Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

Organizacion CSA Ltda

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** 0008334

54. **TÍTULO** Fenil-sulfonilureas, procedimientos para su preparacion y su utilizacion como herbicidas y reguladores del cresimiento de las plantas.

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL** ADIN 47/36.

71. **SOLICITANTE** HOECHST SCHERING AGREVO GmbH.

DOMICILIO Berlin Alemania.

74. **APODERADO** Gustavo Hollmann Restrepo

22. **BOGOTÁ, D. C.,** Febrero 9, 2000.

(FORMA P-10)

2846'91

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. **EXPEDIENTE No.** 00-8334

54. **TITULO** Fenil-sulfonilureas, procedimientos para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas

51. **CLASIFICACION INTERNACIONAL** A01N47/36

71. **SOLICITANTE** Hoechst Schering AgrEvo GmbH

DOMICILIO Berlin, Alemania

74. **APODERADO** Gustavo Hollmann Restrepo

22. **SANTAFE DE BOGOTA, D.C.** Febrero 9, 2000

13

(FORMA P 10)

2846

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

00 8334

SUPERINTENDENCIA INDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00008334 0000000 Folios: 11
Fecha (AMD): 2000-02-09 15:39:55
Tramite : 002 PATENTES 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social: HOECHST SCHERING AGREVO GmbH

No. de Identificación:

Representante Legal (Persona Jurídica):

País de Domicilio: ALEMANIA

Departamento o Estado:

Dirección:

Ciudad: BERLIN Teléfono:

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre: GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

Dirección y Domicilio: Cra. 11A No. 94-76 - Of. 308

Ciudad: Santafé de Bogotá, D.C. Teléfono:

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es): 1. Dr. Hansjörg DIETRICH, 2. Dr. Christian WALDRAFF, 3. Dr. Lothar WILLMS, 4. Dr. Hermann BIERINGER, 5. Dr. Christopher ROSINGER, 6. Dr. Felix THURWACHTER y Dr. Thomas AULER.

Identificación:

Dirección: 1. Kriftel,Alemania, 2. Frankfurt,Alemania, 3. Hofheim, Alemania, 4. Eppstein,Alemania, 5. Hofheim,Alemania, 6. Bad Homburg,Alemania y 7. Bad Soden,Alemania.

Ciudad: Teléfono:

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Titulo de la Invención "FENIL-SULFONIL-UREAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y SU UTILIZACION COMO HERBICIDAS Y REGULADORES DEL CRECIMIENTO DE LAS PLANTAS" (Folio 306)

PRIORIDAD REIVINDICADA Convenio de Paris. SI ☐ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País Alemania (32) Fecha Febrero 10,1999 (31) No. Solicitud 199 05 453.3

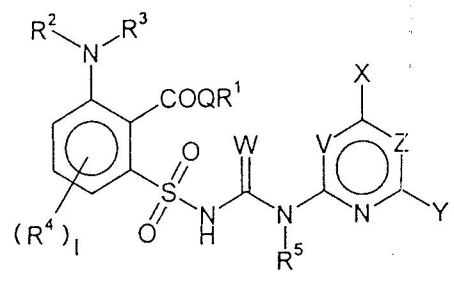
Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL ~~C 07~~ A01N

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

Fenil-sulfonil-ureas, procedimiento para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas.

Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales



(I)

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica	
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC 15919	X
Recibo de la tasa respectiva	X
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	
Si se reivindica prioridad Andina:	
Copia de la primera solicitud	
Traducción oficial	
Si se reivindica prioridad Unionista: Convenio de Paris.	
Copia certificada de la primera solicitud:	
Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción simple	
Capítulo descriptivo	X
Dibujos, planos necesarios	
Capítulo reivindicatorio	X
Tarjeta archivo propietarios según formato	X
Tarjeta archivo temático según formato	X
Extracto para publicación según formato	X
Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms	
Otros Documentos	

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

NOMBRE GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO CC. 2.878.023 de Bogotá T.P.No. 5903

Continuación Resumen con el objeto y finalidad de la invención:

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átoos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^o-Q^o-, en la que R^o significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituidos y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, y Q^o significa un enlace directo o un grupo de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando $R^\#$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono, o un radical que contiene carbono,

1 es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógreno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituír o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), preferiblemente H ó CH_3,

Q es O, S ó NR^*,

R^* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinio (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X y Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno,

Continuación Resumen con el objeto y finalidad de la invención:

halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di- alquil (C_1-C_4) amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N, se adecuan como herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas, p.ej. para combatir plantas dañinas en presencia de plantascultivadas, también plantas cultivadas transgénicas. Se pueden preparar estos compuestos de acuerdo con procedimientos según la reivindicación 6 pasando en parte por productos intermedios nuevos (compárense los compuestos (II*) y (X*) y (VIII) según las reivindicaciones 12, 14 y 16).

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00008334 00000000 Folios: 113
Fecha (AMD): 2000-02-09 15:39:55
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 8,206
FECHA : FEBRERO 3 DE 2000

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
GUSTAVO HOLLMAN	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	749780	2,152,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005 C: 01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	600,000.00
		TOTAL : $	600,000.00

SON: SEISCIENTOS MIL PESOS

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RADICACION

FIRMA DE CAJA

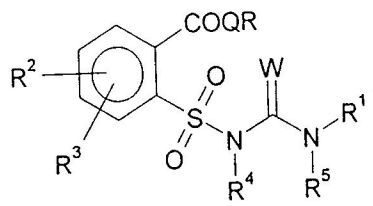
COPIA DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

AGR 1999/M201

Fenil-sulfonil-ureas, procedimiento para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas

Es sabido que ciertas fenil-sulfonil-ureas sustituidas poseen propiedades herbicidas. En tal caso se trata de derivados de ácido benzoico de la fórmula general A (documentos de solicitudes de patente europea EP-A-7.687 y EP-A-30.138)

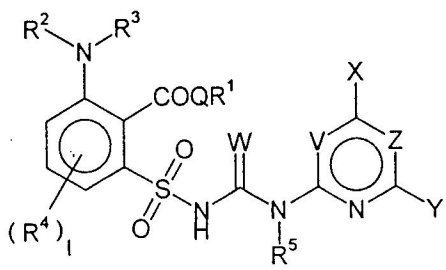


(A)

Además, por el documento de patente alemana DE-4.322.067 es conocido que ciertas fenil-sulfonil-ureas sustituidas con acil-amino presentan propiedades herbicidas.

Sorprendentemente, se encontraron por fin unas especiales fenil-sulfonil-ureas sustituidas en 1,2,3 que se adecuan especialmente bien como agentes herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas.

Son objeto del presente invento por consiguiente compuestos de la fórmula (I) o sus sales,



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando $R^\#$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono o un radical que contiene carbono, que tiene de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

l es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C, preferiblemente de 1 a 10 átomos de C, p.ej. alquilo (C_1-C_4)

sin sustituir o sustituido, preferiblemente H ó CH_3,

Q es O, S ó NR*,

R* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C, preferiblemente de 1 a 10 átomos de C, p.ej. alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X, Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales, en las cuales el hidrógeno del grupo -SO_2-NH ha sido reemplazado por un catión apropiado para la agricultura. Estas sales son por ejemplo sales de metales, especialmente sales de metales alcalinos o sales de metales alcalinotérreos, especialmente sales de sodio y potasio, o también sales de amonio o sales con aminas orgánicas. Asimismo la formación de sales puede efectuarse mediante reacción por adición de un ácido con grupos básicos, tales como p.ej. amino y alquil-amino. Ácidos apropiados para ello son ácidos inorgánicos y orgánicos fuertes, por ejemplo HCl, HBr, H_2SO_4 o HNO_3.

En la fórmula (I), en cada caso ambos radicales R^0 y $R^{\#}$, R^2 y R^3 así como R* y R^1 forman uno con otro un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno.

Los radicales que contienen carbono son radicales orgánicos que contienen por lo menos un átomo de carbono, preferiblemente de 1 a 30 átomos de C, de modo especialmente preferido de 1 a 20 átomos de C, y además por lo menos un átomo de uno o varios otros elementos del Sistema Periódico de los Elementos tales como H, Si, N, P, O, S, F, Cl, Br ó I. Ejemplos de radicales que contienen carbono son radicales hidrocarbilo sin sustituir o sustituidos, que pueden estar unidos al entramado fundamental directamente o a través de un heteroátomo tal como N, S, P u O, o significan radicales heterociclilo sin sustituir o sustituidos, radicales acilo que contienen carbono o ciano.

