, el usuario mezcla y diluye los productos formulados por separado (= agente fitosanitario y plaguicida) o antes de la aplicación de un plaguicida, o después de la aplicación de un plaguicida, o para el pretratamiento de semillas, es decir, por ejemplo, para revestir las semillas de plantas útiles. Es preferente la aplicación oportuna del protector con el plaguicida, particularmente cuando el protector se aplica a las plantas después del herbicida. Los efectos ventajosos de los compuestos de la fórmula general (I) se observan cuando se utilizan junto con los plaguicidas antes o después de la emergencia, por ejemplo, con aplicación simultánea como mezcla en tanque o como coformulación o con aplicación separada en paralelo o uno después de otro (aplicación dividida). También es posible repetir la aplicación varias veces. A veces puede tener sentido combinar una aplicación de preemergencia con una aplicación de posemergencia. En la mayoría de los casos, se puede utilizar como aplicación de posemergencia a la planta útil o de cultivo con la aplicación simultánea o posterior del plaguicida. También es posible el uso de los compuestos (I) según la invención en la preparación de semillas, el tratamiento (por inmersión) de plántulas (por ejemplo, arroz) o el tratamiento de otro material de propagación (por ejemplo, tubérculos de patata).

Cuando los compuestos de la fórmula general (I) se utilizan en combinación con herbicidas, además del efecto protector, a menudo se observan mejoras en el efecto herbicida sobre las plantas nocivas. Además, el crecimiento de plantas útiles y de cultivo se mejora en muchos casos y se pueden aumentar los rendimientos de los cultivos.

Los agentes según la invención pueden contener uno o más plaguicidas. Posibles plaguicidas son, por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, acaricidas y nematocidas que, si se usan solos, causarían daños fitotóxicos a las plantas de cultivo o que probablemente causarían daños. Son de especial interés los correspondientes principios activos plaguicidas de los grupos de herbicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas y fungicidas, en particular herbicidas.

La relación en peso de protector (de la fórmula general (I)) a plaguicida puede variar dentro de amplios límites y generalmente está en el intervalo de 1:100 a 100:1, preferentemente 1:20 a 20:1, en particular 1:10 a 10:1. La relación de peso óptima entre el protector y el plaguicida generalmente depende tanto del protector como del plaguicida que se utilicen y del tipo de cultivo por proteger. La cantidad requerida de protector aplicado puede variar dentro de amplios límites dependiendo del pesticida utilizado y el tipo de cultivo a proteger y generalmente está en el intervalo de 0,001

a 10 kg, preferentemente 0,01 a 1 kg, en particular 0,01 a 0,2 kg de protector por hectárea. Las cantidades y las proporciones de peso necesarias para un tratamiento exitoso pueden determinarse mediante simples pruebas preliminares.

5 En el caso del revestimiento de semillas, se utilizan por ejemplo 0,005 a 20 g de protector (de la fórmula general (I)) por kilogramo de semilla, preferentemente de 0,01 a 10 g de protector por kilogramo de semilla, en particular de 0,05 a 5 g de protector por kilogramo de semilla.

10 Si se utilizan soluciones de protector (de la fórmula general (I)) en el tratamiento de semillas y las semillas o plántulas se humedecen con las soluciones, la concentración adecuada está en general en el intervalo de 1 a 10000 ppm, preferentemente de 100 a 1000 ppm en base al peso. Las cantidades y las proporciones de peso necesarias para un tratamiento exitoso pueden determinarse mediante simples pruebas preliminares.

Los compuestos de la fórmula general (I) se pueden formular por separado o junto con los pesticidas de la manera habitual. Por tanto, el objeto es también el medio para proteger plantas o cultivos útiles.

Se da preferencia al uso conjunto de protector y pesticida, en particular el de protector y herbicida como formulación final o uso en el procedimiento de mezcla en tanque.

15 También es preferente utilizar el compuesto de la fórmula general (I) en el tratamiento de semillas con la aplicación posterior de pesticidas, preferentemente herbicidas, después de la siembra en el procedimiento de pre- o posemergencia.

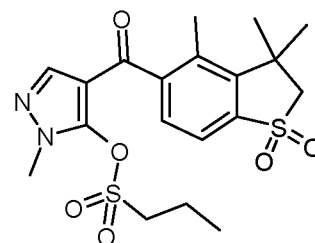
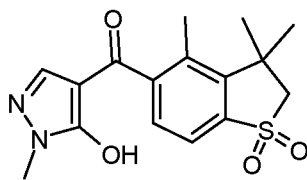
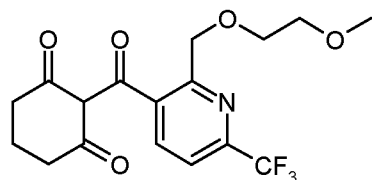
20 Los compuestos de la fórmula general (I) o sus sales se pueden utilizar como tales o en forma de sus preparaciones (formulaciones) combinadas con otras sustancias plaguicidas, como por ejemplo insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, fungicidas, protectores, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo, en forma de una formulación acabada o como tankmix. Las formulaciones de combinación se pueden preparar sobre la base de las formulaciones mencionadas anteriormente, en las que se tienen en cuenta las propiedades físicas y la estabilidad de los ingredientes activos que se combinarán.

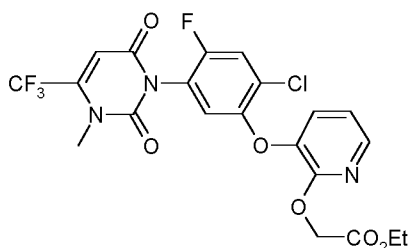
25 Como compañero de combinación para los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención en formulaciones de mezcla o en mezcla en tanque, se pueden utilizar por ejemplo compuestos activos que se basan en una inhibición de por ejemplo, acetolactato sintasa, acetil-CoA-carboxilasa, celulosa sintasa, sintasa enolpiruvilshikimato-3-fosfato, glutamina sintetasa, p-hidroxifenilpiruvato dioxigenasa, fitoendosaturasa, fotosistema I, fotosistema II o protoporfirinógeno oxidasa, tal como se describen por ejemplo en Weed Research 26 (1986) 441-445 o en "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council und the Royal Soc. of Chemistry, 2006 y la literatura citada allí. A continuación se mencionan ejemplos de herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas conocidos, que se pueden combinar con los compuestos de la invención, en los que estos ingredientes activos se mencionan por su "nombre común" ("common name") en la versión en inglés según la Organización Internacional de Normalización (ISO) o con el nombre químico o con el número de código. En este caso, comprende siempre todas las formas de aplicación, tales como ácidos, sales, ésteres así como todas las formas isoméricas, tales como estereoisómeros e isómeros ópticos, incluso si no se mencionan explícitamente.