En la fórmula (I) y en todas las fórmulas subsiguientes, los radicales que contienen carbono tales como alquilo, alcoxi, halo-alquilo, halo-alcoxi, alquil-amino y alquil-tio así como los correspondientes radicales insaturados y/o sustituidos existentes en el entramado de carbonos pueden ser en cada caso lineales o ramificados. Cuando no se indica de modo especial, en estos radicales son preferidos los entramados de carbono inferiores, p.ej. con 1 a 6 átomos de C o, en el caso de grupos insaturados, con 2 a 6 átomos de C. Los radicales alquilo, también en los significados compuestos, tales como alcoxi, halo-alquilo, etc., significan p.ej. metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, t- o 2-butilo, pentilos, hexilos, tales como n-hexilo, i-hexilo y 1,3-dimetil-butilo, heptilos, tales como n-heptilo, 1-metil-hexilo y 1,4-dimetil-pentilo; los radicales alquenilo y alquinilo tienen los significados de los radicales insaturados posibles correspondientes a los radicales alquilo; alquenilo significa p.ej. alilo, 1-metil-prop-2-en-1-ilo, 2-metil-prop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metil-but-3-en-1-ilo y 1-metil-but-2-en-1-ilo; alquinilo significa p.ej. propargilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo y 1-metil-but-3-in-1-ilo.

Alquenilo en la forma de alquenilo (C_3-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquenilo (C_3-C_6), alquenilo (C_3-C_8) o alquenilo (C_3-C_{12}) significa preferiblemente un radical alquenilo con

3 a 4, 3 a 5, 3 a 6, 3 a 8 ó 3 a 12 átomos de C respectivamente, en el que el doble enlace no está situado junto al átomo de C, que está unido con la parte restante de la molécula del compuesto (I) (posición de "ilo"). Lo correspondiente es válido para alquinilo (C_3-C_4), etc., alquenil (C_3-C_4)-oxi, etc., y alquinil (C_3-C_4)-oxi, etc.

Cicloalquilo significa un sistema anular saturado carbocíclico con 3-8 átomos de C, p.ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

Los radicales que contienen nitrógeno y están exentos de carbono son radicales que contienen preferiblemente de 1 a 10 átomos de N, de modo especialmente preferido 1 ó 2 átomos de N y además de ello preferiblemente uno o varios de átomos de uno o varios elementos distintos del carbono del Sistema Periódico de los Elementos tales como H, O ó S. Ejemplos de radicales que contienen nitrógeno y están exentos de carbono son NH_2, NO_2, NHOH, NO, NH-NH_2 ó N_3.

Halógeno significa por ejemplo fluoro, cloro, bromo o yodo. Los halo-alquilo, -alquenilo y -alquinilo significan respectivamente radicales alquilo, alquenilo o alquinilo parcial o totalmente sustituidos con halógeno, preferiblemente con fluoro, cloro y/o bromo, especialmente con fluoro o cloro, p.ej. CF_3, CHF_2, CH_2F, CF_3CF_2, CH_2FCHCl, CCl_3, $CHCl_2$, CH_2CH_2Cl; halo-alcoxi es p.ej. OCF_3, $OCHF_2$, OCH_2F, CF_3CF_2O, OCH_2CF_3 y OCH_2CH_2Cl; lo correspondiente es válido para halo-alquenilo y otros radicales sustituidos con halógeno.

Un radical hidrocarbilo es un radical hidrocarbilo alifático lineal, ramificado o cíclico y saturado o insaturado o aromático, p.ej. alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquenilo o arilo; arilo significa en este caso un sistema aromático mono-, bi- o poli-cíclico, por ejemplo fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, pentalenilo, fluorenilo y similares, preferiblemente fenilo;
preferiblemente, un radical hidrocarbilo significa alquilo, alquenilo o alquinilo con hasta 12 átomos de C, o cicloal-

quilo con 3, 4, 5, 6 ó 7 átomos de anillo, o fenilo.

Un radical o anillo heterocíclico (heterociclilo) puede ser saturado, insaturado o heteroaromático, y estar sin sustituir o sustituido; contiene preferiblemente uno o varios heteroátomos en el anillo, preferiblemente tomados entre el grupo formado por N, O y S; preferiblemente, es un radical heterociclilo alifático con 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático con 5 ó 6 átomos de anillo y contiene 1, 2 ó 3 heteroátomos. El radical heterocíclico puede ser p.ej. un radical o anillo heteroaromático (heteroarilo), tal como p.ej. un sistema aromático, mono-, bi-, o poli-cíclico, en el que por lo menos 1 anillo contiene uno o varios heteroátomos, por ejemplo piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, oxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo e imidazolilo, o es un radical parcial o totalmente hidrogenado tal como oxiranilo, oxetanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, morfolinilo y tetrahidrofurilo. Como sustituyentes para un radical heterocíclico sustituido entran en cuestión los sustituyentes mencionados más adelante en esta memoria, y adicionalamente también oxo. El grupo oxo puede presentarse también junto a los heteroátomos de anillo, que pueden existir en diferentes etapas de oxidación, p.ej. en los casos de N y S.

Los radicales sustituidos, tales como los radicales hidrocarbilo sustituidos, p.ej. alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, fenilo y bencilo sustituidos, o heterociclilo o heteroarilo sustituidos, significan por ejemplo un radical sustituido que se deriva del entramado fundamental sin sustituir, significando los sustituyentes por ejemplo uno o varios, preferiblemente 1, 2 ó 3 radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi, halo-alcoxi, alquil-tio, hidroxi, amino, nitro, carboxi, ciano, azido, alcoxi-carbonilo, alquil-carbonilo, formilo, carbamoílo, (mono- y di-alquil)-amino-carbonilo, amino sustituido, tal como acil-amino, mono- y di-alquil-amino, y alquil-sulfinilo, halo-alquil-sulfinilo, alquil-sulfonilo, halo-alquil-sulfonilo

y, en el caso de radicales cíclicos, también alquilo y halo-alquilo así como los radicales alifáticos insaturados correspondientes a los radicales que contienen hidrocarbilo saturados que se han mencionado, tales como alquenilo, alquinilo, alquenil-oxi, alquinil-oxi, etc. En el caso de los radicales con átomos de C, son preferidos los que tienen de 1 a 4 átomos de C, especialmente 1 ó 2 átomos de C. Son preferidos por regla general los sustituyentes tomados entre el grupo formado por halógeno, p.ej. fluoro y cloro, alquilo (C_1-C_4), preferiblemente metilo o etilo, halo-alquilo (C_1-C_4), preferiblemente trifluorometilo, alcoxi (C_1-C_4), preferiblemente metoxi o etoxi, halo-alcoxi (C_1-C_4), nitro y ciano. Se prefieren especialmente en este caso los sustituyentes metilo, metoxi y cloro.

Un fenilo eventualmente sustituido es preferiblemente fenilo, que está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces, preferiblemente hasta tres veces con radicales iguales o diferentes tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), halógeno-alcoxi (C_1-C_4) y nitro, p.ej. o-, m- y p-tolilo, dimetil-fenilos, 2-, 3- y 4-cloro-fenilo, 2-, 3- y 4-trifluoro- y -tricloro-fenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-dicloro-fenilo, o-, m- y p-metoxi-fenilo.

Un amino mono- o di-sustituido significa un radical químicamente estable tomado entre el grupo formado por los radicales amino sustituidos, que por ejemplo están sustituidos en N con uno o dos radicales iguales o diferentes tomados entre el grupo formado por alquilo, alcoxi, acilo y arilo; preferiblemente monoalquil-amino, dialquil-amino, acil-amino, aril-amino, N-alquil-N-aril-amino así como heterociclos con N; en tal caso se prefieren los radicales alquilo con 1 a 4 átomos de C; arilo es en tal caso preferiblemente fenilo o fenilo sustituido; para acilo es válida en este caso la definición mencionada más adelante, preferiblemente formilo, alquil (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo. Lo correspondiente es válido para hidroxil-amino o hidrazino sustituido.

Un radical acilo significa el radical de un ácido orgánico, que resulta formalmente por separación de un grupo OH desde el ácido orgánico, p.ej. el radical de un ácido carboxílico y radicales de ácidos derivados de éste, tales como el ácido tio-carboxílico, ácidos imino-carboxílicos eventualmente sustituidos en N, o los radicales de monoésteres de ácido carbónico, ácidos carbámicos eventualmente sustituidos en N, ácidos sulfónicos, ácidos sulfínicos, ácidos fosfónicos y ácidos fosfínicos.

Un radical acilo es preferiblemente formilo o acilo alifático tomado entre el grupo formado por CO-R^x, CS-R^x, CO-OR^x, CS-OR^x, CS-SR^x, SOR^y ó SO_2R^y, significando R^x y R^y en cada caso un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, o amino-carbonilo o amino-sulfonilo, estando los dos radicales mencionados en último término sin sustituir, monosustituidos en N o disustituidos en N,N. Acilo significa por ejemplo formilo, halógeno-alquil-carbonilo, alquil-carbonilo tal como alquil (C_1-C_4)-carbonilo, fenil-carbonilo, pudiendo el anillo de fenilo estar sustituido, p.ej. tal como antes se señala para fenilo, o alquiloxi-carbonilo, feniloxi-carbonilo, benciloxi-carbonilo, alquil-sulfonilo, alquil-sulfinilo, N-alquil-1-imino-alquilo y otros radicales de ácidos orgánicos.

Son objeto del invento también todos los estereoisómeros, que están abarcados por la fórmula (I), y sus mezclas. Tales compuestos de la fórmula (I) contienen uno o varios átomos de C asimétricos o también dobles enlaces, que no se indican por separado en la fórmula general (I). Los estereoisómeros posibles, definidos por su forma espacial específica, tales como enantiómeros, diastereoisómeros, e isómeros Z y E, están abarcados todos ellos por la fórmula (I) y se pueden obtener según métodos usuales a partir de mezclas de los estereoisómeros o también por reacciones estéreoselectivas en combinación con el empleo de sustancias de partida estereoquímicamente puras.

Los ejemplos precedentes de radicales o conjuntos de radicales, que entran dentro de los conceptos generales

tales como "alquilo", "acilo", "radicales sustituidos", etc., no significan ninguna enumeración completa. Los conceptos generales abarcan también las definiciones señaladas más adelante en esta memoria para conjuntos de radicales en grupos de compuestos preferidos, especialmente conjuntos de radicales, que abarcan radicales específicos en los Ejemplos de las Tablas.

Sobre todo por razones del más alto efecto herbicida, la mejor selectividad y/o la mejor preparabilidad tienen interés especial los compuestos conformes al invento de la fórmula (I) o sus sales, en los que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo sin sustituir y sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir y sustituido, cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir y sustituido, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo y [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sustituido o sin sustituir, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido,
llevando el fenilo sustituido, el heterociclilo sustituido, el cicloalquilo sustituido o el cicloalquenilo sustituido como sustituyentes uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), di-[alcoxi (C_1-C_4)]-alquilo (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, OH, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0,
en la que R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, SH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_3-C_6), fenilo o heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, pudiendo los cuatro radicales mencionados en último término estar sin sustituir o sustituidos, y
en la que Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N($R^{\#}$)-, significando $R^{\#}$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil-tio (C_1-C_6), halo-alquil (C_1-C_6)-tio, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, o fenilo sin sustituir o sustituido, y R^0 y $R^{\#}$, en común con el átomo de N del grupo $NR^{\#}R^0$ pueden formar un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el

grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo;

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, o fenilo sin sustituir o sustituido, y

R^2 y R^3 en común con el átomo de N del grupo NR^2R^3 (N^1), pueden formar un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en una posición contigua al átomo de N (N^1), y los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alqueniloxi (C_3-C_6), alquiniloxi (C_3-C_6), estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6),

alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o hetrociclilo sin sustituir o sustituido, o significan cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, fenilo sin sustituir o sustituido, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios átomos de halógeno, o significan un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', $S(O)_m$-Q^1-R'''', $P(O)_n$(-Q^1-R''''Q^2-R''), NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando **R'**, **R''** y **R'''**, independientemente unos de otros, un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, significando **R''''** un radical acilo que contiene carbono o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2, independientemente uno de otro, un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y pudiendo ser **m** = 0, 1, 2 ó 3, así como **n** = 0, 1 ó 2, y pudiendo formar **R'** con **R''**, R^+ con **R'**, R^+ con **R''** ó R^+ con **R''''** en cada caso un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que puede estar sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0, 1 ó 2, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 es H o alquilo (C_1-C_4), que está sin sustituir o sustituido,

R^6 y R^7 independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

R^8 y R^9 independientemente uno de otro, significan alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo o, en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

Q es O, S ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio y

R* y R^1 en común con el átomo de N del grupo NR^*R^1 pueden formar un radical heterociclilo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

X, Y independientemente uno de otro, significan H, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino, alquenilo (C_3-C_5), alquenil (C_3-C_5)-oxi, alquinilo (C_3-C_5) o alquinil (C_3-C_5)-oxi, y

teniendo los radicales R^1, R^2, R^3 y R^4, inclusive los sustituyentes, en cada caso hasta 20 átomos de C.

Tienen interés especial los compuestos conformes al invento de la fórmula (I), en la que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, cicloalquilo (C_3-C_6), heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo y [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) o heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4),

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo

(C_3-C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó $-NR^{\#}$, en el que $R^{\#}$ es un átomo de hidrógeno o alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8),

alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo

formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 y R^3 en común con el átomo de N (N^1) pueden formar un heterociclo con 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o aromático, y adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), halógeno, [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_3) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1),

R^4 significa halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi, alquinil (C_3-C_6)-oxi,
estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido, fenilo sin sustituir o sustituido o [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios

átomos de halógeno, o significando un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando R', R'' y R''' independientemente unos de otros un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2 independientemente uno de otro un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido, y pudiendo formar R' con R'' o R^+ con R' o R^+ con R'' en cada caso un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0 ó 1,

R^6 y R^7, independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4), alquinilo (C_3-C_4), o fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 miembros de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados del grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo,

R^8 y R^9 son alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, o en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o

varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo.

Tienen interés especial también los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento y sus sales, en los que

R^1 significa alquilo (C_1-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno y alcoxi (C_1-C_4), o
significa 3-oxetanilo, alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4),

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6),
estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o
significa cicloalquenilo (C_3-C_6), alcoxi (C_1-C_4), alquenil (C_1-C_4)-oxi, alquil (C_1-C_4)-amino o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino y

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6),
estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi

(C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o significa cicloalquenilo (C_3-C_6), o

R^2 y R^3 en común con el átomo de N (N^1), pueden formar un heterociclo de 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o heteroaromático, que adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1), y

R^4 significa alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

R^5 significa H o metilo,

Q significa O ó NR*,

R* significa H o alquilo (C_1-C_4),

X e Y independientemente uno de otro, significan alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios átomos de halógeno, o significan alquil (C_1-C_4)-tio, halógeno o mono- o di-[alquil (C_1-C_2)]-amino, y

W significa un átomo de oxígeno.

Compuestos de la fórmula (I) preferidos conforme al invento o sus sales, son aquéllos en los que

R^1 significa alquilo (C_1-C_3), alilo o propargilo,

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^4 significa alquilo (C_1-C_3) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

Q significa O ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_3),

X significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), alquil (C_1-C_2)-tio, halo-alquilo (C_1-C_2) o halo-alcoxi (C_1-C_2),

Y significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), halógeno, $NHCH_3$ ó $N(CH_3)_2$,

V significa CH ó N, preferiblemente N y

Z significa CH ó N.

Compuestos de la fórmula (I) especialmente preferidos conforme al invento o sus sales, son aquéllos en los que

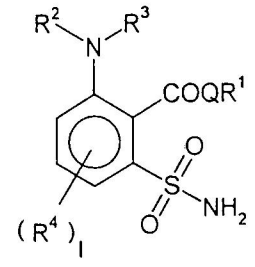
R^1 significa alquilo (C_1-C_3), alilo o propargilo y/o

Q significa un átomo de oxígeno.

Son especialmente preferidos también los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento y sus sales, que contienen una combinación de radicales de los compuestos antes mencionados o contienen los compuestos preferidos, así como aquéllos que contienen radicales individuales o múltiples de los compuestos que se exponen en las Tablas 1 y 2 (véase más adelante). Son asimismo preferidos los compuestos de la fórmula (I) en los que **V** es = N.

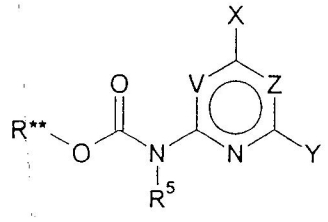
Son objeto del presente invento también procedimientos para la preparación de los compuestos de la fórmula general (I) conformes al invento o de sus sales, en los que

a) se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (II)



(II)

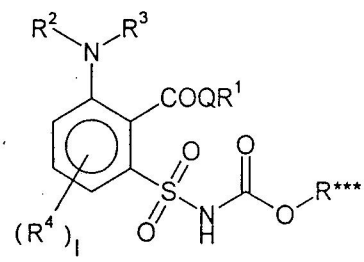
con un carbamato heterocíclico de la fórmula (III),



(III)

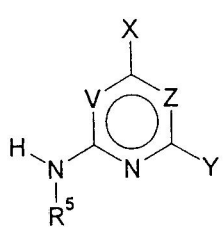
en la que **R**** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, tal como arilo o alquilo, preferiblemente fenilo eventualmente sustituido o alquilo (C_1-C_4) eventualmente sustituido, o

b) se hace reaccionar un sulfonil-carbamato de la fórmula (IV)



(IV)

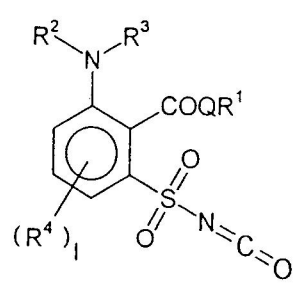
en la que **R***** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, tal como fenilo eventualmente sustituido y alquilo (C_1-C_4) eventualmente sustituido, con un amino-heterociclo de la fórmula (V)



(V)

o

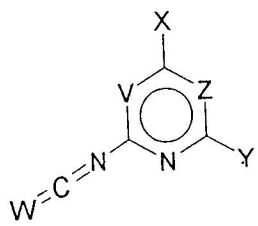
c) se hace reaccionar un sulfonil-isocianato de la fórmula (VI)



(VI)

con un amino-heterociclo de la fórmula (V) o

d) se hace reaccionar una sulfonamida de la fórmula (II) con un (tio)-isocianato de la fórmula (VII)