Los ejemplos de tales compañeros de mezcla herbicidas son:

Acetoclor, acifluorofeno, acifluorofeno-sodio, aclonifeno, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim-sodio, ametrina, amicarbazona, amidoclor, amidosulfurona, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metilfenil)-5-fluoropiridin-2-carboxílico, aminociclopiraclor, aminociclopiraclor-potasio, aminociclopiracloro-metilo, aminopiraldida, amitrol, sulfamato de amonio, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, beflubutamida, benazolina, benazolin-etilo, benfluralina, benfuresato, bensulfurona, bensulfurona-metilo, bensulida, bentazona, benzobiciclona, benzofenap, biciclopirona, bifenox, bilanafos, bilanafos-sodio, bispiribac, bispiribac-sodio, bromacilo, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinilo, bromoxinil-butirato, -potasio, -heptanoato y -octanoato, busoxinona, butaclor, butafenacilo, butamifos, butenaclor, butralina, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etilo, clorambeo, clorbromurona, clorfenac, clorfenac-sodio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metilo, cloridazona, clorimurona, clorimurona-etilo, clorofthalim, clorotolurona, clortal-dimetilo, clorsulfurona, cinidona, cinidona-etilo, cinmetilina, cinosulfurona, clacifos, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clomazona, clomeprop, clopiralida, cloransulam, cloransulam-metilo, cumilurona, cianamida, cianazina, cicloato, ciclopirimorato, ciclosulfamurona, cicloclodim, cihalofop, cihalofop-butilo, ciprozina, 2,4-D, 2,4-D-butotilo, -butilo, -dimetilamonio, -diolamina, -etilo, 2-etilhexilo, -isobutilo, -isooctilo, -isopropilamonio, -potasio, -triosopropanol-amonio y -trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butilo, -dimetilamonio, isooctilo, -potasio y -sodio, daimurona (dimrona), dalapona, dazomet, n-decanol, desmedifam, detosil-pirazolato (DTP), dicamba, diclobenilo, 2-(2,4-diclorobencil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, 2-(2,5-diclorobencil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, dimefurona, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamida, dimetenamida-P, dimetrasulfurona, dinitramina, dinoterb, difenamida, diquat, dibromuro de diquat, ditiopir, diurona, DNOC, endotal, EPTC, esprocarb, etalfuralina, etametsulfurona, etametsulfurona-metilo, etiozina, etofumesato, etoxifeno, etoxifeno-etilo, etoxisulfurona, etobenzanida, F-9600, F-5231, es decir, N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-

1-il]-fenil]-etansulfonamida, F-7967, es decir, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-bencimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2,4(1H,3H)-dion, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fenoxasulfona, fenquinotrión, fentrazamida, flamprop, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurona, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucetosulfurona, flucloralina, flufenacet, flufenpir, flufenpir-etilo, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, fluometurona, flurenol, flurenol-butilo, -dimetilamonio y -metilo, fluoroglicofeno, fluoroglicofeno-etilo, flupropanato, flupirsulfurona, flupirsulfurona-metil-sodio, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-meptilo, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metilo, fomesafeno, fomesafeno-sodio, foramsulfurona, fosamina, glufosinato, glufosinate-amonio, glufosinato-P-sodio, glufosinato-P-amonio, glufosinato-P-sodio, glifosato, glifosato-amonio, -isopropilamonio, -diamonio, -dimetilamonio, -potasio, -sodio y -trimesio, H-9201, es decir, O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil)-O-etil-isopropilfosforamidatoato, halauxifeno, halauxifeno-metilo, halosafeno, halosulfurona, halosulfurona-metilo, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HW-02, es decir, 1-(dimetoxifosforil)-etil-(2,4-diclorfenoxi)acetato, imazametabenz, Imazametabenz-metilo, imazamox, imazamox-amonio, imazapic, imazapic-amonio, imazapir, imazapir-isopropilamonio, imazaquina, imazaquin-amonio, imazetapir, imazetapir-immonium, imazosulfurona, indanofano, indaziflam, yodosulfurona, yodosulfurona-metil-sodio, ioxinilo, ioxinil-octanoato, -potasio y sodio, ipfencarbazona, isoproturona, isourona, isoxaben, isoxaflutol, karbutilato, KUH-043, es decir, 3-({[5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfonil)-5,5-dimetil-4,5-dihidro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofeno, lenacilo, linurona, MCPA, MCPA-butotilo, -dimetilamonio, -2-etilhexilo, -isopropilamonio, -potasio y -sodio, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y -sodio, mecoprop, mecoprop-sodio, y -butotilo, mecoprop-P, mecoprop-P-butotilo, -dimetilamonio, -2-etilhexilo y -potasio, mefenacet, mefluidida, mesosulfurona, mesosulfuron-metilo, mesotrión, metabenziazurona, metam, metamifop, metamitrión, metazaclor, metazosulfurona, metabenziazurona, metiopsulfurona, metiozolina, isotiocianato de metilo, metobromurona, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxurona, metribuzina, metsulfurona, metsulfurona-metilo, molinato, monolinurona, monosulfurona, éster de monosulfurona, MT-5950, es decir, N-[3-cloro-4-(1-metiletil)-fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, napropamida, NC-310, es decir, 4-(2,4-Diclorbenzoil)-1-metil-5-benciloxipirazol, neburona, nicosulfurona, ácido nonanoico (ácido pelargónico), norflurazona, ácido oleico (ácidos grasos), orbencarb, ortosulfamurona, orizalina, oxadiargilo, oxadiazona, oxasulfurona, oxaziclomefona, oxifluorofeno, paraquat, dicloruro de paraquat, pebulato, pendimetalina, penoxsulam, pentaclorfenol, pentoxazona, petoxamida, aceites de petróleo, fenmedifam, picloram, picolinafeno, pinoxadeno, piperofos, pretilaclor, primisulfurona, primisulfurona-metilo, prodiamina, profoxidim, prometona, prometrina, propaclor, propanilo, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, propirisulfurona, propizamida, prosulfocarb, prosulfurona, piraclonilo, piraflufeno, piraflufeno-etilo, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfurona, pirazosulfurona-etilo, pirazoxifeno, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalida, piriminobac, piriminobac-metilo, pirimisulfano, piritiobac, piritiobac-sodio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, rimsulfurona, saflufenacilo, setoxidim, sidurona, simazina, simetrina, SL-261, sulcotrión, sulfentrazona, sulfometurona, sulfometurona-metilo, sulfosulfurona, SYP-249, es decir, 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-il-5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato, SYP-300, es decir, 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioximidazolidin-4,5-diona, 2,3,6-TBA, TCA (ácido trifluoroacético), TCA-sodio, tebutiurona, tefuriltrión, tembotrión, tepraloxidim, terbacilo, terbucarb, terbumeton, terbutilazina, terbutrina, tenilclor, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tifensulfurona, tifensulfurona-metilo, tiobencarb, tiafenacilo, tolpiralato, topramezona, tralkoxidim, triafamona, tri-alato, triasulfurona, triaziflam, tribenurona, tribenurona-metilo, triclopir, trietazina, trifloxisulfurona, trifloxisulfurona-sodio, trifludimoxazina, trifluralina, triflusulfurona, triflusulfuron-metilo, tritosulfurona, sulfato de urea, vernolato, XDE-848, ZJ-0862, es decir, 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]bencil}anilina, así como los siguientes compuestos:





Ejemplos de reguladores del crecimiento de plantas como posibles componentes de mezcla son:

5 acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, ácido 5-aminolevulínico, ancimidol, 6-bencilaminopurina, Brassinolida, catequila, cloruro de clormecuat, cloprop, ciclanilida, ácido 3-(cicloprop-1-enil)propiónico, daminozida, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-sodio, endotal, endotal-dipotasio, disodio, y mono(N,N-dimetilalquilamonio), etefona, flumetralina, flurenol, flurenol-butilo, flurprimidol, forclorfenurona, ácido giberélico, inabenfide, ácido indol-3-acético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico, isotriolano, probenazol, ácido jasmónico, éster metílico de ácido jasmónico, hidrazida maleica, cloruro de mepiquat, 1-metilciclopropeno, 2-(1-naftil) acetamida, ácido 1-naftilacético, ácido 2-naftiloxiacético, mezcla de nitrofenolato, ácido 4-oxo-4[(2-feniletil)amino]butírico, paclobutrazol, ácido N-fenilftalámico, prohexadiona, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, ácido salicílico, estrigolactona, tecnaceno, thidiazurona, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etilo, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

En el caso de uso como formulaciones o coformulaciones de principio activo, estas contienen opcionalmente los habituales adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, anticongelantes y disolventes, rellenos, portadores y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación y agentes que influyen en el valor del pH y la viscosidad.

15 Los compuestos de la fórmula general (I) y sus combinaciones con uno o más de los plaguicidas mencionados pueden formularse de diversas formas dependiendo de los parámetros fisicoquímicos y biológicos dados. Ejemplos de tipos de formulación adecuados son:

- concentrados emulsionables que se producen disolviendo los ingredientes activos en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o incluso hidrocarburos de alto punto de ebullición o mezclas de disolventes orgánicos con la adición de uno o más tensioactivos de tipo iónico y/o no iónico (emulsionantes). Emulsionantes adecuados son, por ejemplo, sales de calcio de ácido alquilarilsulfónico, ésteres de poliglicol de ácidos grasos, éteres de poliglicol de alquilarilo, éteres de poliglicol de alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, poliéteres de alquilo, ésteres de sorbitano y ésteres de ácidos grasos de polioxi-etilensorbitano;
- 20 – polvos que se pueden obtener moliendo los ingredientes activos con sustancias orgánicas o inorgánicas sólidas finamente divididas, por ejemplo, talco, arcillas naturales como caolín, bentonita y pirofilita, tierra de diatomeas o harinas.
- concentrados en suspensión a base de agua o aceite, que se pueden producir, por ejemplo, mediante molienda en húmedo con molinos de perlas;
- 30 – polvos solubles en agua;
- concentrados solubles en agua;
- gránulos, tales como gránulos solubles en agua, gránulos dispersables en agua así como gránulos para aplicación por dispersión y en suelo;
- polvos humectables que, además de los ingredientes activos, también contienen diluyentes, sustancias inertes y tensioactivos;
- 35 – suspensiones en cápsulas y microcápsulas;
- formulaciones de volumen ultrabajo.

Los tipos de formulaciones antes mencionadas se conocen por el experto en la técnica y se describen, a modo de ejemplo, en K. Martens, "Spray Driing Handbook", 3rd Ed., G. Goodwin Ltd., London. 1979; W. van Valquenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y. 1973; Winacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Auflage 1986; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, N.Y. 1973, páginas 8-57.

Los excipientes de formulación necesarios tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos también son conocidos y se describen, a modo de ejemplo, en: McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; H. von Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Auflage 1986.

Además de los excipientes de formulación mencionados anteriormente, los agentes fitosanitarios pueden contener opcionalmente adhesivo, humectante, dispersante, penetrante, emulsionante, conservante, anticongelante, rellenos, portadores y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación así como agentes que afectan el pH o la viscosidad.

5 Dependiendo del tipo de formulación, los agentes fitosanitarios contienen generalmente del 0,1 al 99% en peso, en particular del 0,2 al 95% en peso, de uno o más protectores de la fórmula general (I) o una combinación de protector y pesticida. También contienen del 1 al 99,9, en particular del 4 al 99,5% en peso de uno o varios aditivos sólidos o líquidos y del 0 al 25, en particular del 0,1 al 25% en peso de un tensioactivo. En concentrados emulsionables, la concentración de ingrediente activo, es decir, la concentración de protector y/o plaguicida, habitualmente del 1 al 90,  
10 en particular del 5 al 80% en peso. Los polvos contienen habitualmente del 1 al 30, preferentemente del 5 al 20% en peso de ingrediente activo. La concentración de ingrediente activo en polvos humectables es generalmente del 10 al 90% en peso. 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.

15 Para su uso, las formulaciones, que están disponibles en forma comercialmente disponible, se diluyen opcionalmente de la forma habitual, por ejemplo, para polvos humectables, concentrados emulsionables, dispersiones y gránulos dispersables en agua usando agua. Las preparaciones pulverulentas, los granulados así como las soluciones pulverizables ya no suelen diluirse con otras sustancias inertes antes de su uso. Con las condiciones externas como temperatura, humedad, tipo de herbicida utilizado, entre otras, varía la tasa de aplicación requerida de los protectores de la fórmula general (I).

20 En los siguientes ejemplos, que ilustran pero no limitan la invención, los datos cuantitativos se refieren al peso, a menos que se definan más detalles.

#### EJEMPLOS

#### 1. EJEMPLOS DE FORMULACIÓN

#### 25 1.1 POLVO DISPERSABLE

Se obtiene un polvo dispersable mezclando 10 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I) (protector) o una mezcla de ingredientes activos de un pesticida (por ejemplo, un herbicida) y un protector de la fórmula general (I) y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y se tritura en un molino de martillos.

#### 1.2 POLVO DISPERSABLE EN AGUA

30 Un polvo humectable fácilmente dispersable en agua se obtiene mezclando 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I) o de una mezcla de principios activos de un plaguicida (por ejemplo, un herbicida) y un protector de la fórmula general (I), 64 partes en peso de cuarzo con contenido de caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de lignosulfonato de potasio como agente reticulante y dispersante y se tritura en un molino de espigas.

#### 1.3 CONCENTRADO DISPERSABLE EN AGUA

35 Un concentrado de dispersión fácilmente dispersable en agua se obtiene mezclando 20 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I) o de una mezcla de principios activos de un plaguicida (por ejemplo, un herbicida) y un protector de la fórmula (I) con 6 partes en peso de alquilfenolpoliglicoléter

(@Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanolpoliglicoléter y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico y se muele en un molino de bolas de desgaste a una finura de menos de 5 micrones.

#### 40 1.4 CONCENTRADO EMULSIONABLE

Un concentrado emulsionable se obtiene a partir de 15 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I) o de una mezcla de principios activos de un plaguicida (por ejemplo, herbicida) y un protector de la fórmula general (I), 75 partes en peso de ciclohexanona como solvente y 10 partes en peso de nonilfenol etoxilado como emulsionante.

#### 1.5 GRANULADO DISPERSABLE EN AGUA

45 Se obtiene un granulado dispersable en agua mezclando

75	partes en peso	de un protector de la fórmula general (I) o de una
		mezcla de un plaguicida y un protector de la fórmula general (I),
10	"	de ácido cálcico ligninsulfónico,
5	"	de laurilsulfato de sodio,

3	“	de alcohol polivinílico y
7	“	de alcohol polivinílico
7	“	de caolín

5 se tritura en un molino de espigas y el polvo se granula en un lecho fluidizado rociándolo sobre agua como líquido de granulación.

Se obtiene un granulado dispersable en agua mezclando

25	partes en peso	de un protector de la fórmula general (I) o de una mezcla de un plaguicida y de un protector de la fórmula general (I),
5	“	de ácido 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfónico sódico,
10 2	“	de ácido oleoilmetiltaurínico sódico,
17	“	de carbonato de calcio,
50	“	de agua y
1	“	de alcohol polivinílico

15 se homogeneiza en un molino coloidal, se tritura, después se mueve en un molino de perlas y la suspensión así obtenida se pulveriza en una torre de pulverización por medio de una tobera de un solo fluido y se seca.

## 2. EJEMPLOS BIOLÓGICOS

2.1 Efecto relativo de compuestos seleccionados según la invención utilizando el ejemplo de la reducción nociva de mesosulfurona-metilo en trigo de primavera (TRZAS)

20 Las semillas de las plantas de cultivo por tratar se colocaron en macetas de plástico (diámetro ~4 cm) en suelo franco arenoso, se cubrieron con tierra y se cultivaron en el invernadero en buenas condiciones para la germinación y crecimiento. Las plantas de ensayo se trataron en la etapa inicial de la hoja del follaje (BBCH10 – BBCH12). Los compuestos según la invención, formulados en forma de polvos humectables (WP), se utilizaron como suspensión acuosa con una tasa de aplicación de agua correspondiente a 800 l/ha con la adición de agentes humectantes (por ejemplo, 0,2% de Genapol-LRO o 0,2% de Mero) rociado en las partes aéreas de la planta en la dosis especificada.

25 Posteriormente se aplicó el herbicida. Para ello, se utilizó mesosulfurona-metilo, formulada como granulado dispersable en agua (WG), como una dispersión acuosa con una tasa de aplicación de agua de 800 l/ha con la adición de agente humectante (por ejemplo, 0,2% de Genapol-LRO o 1 l/ha de Biopower) en una dosis de 40–60 g/ha pulverizados en las partes aéreas de la planta. La dosis del herbicida se eligió de modo que en el momento de la evaluación causara un daño moderado y claramente visible (mínimo 30%, máximo 75%) en comparación con cultivos no tratados en un grupo de control de plantas de cultivo sin tratamiento protector incluido en el mismo experimento.

30 Después de la aplicación, las plantas se cultivaron en un invernadero en buenas condiciones de crecimiento. Se llevó a cabo una evaluación visual de la eficacia de los compuestos de prueba 9–13 días después de la aplicación. Para ello, se comparó el aspecto de las plantas tratadas con el compuesto de ensayo y el herbicida con los correspondientes controles de herbicidas (sin protector; con daño claramente reconocible) así como con los controles sin tratar (sin daño). El efecto de reducción de daños de los compuestos de prueba se registró en “códigos de eficiencia” de acuerdo con el siguiente esquema:

0: sin reducción de daños (aparición según el control de herbicidas)

1: reducción de daño débil

2: reducción significativa de daños

40 3: fuerte reducción de daños

4: reducción completa de daños (aparición según el control sin tratar)

Los ensayos muestran que los compuestos según la invención seleccionados a modo de ejemplo son claramente eficaces para reducir el daño a las plantas de cultivo tales como, por ejemplo, trigo de verano (TRZAS; cv. Triso) provocado por herbicidas tales como, por ejemplo, mesosulfurona-metilo:

45

Ejemplo N.º	Dosis del protector de la fórmula (l) (g/ha)	Planta de cultivo	Eficacia del protector (código de eficacia)
I.27-2	100	TRZAS	4
I.25-2	100	TRZAS	3
I.26-17	100	TRZAS	2
I.25-43	500	TRZAS	2
I.26-2	500	TRZAS	4
I.26-2	100	TRZAS	3

2.2 Efecto relativo de compuestos seleccionados de acuerdo con la invención utilizando el ejemplo de la reducción nociva de mesosulfurona-metilo en cebada de primavera (HORVS)

5 Las semillas de las plantas de cultivo por tratar se colocaron en macetas de plástico (diámetro ~4 cm) en suelo franco arenoso, se cubrieron con tierra y se cultivaron en el invernadero en buenas condiciones para la germinación y crecimiento. Las plantas de ensayo se trataron en la etapa inicial de la hoja del follaje (BBCH10 – BBCH12). Los compuestos según la invención, formulados en forma de polvos humectables (WP), se utilizaron como suspensión acuosa con una tasa de aplicación de agua correspondiente a 800 l/ha con la adición de agentes humectantes (por ejemplo, 0,2% de Genapol-LRO o 0,2% de Mero) rociados en las partes aéreas de la planta en la dosis especificada.