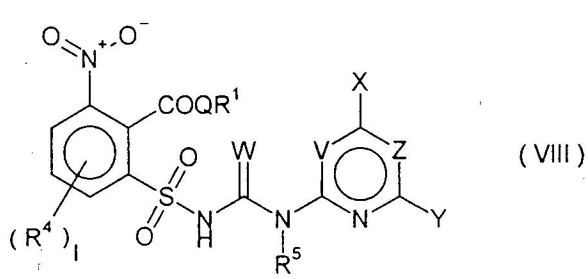


(VII)

en presencia de una base, o

e) se hace reaccionar un amino-heterociclo de la fórmula (V) en primer lugar de un modo catalizado por una base con un éster de ácido carbónico, p.ej. carbonato de difenilo, y el compuesto intermedio formado se hace reaccionar en una reacción de un solo recipiente (sin aislamiento de los productos intermedios) con una sulfonamida de la fórmula (II) (véase la variante a), o

f) se hace reaccionar una fenil-sulfonil-urea de la fórmula (VIII)



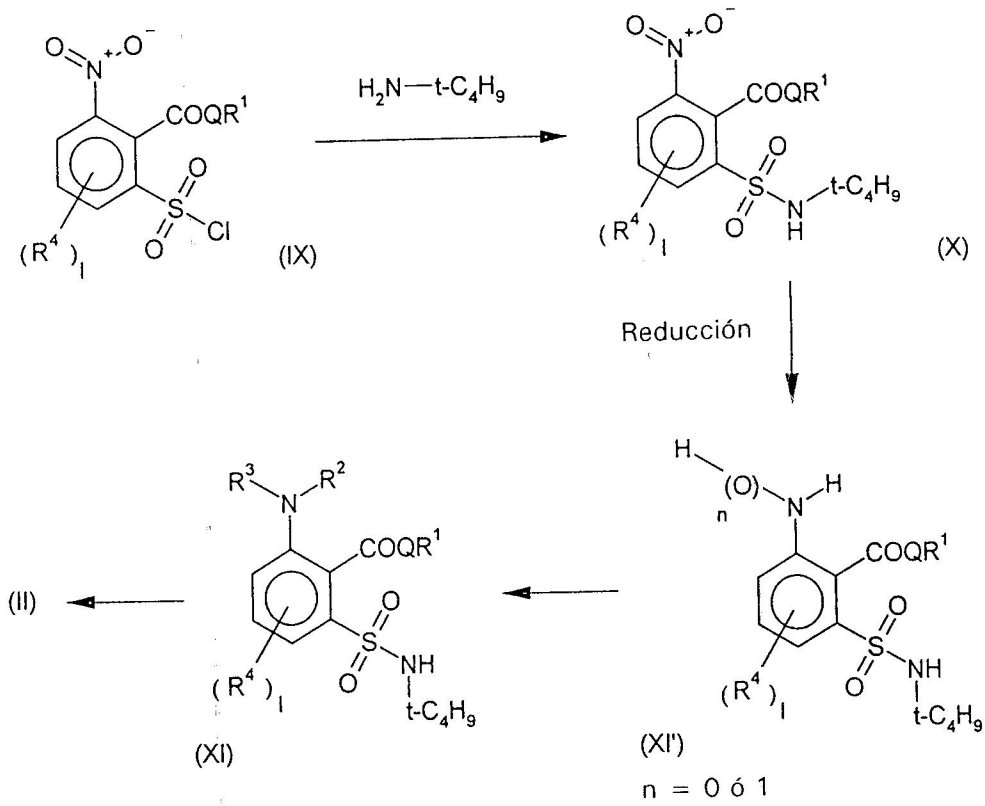
(VIII)

por reducción del grupo nitro, y eventualmente reacción ulterior de la función hidroxil-amino o amino puesta en libertad, para dar una sulfonil-urea de la fórmula (I), estando en las fórmulas (II)-(VIII) los radicales, grupos e índices R^1-R^5, **V**, **W**, **Y**, **Z** y **l** definidos como en la fórmula (I). En las variantes a) hasta c), e) y f) del procedimiento se obtienen en primer lugar compuestos de la fórmula (I) en la que **W** = O.

La reacción de los compuestos de las fórmulas (II) y (II) se efectúa preferiblemente de un modo catalizado por una base en el seno de un disolvente orgánico inerte, tal como p.ej. diclorometano, acetonitrilo, dioxano o THF a temperaturas comprendidas entre 0°C, preferiblemente 20°C, y el punto de ebullición del disolvente. Como base se utilizan en tal casos por ejemplo bases de aminas orgánicas, tales como 1,8-diaza-biciclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), terc.-butóxidos de metales alcalinos, tales como p.ej. NaO-t-C_4H_9, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como p.ej. NaOH, especialmente en el caso de que **R**** sea = fenilo (sustituido) (compárese el documento EP-A-44.807), o trimetil-aluminio o trietil-aluminio, este último especialmente en el caso de que **R**** sea = alquilo (compárese el documento EP-A-166.516). La respectiva base se emplea en tal caso por ejemplo en el margen de 1 a 3 equivalentes molares, referido al compuesto de la fórmula (II).

Las sulfonamidas (II) y los compuestos de las fórmulas (IV) y (VI), afines estructuralmente a ellas así como las fenil-sulfonil-ureas (VIII) son nuevos compuestos. Éstos y su preparación son asimismo objeto de este invento.

Se obtienen los compuestos de la fórmula (II) tal como se muestra en el Esquema 1, por ejemplo partiendo de compuestos de la fórmula (IX)



Esquema 1

El tratamiento de los sulfo-cloruros de la fórmula (IX) con terc.-butil-amina proporciona sulfonamidas de la fórmula (X). Por reducción del grupo nitro en los compuestos de la fórmula (X) se llega a los correspondientes hidroxil-aminas o aminas (XI)', pudiendo la funcionalidad puesta en libertad estar eventualmente derivatizada, p.ej. alquilada. Los compuestos intermedios de la fórmula (XI) así obtenidos se transforman finalmente en los compuestos (II) por tratamiento con un ácido. Los radicales R^1 hasta R^4, Q y l se definen en el Esquema 1 como en la fórmula (I).

La formación de las sulfonamidas se lleva a cabo por ejemplo en el seno de disolventes inertes tales como p.ej. diclorometano, tetrahidrofurano (THF), dioxano, tolueno o dimetil-formamida (DMF) a temperaturas de -70°C hasta del punto de ebullición del disolvente, preferiblemente hasta 25°C. En tal caso pasa a emplearse preferiblemente una cantidad de amina de 1,5-2,5 equivalentes, referida al sulfo-cloruro.

La reducción de la función nitro en (X) para dar aminas o hidroxil-aminas de la fórmula general (XI)' se efectúa análogamente a métodos conocidos (compárense para ello Houben-Weyl, "Methoden der Organischen Chemie", 4ª edición tomo XI/1, páginas 360 y siguientes, editorial Thieme Stuttgart 1957, así como tomo X/1, páginas 1.138 y siguientes, editorial Thieme Stuttgart, 1971). Los compuestos de la fórmula general (XI)' (siendo **n** = 0) se pueden alquilar reductoramente con compuestos carbonílicos (compárense para ello Houben-Weyl, "Methoden der Organischen Chemie", 4ª edición tomo XI/1, páginas 618-643, editorial Thieme Stuttgart 1957; y las citas J. Am. Chem. Soc. 96 (1974) 7.812-7.814; J. Med. Chem. 38 (1995) 3.132-3.137). Por subsiguiente separación de terc.-butilo se consigue de este modo por ejemplo la preparación de anilinas secundarias y terciarias de la fórmula general (II).

La separación del grupo protector terc.-butilo en los compuestos (XI) se efectúa por tratamiento con un ácido fuerte (véase el documento WO 89/10921). Como ácidos fuertes entran en cuestión p.ej. ácidos minerales, tales como H_2SO_4 ó HCl, o bases orgánicas fuertes, tales como ácido trifluoroacético. La reacción se efectúa por ejemplo a temperaturas de -20°C hasta la respectiva temperatura de reflujo de la mezcla de reacción, preferiblemente a 0°C hasta 40°C. La reacción puede llevarse a cabo en sustancia o también en el seno de un disolvente inerte, tal como p.ej. diclorometano o triclorometano.

Para l = 0, Q = O y R^1 = H, Me, Et y alilo los compuestos (IX) son conocidos (véanse los documentos de patente de

los Estados Unidos de América US-4.647.588, US-4.694.020, de patente europea EP-A-197.386 y US-4.603.133). Los nuevos compuestos de la fórmula (IX) conformes al invento se pueden preparar partiendo de ácidos ftálicos sustituidos en el núcleo (para l = 0 por ejemplo a partir de ácido 3-nitro-ftálico comercial), análogamente a métodos conocidos (véase J. Heterocyclic Chem. 23 (1986) 1.253-1.255).

Los carbamatos de la fórmula (III) se pueden preparar de acuerdo con métodos, como se han descrito en las solicitudes de patente surafricanas 82/5671 y 82/5045 o en los documentos EP-A-70.804 (US-A-4.480.101) o RD 275.056.

La reacción de los compuestos (IV) con los amino-heterociclos (V) se lleva a cabo preferiblemente en el seno de disolventes apróticos inertes tales como p.ej. dioxano, acetonitrilo o tetrahidrofurano a temperaturas comprendidas entre 0°C y la temperatura de ebullición del disolvente. Los fenil-sulfonil-carbamatos de las fórmulas (IV) y (XII') se obtienen a partir de compuestos de las fórmulas (II) o (XII) análogamente a los documentos US-A-4.684.393 o US-A-4.743.290. Los materiales de partida (V) necesarios son conocidos por la bibliografía o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos conocidos por la bibliografía (véanse para ello los documentos de patente alemana DE-A-3842621; y las citas de Dudley J.R. y colaboradores J. Am. Chem. Soc. 73 (1951) 1.968-2.990; Braker y colaboradores, J. Am. Chem. Soc. 69 (1947) 3.072, 3.075; Rose y colaboradores J. Chem. Soc. (1946) 81, 84; Huffman, K.R.; Schaefer, F.C. J. Org. Chem. 28 (1963) 1.816-1.821; Gabriel y colaboradores, Chem. Ber. (1899) 2.924).

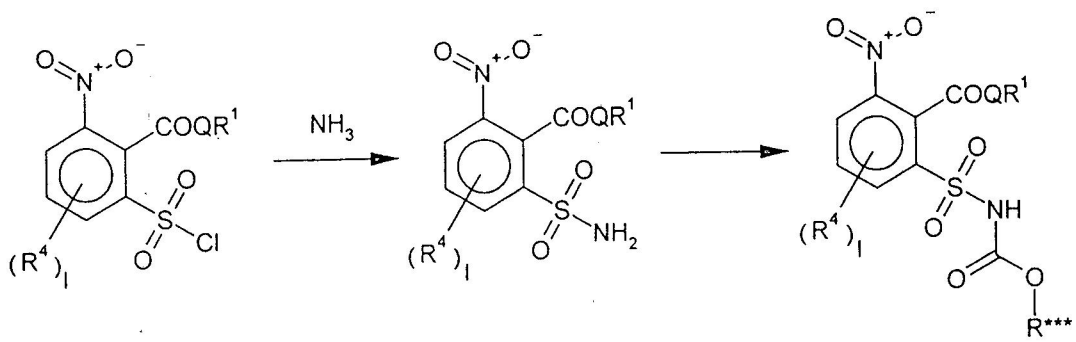
Los fenil-sulfonil-isocianatos de la fórmula (VI) se pueden preparar análogamente a como en el documento US-A-4.481.029 y hacer reaccionar con los amino-heterociclos (V).

Los (tio)-isocianatos de la fórmula (VII) son obtenibles de acuerdo con procedimientos conocidos por la bibliografía (documentos EP-A-232.067, EP-A-166.516). La reacción de los (tio)-isocianatos (VII) con compuestos (II) se efectúa por ejemplo a -10°C hasta 100°C, preferiblemente

a 20°C hasta 100°C, en el seno de un disolvente aprótico inerte, tal como p.ej. acetona o acetonitrilo, en presencia de una base apropiada, p.ej. trietil-amina o carbonato de potasio.

Los productos intermedios de la fórmula (VIII) se pueden preparar por ejemplo orillando el aislamiento de los sulfonil-isocianatos intermedios, directamente a partir de los sulfo-cloruros (IX) y los amino-heterociclos (V) en presencia de un cianato o tiocianato de metal alcalino o amonio y piridina (compárese para ello el documento US-A-5.157.119). Alternativamente a ello, los compuestos (VIII) se pueden obtener también por reacción de una sulfonamida (XII) con carbamatos de la fórmula (III) correspondientemente al procedimiento descrito en el apartado a). Partiendo de sulfonamidas (XII) los productos intermedios de la fórmula (VIII) se pueden preparar también análogamente a los procedimientos descritos en los apartados d) y e). Además de ello, los productos intermedios de la fórmula (VIII) se pueden preparar también a partir de compuestos de la fórmula (X*), siendo **Z**** = NHCOOR***, análogamente al procedimiento descrito en el apartado b).

Las sulfonamidas (XII) se pueden obtener por reacción de los compuestos (IX) con amoníaco (Esquema 2).



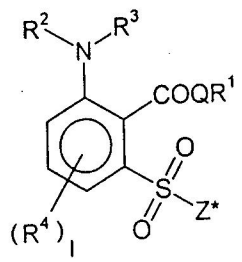
(IX) (XII) (XII')

Esquema 2

La formación de una sulfonamida se lleva a cabo por ejemplo en un medio acuoso o en el seno de disolventes inertes tales como p.ej. el éster etílico de ácido acético, diclorometano, tetrahidrofurano (THF), dioxano, tolueno o dimetil-formamida (DMF) a temperaturas de -70°C hasta del punto de ebullición del disolvente, preferiblemente a 25°C. En tal caso pasa a emplearse preferiblemente una cantidad de amoníaco de 1,5-2,5 equivalentes, referida al sulfo-cloruro.

La reacción de un amino-heterociclo de la fórmula (V) con carbonato de difenilo y una sulfonamida de la fórmula (II) en una reacción de un solo recipiente se puede llevar a cabo de acuerdo con el documento EP-A-562.575.

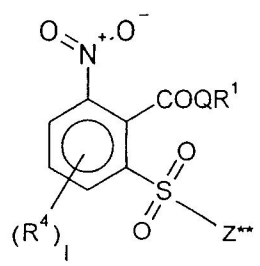
Los mencionados compuestos de las fórmulas (II), (IV), (VI), (XI) y (XI)' son nuevos productos intermedios estructuralmente afines de la fórmula general (II*)



(II*)

en la que **Z*** significa = NH_2, NHCOOR***, NCO ó NH-terc.-butilo, y R^1-R^4, l y Q están definidos como en la fórmula (I) y **R***** está definido como en la fórmula (IV).

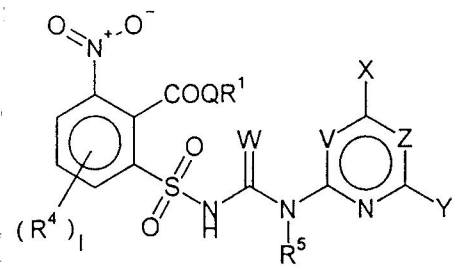
Los mencionados compuestos de las fórmulas (IX), (X), (XII) y (XII') son nuevos productos intermedios afines estructuralmente de la fórmula general (X*)



(X*)

en la que **Z**** significa = NH_2, NHCOOR***, NH-terc.-butilo o Cl y R^1, R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) y **R***** está definido como en la fórmula (IV), y estando excluidos los compuestos, en los cuales **Z**** es = Cl, **l** = 0, **Q** = O y R^1 = H, metilo, etilo o alilo.

Son asimismo nuevos los productos intermedios de la fórmula general (VIII)



(VIII)

en la que R^1, R^4, R^5, **Q**, **V**, **W**, **X**, **Y**, **Z** y **l** están definidos como en la fórmula (I).

Las sales de los compuestos de la fórmula (I) se preparan preferiblemente en el seno de disolventes polares inertes tales como p.ej. agua, metanol o acetona a temperaturas de 0°C a 100°C. Bases apropiadas para la preparación de las sales conformes al invento son por ejemplo carbonatos de metales alcalino, tales como carbonato de potasio, hidróxidos de metales alcalinos y alcalino-térreos, p.ej. NaOH ó KOH, o alcoholatos de metales alcalinos, tales como metanolato de sodio o terc.-butanolato de sodio, o amoníaco o etanol-amina.

Con los "disolventes inertes" que se señalan en las precedentes variantes del procedimiento se piensa en cada caso en los disolventes que son inertes en las respectivas condiciones de reacción, pero no deben de ser inertes en cualesquiera condiciones de reacción.

Colecciones de compuestos de la fórmula (I) y sus sales, que se pueden sintetizar de acuerdo con los esquemas antes mencionados, se pueden preparar también de una manera paralelizada, pudiendo efectuarse esto de un modo manual, parcialmente automático o totalmente automático. En tal caso

es por ejemplo posible automatizar la realización de la reacción, el tratamiento o la purificación de los productos o compuestos intermedios. En conjunto, se entiende por tal procedimiento un modo de proceder tal como ha sido descrito por ejemplo por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", tomo 1, Editorial Escom 1997, páginas 69 a 77.