10 Posteriormente se aplicó el herbicida. Para ello, se utilizó mesosulfurona-metilo, formulada como granulado dispersable en agua (WG), como una dispersión acuosa con una tasa de aplicación de agua de 800 l/ha con la adición de agente humectante (por ejemplo, 0,2% de Genapol-LRO o 1 l/ha de Biopower) en una dosis de 40-60 g/ha pulverizados en las partes aéreas de la planta. La dosis del herbicida se eligió de modo que en el momento de la evaluación causara un daño moderado y claramente visible (mínimo 30%, máximo 75%) en comparación con cultivos no tratados en un grupo de control de plantas de cultivo sin tratamiento protector incluido en el mismo experimento.

15 Después de la aplicación, las plantas se cultivaron en un invernadero en buenas condiciones de crecimiento. Se llevó a cabo una evaluación visual de la eficacia de los compuestos de prueba 9-13 días después de la aplicación. Para ello, se comparó el aspecto de las plantas tratadas con el compuesto de ensayo y el herbicida con los correspondientes controles de herbicidas (sin protector; con daño claramente reconocible) así como con los controles sin tratar (sin daño). El efecto de reducción de daños de los compuestos de prueba se registró por separado para 2 repeticiones en "Códigos de eficacia" de acuerdo con el siguiente esquema:

0: sin reducción de daños (aparición según el control de herbicidas)

1: reducción de daño débil

2: reducción significativa de daños

3: fuerte reducción de daños

25 4: reducción completa de daños (aparición según el control sin tratar)

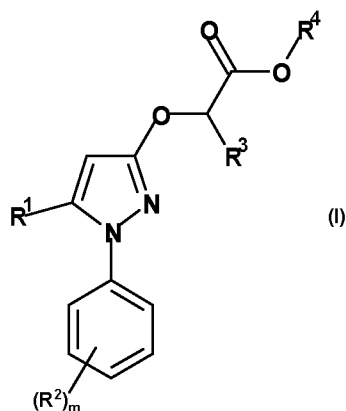
Los ensayos muestran una clara eficacia de los compuestos según la invención seleccionados a modo de ejemplo en términos de reducción del daño a las plantas de cultivo tales como, por ejemplo, cebada de verano (HORVS; cv. Montoya) provocado por herbicidas tales como, por ejemplo, mesosulfurona-metilo

Ejemplo N.º	Dosis del protector de la fórmula (l) (g/ha)	Planta de cultivo	Eficacia del protector (código de eficacia)
I.26-17	100	HORVS	2

30

## REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula general (I) o sus sales



en donde

- 5  $R^1$  representa heteroarilo, salvo tienilo, en el que el radical de heteroarilo no está sustituido o está sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo (C1–C6), alqueno (C2–C6), alquinilo (C2–C6), cicloalquilo (C3–C8), cicloalqueno (C3–C8), alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>, en los que los últimos siete radicales mencionados no están sustituidos o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>,
- 10  $R^2$  representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo (C1–C6), alqueno (C2–C6), alquinilo (C2–C6), cicloalquilo (C3–C8), cicloalqueno (C3–C8), alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>, en el que los últimos siete radicales mencionados no están sustituido o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C1–C6) y alquil (C1–C6)–S(O)<sub>p</sub>,
- $R^3$  representa hidrógeno y alquilo (C1–C6),
- 15  $R^4$  representa hidrógeno, alquilo (C1–C18), haloalquilo (C1–C18), cianoalquilo (C1–C18), alqueno (C2–C18), alquinilo (C2–C18), cicloalquilo (C3–C12), cicloalqueno (C3–C12), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1–C18)–alquilo (C1–C18), haloalcoxi (C1–C18)–alquilo (C1–C18), alcoxi (C1–C18)–haloalquilo (C1–C18), alquil (C1–C18)–tio–alquilo (C1–C18), haloalquil (C1–C18)–tio–alquilo (C1–C18), haloalqueno (C2–C18), haloalquinilo (C2–C18), heterociclil–alquilo (C1–C18), aril–alquilo (C1–C18), cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C18), alcoxi (C1–C18)–carbonil–alquilo (C1–C18) y alcoxi (C1–C18)–carbonil–cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C18), o
- 20 un radical de la fórmula  $-NR^aR^b$  o  $-N=CR^cR^d$ ,
- en la que en los últimos 2 radicales mencionados cada uno de los radicales  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  y  $R^d$  de modo independiente entre sí, hidrógeno, alquilo (C1–C4), alqueno (C2–C4), alquinilo (C2–C4), bencilo, bencilo sustituido, fenilo o fenilo sustituido
- 25 o  $R^a$  y  $R^b$  pueden formar, junto con el átomo de N, un heterociclo de 3 a 8 miembros, que puede contener uno o dos átomos del heteroanillo adicionales del grupo N, O y S y que no está sustituido o que está sustituido con uno o más radicales del grupo alquilo (C1–C4) y haloalquilo (C1–C4),
- o  $R^c$  y  $R^d$  forman junto con el átomo de C un radical carbocíclico o heterocíclico de 3 a 8 miembros, que puede contener 1 a 3 átomos del heteroanillo del grupo N, O y S, en el que el radical carbocíclico o heterocíclico no está sustituido o está sustituido con uno o más radicales del grupo alquilo (C1–C4) y haloalquilo (C1–C4),
- 30 m significa un número de 0 a 5,
- y
- 35 p significa 0, 1 o 2.

2. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o sus sales, en donde

$R^1$  representa heteroarilo, salvo tienilo, en la que el radical de heteroarilo no está sustituido o está sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo (C1–C6), alqueno (C2–C6), alquinilo (C2–C4),

cicloalquilo (C3–C6), cicloalquenilo (C3–C6), alcoxi (C1–C4) y alquil (C1–C4)–S(O)<sub>p</sub>, en la que los últimos siete radicales mencionados no están sustituido o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C1–C4) y alquil (C1–C4)–S(O)<sub>p</sub>,

5 R<sup>2</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo (C1–C4), alquenilo (C2–C4), alquinilo (C2–C4), cicloalquilo (C3–C6), cicloalquenilo (C3–C6), alcoxi (C1–C4) y alquil (C1–C4)–S(O)<sub>p</sub>, en la que los últimos siete radicales mencionados no están sustituido o están sustituidos con uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, alcoxi (C1–C4) y alquil (C1–C4)–S(O)<sub>p</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno y alquilo (C1–C4),

10 R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo (C1–C16), haloalquilo (C1–C16), cianoalquilo (C1–C16), alquenilo (C2–C16), alquinilo (C2–C16), cicloalquilo (C3–C12), cicloalquenilo (C3–C12), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1–C16)–alquilo (C1–C16), haloalcoxi (C1–C16)–alquilo (C1–C16), alcoxi (C1–C16)–haloalquilo (C1–C16), alquil (C1–C16)–tio–alquilo (C1–C16), haloalquil (C1–C16)–tio–alquilo (C1–C16), haloalquenilo (C2–C16), haloalquinilo (C2–C16), heterocicil–alquilo (C1–C16), aril–alquilo (C1–C16), cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C16), alcoxi (C1–C16)–carbonil–alquilo (C1–C16) y alcoxi (C1–C16)–carbonil–cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C16),

15 m significa un número de 0 a 4,

y

p significa 0, 1 o 2.

3. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o sus sales, en donde

20 R<sup>1</sup> representa heteroarilo, salvo tienilo, en la que el radical de heteroarilo no está sustituido o está mono– o polisustituido con halógeno, ciano, metilo, etilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

R<sup>2</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, metilo, etilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

25 R<sup>3</sup> representa hidrógeno, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y CH<sub>3</sub>,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo (C1–C12), haloalquilo (C1–C12), cianoalquilo (C1–C12),

30 alquenilo (C2–C12), alquinilo (C2–C12), cicloalquilo (C3–C12), cicloalquenilo (C3–C12), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1–C12)–alquilo (C1–C12), haloalcoxi (C1–C12)–alquilo (C1–C12), alcoxi (C1–C12)–haloalquilo (C1–C12), alquil (C1–C12)–tio–alquilo (C1–C12), haloalquil (C1–C12)–tio–alquilo (C1–C12), haloalquenilo (C2–C12), haloalquinilo (C2–C12), heterocicil–alquilo (C1–C12), aril–alquilo (C1–C12), cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C12), alcoxi (C1–C12)–carbonil–alquilo (C1–C12) y alcoxi (C1–C12)–carbonil–cicloalquil (C3–C12)–alquilo (C1–C12),

m representa un número de 0, 1, 2 o 3,

y

35 p significa 0, 1 o 2.

4. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o sus sales, en donde

40 R<sup>1</sup> representa piridin–2–ilo, piridin–3–ilo, piridin–4–ilo, pirazin–2–ilo, pirazin–3–ilo, pirimidin–2–ilo, pirimidin–4–ilo, pirimidin–5–ilo, piridazin–3–ilo, piridazin–4–ilo, 1,3,5–triazin–2–ilo, 1,2,4–triazin–3–ilo, 1,2,4–triazin–5–ilo, 1,2,4–triazin–6–ilo, 1,2,3–triazin–4–ilo, 1,2,3–triazin–5–ilo, 1,2,4–, 1,3,2–, 1,3,6– y 1,2,6–oxazinilo, isoxazol–3–ilo, isoxazol–4–ilo, isoxazol–5–ilo, 1,3–oxazol–2–ilo, 1,3–oxazol–4–ilo, 1,3–oxazol–5–ilo, isotiazol–3–ilo, isotiazol–4–ilo, isotiazol–5–ilo, 1,3–tiazol–2–ilo, 1,3–tiazol–4–ilo, 1,3–tiazol–5–ilo, 1H–pirrol–1–ilo, 1H–pirrol–2–ilo, 1H–pirrol–3–ilo, furan–2–ilo, furan–3–ilo, 1H–imidazol–1–ilo; 1H–imidazol–2–ilo; 1H–imidazol–4–ilo; 1H–imidazol–5–ilo, 1H–pirazol–1–ilo, 1H–pirazol–3–ilo, 1H–pirazol–4–ilo, 1H–pirazol–5–ilo, 1H–1,2,3–triazol–1–ilo, 1H–1,2,3–triazol–4–ilo, 1H–1,2,3–triazol–5–ilo, 2H–1,2,3–triazol–2–ilo, 2H–1,2,3–triazol–4–ilo, 1H–1,2,4–triazol–1–ilo, 1H–1,2,4–triazol–3–ilo, 4H–1,2,4–triazol–4–ilo, 1,2,4–oxadiazol–3–ilo, 1,2,4–oxadiazol–5–ilo, 1,3,4–oxadiazol–2–ilo, 1,2,3–oxadiazol–4–ilo, 1,2,3–oxadiazol–5–ilo, 1,2,5–oxadiazol–3–ilo, 1,3,4–tiadiazol–2–ilo, 1,3,4–tiadiazol–5–ilo, 1,2,4–tiadiazol–5–ilo, 1,2,4–tiadiazol–3–ilo, 1,2,5–tiadiazol–3–ilo, 1,2,5–tiadiazol–4–ilo, 1,2,3–tiadiazol–5–ilo, que no está sustituido o que está mono– o polisustituido con halógeno, ciano, metilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

50

ES 3 018 232 T3

R<sup>2</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, CN, metilo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno y CH<sub>3</sub>,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo (C1–C10), haloalquilo (C1–C10), cianoalquilo (C1–C10),