Para la realización paralelizada de la reacción y el tratamiento se pueden utilizar una serie de aparatos obtenibles en el comercio, tal como son ofrecidos por ejemplo por las entidades Stem Corporation, Woodrolfe road, Tollesbury, Essex, Inglaterra, H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764, Oberschleißheim, Alemania, o la entidad Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB - II:3AZ, Inglaterra. Para la purificación paralelizada de compuestos de la fórmula general (I) y de sus sales o de productos intermedios que resultan durante la preparación están a disposición, entre otros, equipos de cromatografía, por ejemplo de la entidad ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

Los equipos mencionados conducen a un modo de proceder modular, en el que son automáticas las etapas de trabajo individuales pero entre las etapas de trabajo se deben llevar a cabo operaciones manuales. Esto puede ser orillado mediante el empleo de sistemas de automatización integrados parcial o totalmente, en los que los respectivos módulos de automatización se pueden manipular por ejemplo mediante autómatas (robots). Tales sistemas de automatización se pueden adquirir por ejemplo de la entidad Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

Junto con los métodos aquí descritos, la preparación de compuestos de la fórmula general (I) y sus sales puede efectuarse mediante métodos apoyados total o parcialmente en fases sólidas. Para esta finalidad, compuestos intermedios individuales o todos los compuestos intermedios de la síntesis o de una síntesis adaptada al correspondiente modo de proceder son fijados a una resina para la síntesis. Los

métodos de síntesis apoyados en fases sólidos han sido descritos suficientemente en la bibliografía especializada, p.ej. Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", editorial Academic Press, 1998.

La utilización de métodos de síntesis apoyados en fases sólidas permite una serie de protocolos conocidos de la bibliografía, que a su vez se pueden realizar de un modo manual o automático. Por ejemplo, "el método de la bolsa de té" (véanse Houghten, documento US 4.631.211; Houghten y colaboradores, Proc. Natl. Acad. Sci. 1985, 82, 5.131-5.136) se puede automatizar parcialmente con productos de la entidad IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU. La automatización de síntesis paralelas apoyadas en fases sólidas se consigue por ejemplo con equipos de las entidades Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

La preparación según los procedimientos aquí descritos proporciona compuestos de la fórmula (I) y sus sales en forma de colecciones de sustancias, que se denominan bibliotecas. Son objeto del presente invento también las bibliotecas que contienen por lo menos dos compuestos de la fórmula (I) y sus sales.

Los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento y sus sales, designados en lo sucesivo en común como compuestos de la fórmula (I) (conformes al invento) presentan una actividad herbicida excelente contra un amplio espectro de plantas dañinas mono- y di-cotiledóneas económicamente importantes. También están perfectamente abarcadas por las sustancias activas las malezas perennes difícilmente combatibles, que brotan a partir de rizomas, cepellones de raíces y otros órganos permanentes. En tal caso es indiferente que las sustancias sean esparcidas según los procedimientos de antes de la siembra, antes del brote o después del brote. En particular, se mencionarán a modo de ejemplo algunos representantes de la flora de malezas mono- y dicotiledóneas, que se pueden reprimir mediante los compuestos

conformes al invento, sin que por la mención tenga que efectuarse ninguna limitación a tipos determinados. Por el lado de las especies de malezas monocotiledóneas se abarcan bien p.ej. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria así como especies de Cyperus del grupo de las anuales y por el lado de las especies perennes Agropyron, Cynodon, Imperata así como Sorghum y también especies de Cyperus permanentes. En el caso de especies de malezas dicotiledóneas el espectro de efectos se extiende a tipos tales como p.ej. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon y Sida por el lado de las anuales así como Convolvulus, Cirsium, Rumex y Artemisia en el caso de las malezas perennes.

Las plantas dañinas que se presentan en las condiciones específicas de cultivo en el arroz, tales como p.ej. Echinochloa, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus y Cyperus, son también sobresalientemente combatidas por las sustancias activas conformes al invento. Si los compuestos conformes al invento son aplicados sobre la superficie del terreno antes de la germinación, o bien se impide totalmente el brote de las plantículas de malezas o las malezas crecen hasta llegar al estadio de los cotiledones, pero entonces cesan en su crecimiento y finalmente mueren en su totalidad después de haber trascurrido de tres a cuatro semanas.

En el caso de la aplicación de las sustancias activas sobre las partes verdes de las plantas según el procedimiento de después del brote aparece también con mucha rapidez después del tratamiento una drástica detención del crecimiento y las plantas de malezas permanecen en el estadio de crecimiento que se presentaba en el momento de la aplicación o mueren totalmente después de un cierto tiempo, por lo que de esta manera se elimina muy temprana y persistentemente una competencia por malezas qaue es perjudicial para las plantas cultivadas.

Aun cuando los compuestos conformes al invento presentan una excelente actividad herbicida frente a malezas mono- y di-cotiledóneas, las plantas cultivadas de cultivos

económicamente importantes, p.ej. cultivos de plantas dicotiledóneas tales como soja, algodón, colza, remolacha azucarera, especialmente soja, o cultivos de gramíneas tales como trigo, cebada, centeno, arroz o maíz, son dañadas sólo insignificantemente o nada en absoluto. Los presentes compuestos se adecuan por estas razones muy bien para la represión selectiva del crecimiento indeseado de las plantas en plantaciones útiles agrícolas o en plantaciones ornamentales.

Además de ello, las sustancias conformes al invento presentan sobresalientes propiedades reguladoras del crecimiento en el caso de plantas cultivadas. Intervienen regulando en el metabolismo propio de las plantas y con ello se pueden emplear para el influenciamiento planeado sobre sustancias constitutivas de las plantas y para facilitar las cosechas tal como p.ej. por provocación de desecación y sofocamiento del crecimiento. Además, se adecuan también para el control y la inhibición generales de un crecimiento vegetativo indeseado, sin aniquilar con ello a las plantas. Una inhibición del crecimiento vegetativo desempeña un gran papel en muchos cultivos de plantas mono- y di-cotiledóneas, puesto que con ello se puede disminuir o impedir totalmente el tumbamiento. Por causa de sus propiedades herbicidas y reguladoras del crecimiento de las plantas, las sustancias activas se pueden emplear también para combatir plantas dañinas en cultivos de plantas modificadas por tecnología genética conocidas o que todavía se hayan de desarrollar. Las plantas transgénicas se distinguen por regla general por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por resistencias frente a determinados plaguicidas, sobre todo determinados herbicidas, por resistencias frente a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas tales como determinados insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales conciernen p.ej. al material cosechado en lo referente a la cantidad, la calidad, la capacidad de almacenamiento, la composición y las sustancias constituti-

vas especiales. Así, se conocen plantas transgénicas con un contenido aumentado de almidón o una calidad modificada del almidón, o las que poseen una composición de ácidos grasos distinta de la del material cosechado.

Se prefiere la aplicación de los compuestos conformes al invento de la fórmula (I) o sus sales en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisantes y otras especies de legumbres.

Preferiblemente, los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear como herbicidas en cultivos de plantas útiles, que son resistentes, o han sido hechos resistentes por tecnología genética, frente a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

Las vías habituales para la producción de nuevas plantas, que tienen propiedades modificadas en comparación con las plantas hasta ahora existentes, consisten por ejemplo en procedimientos de cultivación clásicos y en la producción de mutantes. Alternativamente, se pueden producir nuevas plantas con propiedades mejoradas con ayuda de procedimientos de tecnología genética (véanse p.ej. los documentos EP-A-221044 y EP-A-0131624). Se describieron por ejemplo en varios casos

- alteraciones por tecnología genética de plantas cultivadas para la modificación del almidón sintetizado en las plantas (véanse p.ej. los documentos WO 92/11376, WO 92/14827 y WO 91/19806),
- plantas cultivadas transgénicas, que son resistentes frente a determinados herbicidas del tipo de glufosinato (compárese p.ej. los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o glifosato (documento WO 92/00377) o de las sulfonil-ureas (documentos EP-A-0257993, US-A-5013659),
- plantas cultivadas transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de Bacillus thuringiensis (Bt-toxinas), que hacen a las plantas

resistentes frentes a determinadas plagas (documentos EP-A 0142924 y EP-A 0193259).

- plantas cultivadas transgénicas con una composición modificada de ácidos grasos (WO 91/13972).

Numerosas técnicas de biología molecular, con las cuales se pueden producir nuevas plantas transgénicas con propiedades mejoradas, son conocidas en principio (véanse p.ej. las obras de Sambrook y colaboradores, 1989, Molecular Clonig, A Laboratory Manual (un manual de laboratorio), 2ª edición, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; de Winnacker "Gene und Klone" (genes y clones), VCH Weinheim 2ª edición 1996; o de Christou, "Trends in Plant Science" (tendencias en la ciencia de los vegetales), 1 (1996) 423-431).

Para tales manipulaciones por tecnología genética se pueden incorporar en plásmidos moléculas de ácidos nucleicos, que permiten una mutagénesis o una modificación de las secuencias por recombinación de secuencias de ADN. Con ayuda de los procedimientos clásicos antes mencionados, se pueden llevar a cabo p.ej. intercambios entre bases, se pueden eliminar secuencias parciales o se pueden agregar secuencias naturales o sintéticas. Para la unión de los fragmentos de ADN unos con otros se pueden adosar a los fragmentos adaptadores o enlazadores.

La producción de células de plantas con una actividad disminuida de un producto de gen se puede conseguir por ejemplo mediante la expresión de un correspondiente ARN antisentido, de un ARN del mismo sentido para conseguir un efecto de supresión conjunta o la expresión de por lo menos una ribozima correspondientemente construida, que disocia específicamente a transcritos del producto de gen antes mencionado.

Para ello se pueden utilizar por una parte moléculas de ADN que abarcan la secuencia codificadora total de un producto de gen inclusive secuencias flanqueadoras eventualmente presentes, así como también moléculas de ADN, que abarcan solamente partes de la secuencia codificadora,

debiendo estas partes ser lo suficientemente largas como para producir en las células un efecto antisentido. Es posible también la utilización de secuencias de ADN, que presentan un alto grado de homología con las secuencias codificadoras de un producto de gen, pero no son totalmente idénticas a ellas.

En el caso de la expresión de moléculas de ácidos nucleicos en plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimiento deseado de la célula vegetal. No obstante, con el fin de conseguir la localización en un determinado compartimiento, p.ej. la región codificadora puede ser unida con secuencias de ADN que garanticen la localización en un determinado compartimiento. Tales secuencias son conocidas por un experto en la materia (véanse por ejemplo las citas de Braun y colaboradores, EMBO J. 11 (1992), 3.219-3.227; Wolter y colaboradores, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988) 856-850; Sonnewald y colaboradores, Plant J. 1 (1991), 95-106).

Las células de plantas transgénicas pueden ser regeneradas de acuerdo con técnicas conocidas para dar plantas enteras. En el caso de las plantas transgénicas puede tratarse en principio de plantas de cualquier especie deseada de plantas, es decir de plantas tanto monocotiledóneas como también dicotiledóneas.

Así son obtenibles plantas transgénicas, que presentan propiedades alteradas mediante sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias de genes homólogos (= naturales) o expresión de genes o secuencias de genes heterólogos (= ajenos).

Preferiblemente, los compuestos (I) conformes al invento se pueden haber empleado en cultivos transgénicos, que son resistentes frente a herbicidas tomados entre el grupo de las sulfonil-ureas, glufosinato-amonio y glifosato-isopropilamonio y sustancias activas análogas.

En el caso de la aplicación de las sustancias conformes al invento en cultivos transgénicos, junto a los efectos contra plantas dañinas que se pueden observar en otros

cultivos, aparecen con frecuencia efectos, que son específicos para la aplicación en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplo un espectro modificado o especialmente ampliado de malezas que se pueden combatir, cantidades consumidas modificadas, que se pueden emplear para la aplicación, preferiblemente una buena combinabilidad con los herbicidas, frente a los cuales es resistente el cultivo transgénico, así como el influenciamiento sobre el crecimiento y el rendimiento de las plantas cultivadas transgénicas.

Es por lo tanto objeto del invento también la utilización de los compuestos (I) conformes al invento como herbicidas para combatir plantas dañinas en plantas cultivadas transgénicas.

Los compuestos conformes al invento se pueden aplicar en forma de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, soluciones atomizables, agentes para espolvorear o granulados en los preparados usuales. Por lo tanto, son objeto del invento también agentes herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas, que contienen compuestos de la fórmula (I).

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden formular de modos diferentes, dependiendo de qué parámetros biológicos y/o químicos-físicos estén preestablecidos. Como posibilidades de formulación entran en cuestión por ejemplo: polvos para proyectar (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones del tipo de aceite en agua y del tipo de agua en aceite, soluciones atomizables, concentrados para suspensión (SC), dispersiones a base de aceites o de agua, soluciones miscibles con aceites, suspensiones para encapsular (CS), agentes para espolvorear (DP), agentes desinfectantes, granulados para la aplicación por esparcimiento y sobre el suelo, granulados (GR) en forma de microgranulados, granulados por atomización, extensión y adsorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV (de volumen ultra-bajo), microcápsulas y ceras. Estos tipos

individuales de formulaciones son conocidos en principio y se describen por ejemplo en las obras de: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo 7, editorial C. Hauser München, 4ª edición, 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations" (formulaciones plaguicidas), Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook (manual del secado por atomización) 3ª edición, 1979, G. Goodwin Ltd., Londres.

Los agentes coadyuvantes de formulaciones tales como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y otros materiales aditivos son asimismo conocidos y se describen por ejemplo en las obras de: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" (manual de diluyentes y vehículos para polvos insecticidas), 2ª edición, Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry" (introducción a la química de los coloides de arcillas), 2ª edición J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide" (guía de disolventes), 2ª edición, Interscience, N. Y. 1963; "Detergents and Emulsifiers Annual" (anual de los detergentes y emulsionantes) de McCutcheon, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents" (enciclopedia de agentes tensioactivos), Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" (aductos con óxido de etileno interfacialmente activos), Wiss. Verlagsgesell. Stuttgart, 1976; Winnacker-Küchler; "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo 7, editorial C. Hauser München, 4ª edición, 1986.

Sobre la base de estas formulaciones se pueden producir también combinaciones con otras sustancias activas como plaguicidas, tales como p.ej. insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con antídotos, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, p.ej. en forma de una formulación acabada o como una mezcla de depósito (*Tankmix*).

Los polvos para proyectar son unos preparados uniformemente dispersables en agua, los cuales junto con la sustancia activa, aparte de un material diluyente o inerte,

contienen también agentes tensioactivos de tipos iónicos y/o no iónicos (agentes humectantes, agentes dispersantes), p.ej. alquil-fenoles poli(oxietilados), alcoholes grasos poli(oxietilados), aminas grasas poli(oxietiladas), (alcohol graso)-poliglicol-éter-sulfatos, alcano-sulfonatos, alquil-benceno-sulfonatos, sales de sodio de ácido lignina-sulfónico, sales de sodio de ácido 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfónico, sales de sodio de ácido dibutilnaftaleno-sulfónico o también sales de sodio de ácido oleoil-metil-táurico. Para la producción de los polvos para proyectar, las sustancias activas herbicidas se muelen finamente, por ejemplo en instalaciones usuales, tales como las de molinos de martillos, molinos de soplantes y molinos de chorros de aire y se mezclan simultáneamente o a continuación con los agentes coadyuvantes de formulaciones.

Los concentrados emulsionables se preparan por disolución de la sustancia activa en un disolvente orgánico, p.ej. butanol, ciclohexanona, dimetil-formamida, xileno o también compuestos aromáticos o hidrocarburos de elevado punto de ebullición, o mezclas de tales disolventes orgánicos, mediando adición de uno o varios agentes tensioactivos de tipos iónicos y/o no iónicos (emulsionantes). Como emulsionantes se pueden utilizar por ejemplo: sales de calcio de ácidos alquil-aril-sulfónicos tales como dodecil-benceno-sulfonato de calcio o emulsionantes no iónicos tales como ésteres poliglicólicos de ácidos grasos, alquil-aril-poliglicol-éteres, (alcoholes grasos)-poliglicol-éteres, productos de condensación de óxido de propileno y óxido de etileno, alquil-poliéteres, ésteres de sorbitán tales como p.ej. ésteres de ácidos grasos de sorbitán, poli(oxietilen)-ésteres de sorbitán tales como p.ej. poli(oxietilen)-ésteres de ácidos grasos de sorbitan.

Se obtienen agentes para espolvorear mediante molienda de la sustancia activa con materiales sólidos finamente divididos, p.ej. talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierra de diatomeas.

Los concentrados para suspensión pueden estar

constituidos a base de agua o de aceites. Se pueden preparar por ejemplo por molienda en húmedo mediante molinos de perlas usuales en el comercio y adición eventualmente de agentes tensioactivos tales como ya se han expuesto anteriormente en los casos de los otros tipos de formulaciones.

Las emulsiones, p.ej. las emulsiones del tipo de aceite en agua (EW), se pueden preparar por ejemplo mediante agitadores, molinos de coloides y/o mezcladores estáticos mediando utilización de disolventes orgánicos acuosos y eventualmente de agentes tensioactivos, tal como ya se han señalado p.ej. anteriormente en los casos de los otros tipos de formulaciones. Los granulados se pueden preparar o bien por inyección de la sustancia activa sobre un material inerte granulado, capaz de adsorción, o por aplicación de concentrados de sustancias activas mediante pegamentos, p.ej. un poli(alcohol vinílico), un poli(acrilato de sodio) o también aceites minerales, sobre la superficie de materiales de soporte tales como arena, caolinitas o de un material inerte granulado. También se pueden granular sustancias activas apropiadas del modo que es usual para la preparación de granallas de fertilizantes - en caso deseado en mezclas con agentes fertilizantes -.

Los granulados dispersables en agua se preparan por regla general de acuerdo con los procedimientos usuales tales como secado por atomización, granulación en lecho fluidizado, granulación en bandejas, mezcladura con mezcladores de alta velocidad y extrusión sin ningún material inerte sólido.

Para la producción de granulados en bandejas, en lecho fluidizado, en extrusores y por atomización, véanse, p.ej. los procedimientos que aparecen en las obras "Spray-Drying Handbook" (manual del secado por atomización), 3ª edición 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration" (aglomeración), Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook" (manual del ingeniero químico de Perry), 5ª edición, McGraw-Hill, Nueva York 1973, páginas 8-57.

Para más detalles acerca de la formulación de agentes fitoprotectores véase por ejemplo la obra de G.C. Klingman, "Weed Control as a Science" (la represión de malezas como una ciencia), John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook" (manual de la represión de malezas), 5ª edición, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

Los preparados agroquímicos contienen por regla general de 0,1 a 99 % en peso, especialmente de 0,1 a 95 % en peso, de una sustancia activa de la fórmula (I).