5 alquenilo (C2–C10), alquinilo (C2–C10), cicloalquilo (C3–C9), cicloalquenilo (C3–C9), arilo, heteroarilo, alcoxi (C1–C10)–alquilo (C1–C10), haloalcoxi (C1–C10)–alquilo (C1–C10), alcoxi (C1–C10)–haloalquilo (C1–C10), alquil (C1–C10)–tio–alquilo (C1–C10), haloalquil (C1–C10)–tio–alquilo (C1–C10), haloalquenilo (C2–C18), haloalquinilo (C2–C18), heterocicil–alquilo (C1–C10), aril–alquilo (C1–C10), cicloalquil (C3–C9)–alquilo (C1–C10), alcoxi (C1–C10)–carbonil–alquilo (C1–C10) y alcoxi (C1–C10)–carbonil–cicloalquil (C3–C9)–alquilo (C1–C10),

m representa un número de 0, 1, 2 o 3,

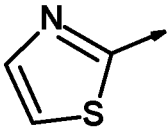
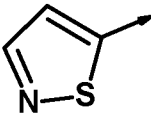
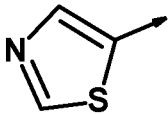
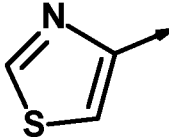
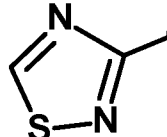
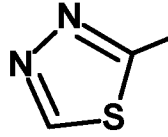
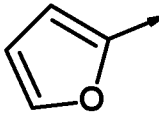
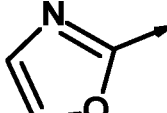
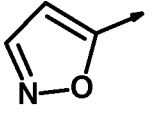
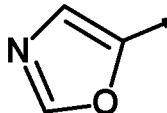
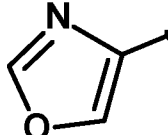
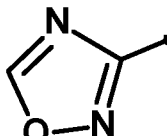
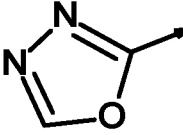
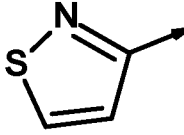
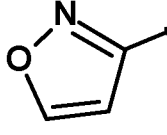
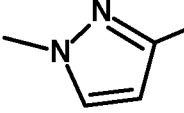
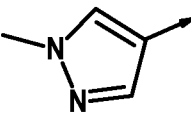
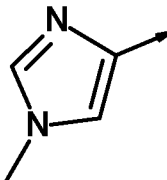
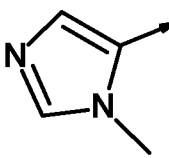
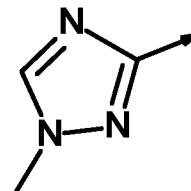
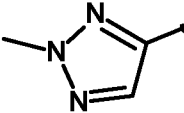
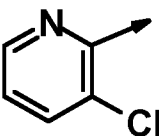
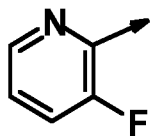
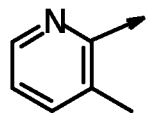
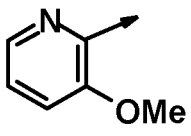
y

p significa 0, 1 o 2.

5. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o sus sales, en donde

15 R<sup>1</sup> representa los grupos Q–1.1 a Q–1.59

Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20

Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25
				
Q-1.35				
				
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
				
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45
				
Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50
				
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53	Q-1.54	Q-1.55
				
Q-1.56	Q-1.57	Q-1.58	Q-1.59	

R<sup>2</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y SCF<sub>3</sub>,

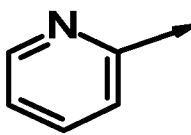
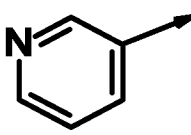
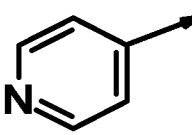
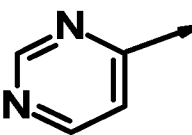
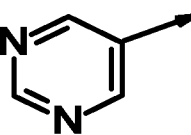
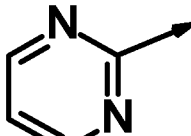
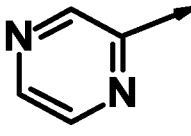
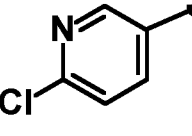
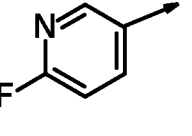
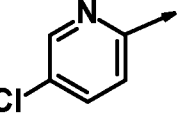
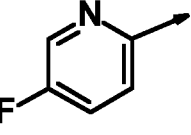
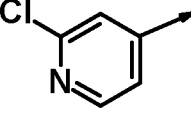
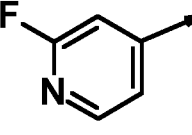
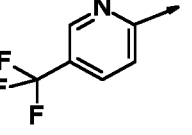
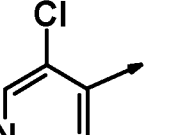
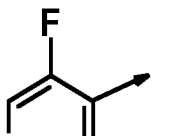
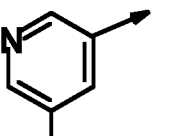
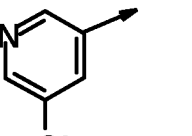
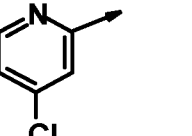
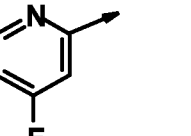
R<sup>3</sup> representa hidrógeno,

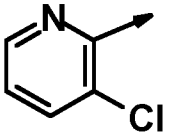
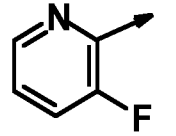
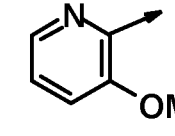
R<sup>4</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, n-pentilo, fenilo, bencilo, H<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph), 2-metoxietilo, tetrahidrofuran-2-il-metilo, tetrahidrofuran-3-il-metilo, tetrahidropiran-2-il-metilo, tetrahidropiran-3-il-metilo, tetrahidropiran-4-il-metilo, metilpropionat-3-ilo, etilpropionat-3-ilo, metilacet-2-ilo, etilacet-2-ilo, metilpivalat-2-ilo, etilpivalat-3-ilo, metil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2,2-dimetilpropanoat-3-ilo, etil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2-propanoat-2-ilo, etil-2-propanoat-2-ilo, metil-acetat-2-ilo, etil-acetat-2-ilo, metil-1-metilciclopropanocarboxilat-2-ilo, etil-1-metilciclopropanocarboxilat-2-ilo, 2-(dimetilamino)etilo, oxetan-3-ilo, (3-metiloxetan-3-il)metilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, ciclopropilmetilo, 1-ciclopropil-etilo, (1-metil-ciclopropil)-metilo, (2,2-diclorociclopropil)-metilo, (2,2-dimetil-ciclopropil)-metilo, alilo, propargil (prop-2-in-1-il), 2-cloroprop-2-en-1-ilo, 3-fenilprop-2-in-1-ilo, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ilo, 3,3-dicloro-2-fluor-prop-2-en-1-ilo, metilprop-2-in-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 4-cloro-but-2-in-1-ilo, 3-metil-but-2-en-1-ilo, 3-metil-but-1-en-1-ilo, 1-(2E)-1-metilbut-2-en-1-ilo, (E)-pent-3-en-2-ilo o (Z)-pent-3-en-2-ilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, heptan-2-ilo, iso-butilo, 1,3-dioxolan-2-ilmetilo o 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-metilo,

m representa un número de 0, 1, 2 o 3.

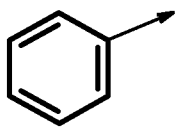
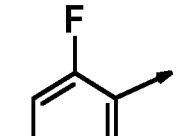
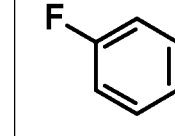
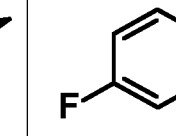
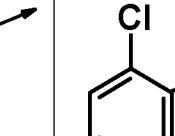
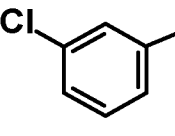
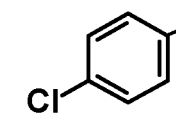
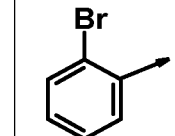
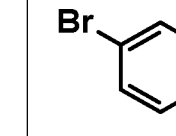
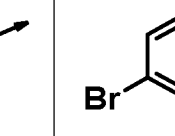
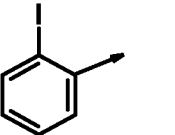
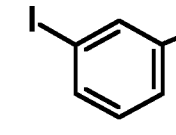
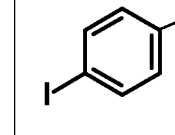
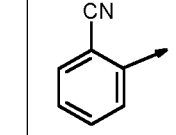
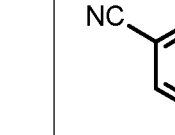
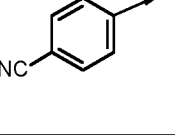
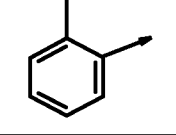
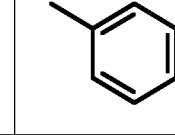
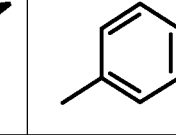
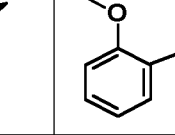
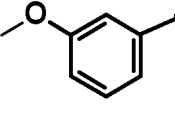
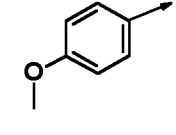
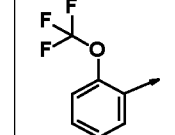
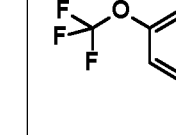
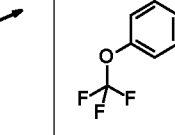
6. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o sus sales, en donde

R<sup>1</sup> representa los siguientes grupos seleccionados de Q-1.1 a Q-1.59

				
Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
				
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.10	Q-1.11	Q-1.12
				
Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15	Q-1.17	Q-1.18
				
Q-1.19	Q-1.21	Q-1.22	Q-1.24	Q-1.25

		
Q-1.56	Q-1.57	Q-1.59

y (R<sup>2</sup>)<sub>m</sub>-fenilo representa los grupos Q-2.1 a Q-2.53

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10
				
Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20
				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25

Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45
Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53		

R<sup>3</sup> representa hidrógeno,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, n-pentilo, fenilo, bencilo, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-OMe-Ph), 2-metoxietilo, tetrahidrofuran-2-il-metilo, tetrahidrofuran-3-il-metilo, tetrahidropiran-2-il-metilo, tetrahidropiran-3-il-metilo, tetrahidropiran-4-il-metilo, metilpropionat-3-ilo, etilpropionat-3-ilo, metilacetat-2-ilo, etilacetat-2-ilo, metilpivalat-2-ilo, etilpivalat-3-ilo, metil-2-metilpropanoat-3-ilo, metil-2,2-dimetilpropanoat-3-ilo, etil-2-

- 5 metilpropanoat-3-ilo, metil-2-propanoat-2-ilo, etil-2-propanoat-2-ilo, metilacet-2-ilo, etilacet-2-ilo, metil-1-metilciclopropan-carboxilat-2-ilo, etil-1-metilciclopropan-carboxilat-2-ilo, 2-(dimetilamino)etilo, oxetan-3-ilo, (3-metiloxetan-3-il)metilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, ciclopropilmetilo, 1-ciclopropil-etilo, (1-metil-ciclopropil)-metilo, (2,2-diclorociclopropil)-metilo, (2,2-dimetil-ciclopropil)-metilo, alilo, propargil (prop-2-in-1-il), 2-cloroprop-2-en-1-ilo, 3-fenilprop-2-in-1-ilo, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ilo, 3,3-dicloro-2-fluor-prop-2-en-1-ilo, metilprop-2-in-1-ilo, 2-metilprop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo, 4-cloro-but-2-in-1-ilo, 3-metil-but-2-en-1-ilo, 3-metil-but-1-en-1-ilo, 1-(2E)-1-metilbut-2-en-1-ilo, (E)-pent-3-en-2-ilo o (Z)-pent-3-en-2-ilo, 10 ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, heptan-2-ilo, iso-butilo, 1,3-dioxolan-2-ilmetilo o 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-metilo.
7. Agente protector de plantas útiles o cultivos, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de la fórmula general (I) o sus sales de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 6, en combinación con otros agroquímicos y eventualmente excipientes de formulación.
- 15 8. Agente de acuerdo con la reivindicación 7, que contiene al menos un herbicida.
9. Procedimiento para reducir los efectos fitotóxicos de los plaguicidas en plantas útiles o de cultivo por uso de uno o más compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1-6 o los agentes de acuerdo con las reivindicaciones 7 y 8.
- 20 10. Procedimiento para reducir los efectos fitotóxicos de los plaguicidas en plantas útiles o de cultivo, **caracterizado porque** se aplican uno o más compuestos de la fórmula general (I) según la invención de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6 para el uso conjunto de plaguicidas al mismo tiempo o en cualquier orden con los plaguicidas.
11. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 10, en el que en el caso de los plaguicidas se trata de uno o más herbicidas.
- 25 12. Procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 10 u 11, caracterizado porque los compuestos de la fórmula (I) o sus sales se aplican de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6 sobre las plantas, partes de las plantas, sus semillas o simientes.