En polvos para proyectar, la concentración de la sustancia activa asciende p.ej. a aproximadamente 10 a 90 % en peso, el resto hasta 100 % en peso consta de constituyentes usuales de formulaciones. En el caso de concentrados emulsionables, la concentración de la sustancia activa puede ascender aproximadamente a 1 hasta 90, preferiblemente a 5 hasta 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvos finos contienen de 1 a 30 % en peso de la sustancia activa, preferiblemente en la mayor parte de los casos de 5 a 20 % en peso de la sustancia activa, las soluciones atomizables contienen aproximadamente de 0,05 a 80, preferiblemente de 2 a 50 % en peso de la sustancia activa. En el caso de granulados dispersables en agua, el contenido de la sustancia activa depende en parte de que el compuesto activo se presente en estado líquido o sólido y de cuáles agentes coadyuvantes de granulación, materiales de carga, etc., se utilicen. En el caso de los granulados dispersables en agua, el contenido de sustancia activa está situado por ejemplo entre 1 y 95 % en peso, preferiblemente entre 10 y 80 % en peso.

Junto a ello, las mencionadas formulaciones de sustancias activas contienen eventualmente los agentes adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, protectores frente a las heladas y disolventes, materiales de carga, de vehículo, de soporte y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación y agentes

que influyen sobre el valor del pH y sobre la viscosidad, en cada caso usuales.

Como partícipes en las combinaciones para las sustancias activas conformes al invento en formulaciones de mezclas o en una mezcla de depósito se pueden emplear por ejemplo sustancias activas conocidas, que se basan en una inhibición, por ejemplo, de la acetolactato-sintasa, la acetil-CoA-carboxilasa, la celulosa-sintasa, la enolpiruvil-shikimato-3-fosfato-sintasa, la glutamina-sintetasa, la p-hidroxifenil-piruvato-dioxigenasa, fito-endesaturasa, el fotosistema I, el fotosistema II, la protoporfirinógeno-oxidasa, tal como se describen p.ej. en las citas de Weed Research 26 (1986), 441-445 o "The Pesticide Manual", 11ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry 1997, y la bibliografía allí mencionada. Como agentes herbicidas conocidos, que se pueden combinar con los compuestos de la fórmula (I), han de mencionarse p.ej. las siguientes sustancias activas (observación: los compuestos son designados o bien con el "nombre común" de acuerdo con la International Organization for Standardization (ISO) o con el nombre químico, eventualmente junto con un número de código usual):

acetocloro; acifluorfeno (-sodio); aclonifeno; AKH 7088, es decir ácido [[[1-[5-[2-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-nitro-fenil]-2-metoxi-etiliden]-amino]-oxi]-acético y su éster metílico; alacloro, alloxidim (-sodio); ametrin, amicarbazona; amidosulfurón; amitrol; AMS, es decir sulfamato de amonio; anilofos; asulam; atrazina; azafenidina; azimsulfuron; aziprotrin; barbán; BAS 516 H, es decir 5-fluoro-2-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona; beflubutamida; benazolin(-etilo); benfluralina; benfuresato; bensulfurón-(-metilo); bensulida; bentazona; benzobiciclón; benzofenap; benzofluoro; benzoilprop(-etilo); benzotiazurón; bialafos; bifenox; bispiribaco(-sodio); bromacilo; bromobutida; bromofenoxim; bromoxinilo; bromurón; buminafos; busoxinona; butacloro; butafenacilo; butamifos; butenacloro; butidazol; butralina; butroxidim; butilate; cafenstrole; caloxidim,

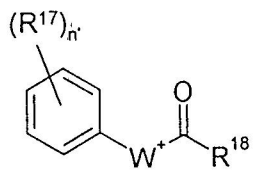
carbetamida; carfentrazona(-etilo); CDAA; es decir 2-cloro-N,N-di-2-propenil-acetamida; CDEC, es decir éster 2-cloro-alílico de ácido dietil-ditiocarbámico; clometoxifeno; clorambeno; clorazifop-butilo; clorbromurón; clorbufam; clorfenaco; clorflurecol-metilo; cloridazona; clorimuron-(-etilo); clormesulam (ICI-A0051); clornitrofeno; clortolurón; cloroxurón; clorprofam; clorsulfurón; clortal(-dimetilo); clortiamida; cinidón(-etilo y -metilo); cinmetilina; cinosulfurón; clefoxidim; cletodim; clodinafop y sus derivados ésteres (p.ej. clodinafop-propargilo); clomazona; clomeprop; cloproxidim; clopiralida; clopirasulfurón(-metilo); cloransulam(-metilo); cumilurón; cianazina; cicloato; ciclosulfamurón; cicloxidim; ciclurón; cihalofop y sus derivados ésteres (p.ej. cihalofop-butilo); ciperquat; ciprazina; ciprazol; daimurón; 2,4-D; 2,4-DB; dalapón; desmedifam; desmetrin; di-allato; dicamba; diclobenilo; diclorprop; diclofop y sus ésteres tales como diclofop-metilo; diclosulam, es decir N-(2,6-dicloro-fenil)-5-etoxi-7-fluoro-[1,2,4]triazolo][1,5-c]pirimidin-2-sulfonamida , dietatil(-etilo); difenoxurón; difenzoquat; diflufenicán, diflufenzopir(-sodio); dimefurón; dimepiperato; dimetacloro; dimetametrin; dimetenamida; dimidazona; dimetipin; dinitramina; dinoseb; dinoterb; difenamida; dipropetrin; diquat; ditiopir; diurón; DNOC; eglinacina-etilo; EL 77, es decir 5-ciano-1-(1,1-dimetil-etil)-N-metil-1H-pirazol-4-carboxamida; endotal; EPTC; esprocarb; etalfluralina; etametsulfurón(-metilo); etidimurón; etiozina; etofumesato; etoxifeno y sus ésteres (p.ej. el éster etílico, HN-252); etoxisulfurón; etobenzanida; F5231, es decir N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoro-propil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]-fenil]-etano-sulfonamida; fenoprop; fenoxano, fenoxaprop y fenoxaprop-P así como sus ésteres, p.ej. fenoxaprop-P-etilo y fenoxaprop-etilo; fenoxidim, fentrazamida; fenurón; flamprop(-metilo o -isopropilo o -isopropilo-L); flazasulfurón; florasulam; fluazifop y fluazifop-P y sus ésteres (p.ej. fluazifop-butilo y fluazifop-P-butilo); fluazolato(-isopropazol); flucarbazona(-sodio); fluclorali-

na; flufenacet; flumetsulam; flumeturón; flumicloraco y sus ésteres (p.ej. flumicloraco-pentilo); flumioxazina; flumipropin; fluometurón; flupoxam (KNW-739); fluorodifeno; fluoroglicofeno(-etilo); flupropacilo; flupirsulfurón(-metilo, -sodio); flurenol(-butilo); fluridona; fluroclo-ridona; fluroxipir(-meptilo); flurtamona; flutiazet(-metilo); flutiamida; fomesafeno; foramsulfurón; fosamina, furiloxifeno; glufosinato(-amonio); glifosato(-isopropilamo-nio); halosafeno; halosulfuron(-metilo); haloxifop y sus ésteres; haloxifop-P (= R-haloxifop) y sus ésteres; hexazi-nona; imazametabenz; imazamox; imazapic; imazapir; imazaquin(-amonio); imazetametapir; imazetapir; imazosulfu-rón; indanofano; yodosulfurón; ioxinilo; isocarbamida; isopropalina; isoproturón; isourón; isoxabeno; isoxaclorto-le; isoxaflutole; isoxapirifop; karbutilato; lactofeno; lenacilo; linurón; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidida; mesotriona; metamitrón; metazacloro; metabenztiazuron; metam; metazol; metoxifenona; metildimron; metobenzurón; metobromurón; (alfa-)metolacloro; metosulam; metoxurón; metribuzina; metsulfurón(-metilo); MH; molinato; monalida; monocarbamida-dihidrógenosulfato; monolinurón; monurón; MT128, es decir 6-cloro-N-(3-cloro-2-propenil)-5-metil-N-fenil-3-piridazinamina; MT 5950, es decir N-[3-cloro-4-(1-metil-etil)-fenil]-2-metil-pentanamida; naproanilida; napropamida; naptalam; NC310, es decir 4-(2,4-dicloro-benzoil)-1-metil-5-benciloxi-pirazol; neburón; nicosulfurón, nipiraclofeno; nitralina; nitrofeno; nitrofluorfeno; norflu-razona; orbencarb; orizalina; oxaciclomefona; oxadiargilo; oxadiazona; oxasulfurón; oxifluorfeno; paraquat; pebulato; ácido pelargónico; pendimetalina; pentoxazona; perfluidona; fenisofam; fenmedifam; picloram; picolinafeno; piperofos; piributicarb; pirifenop(-butilo); pretilacloro; primisulfuron(-metilo); procarbazona(-sodio); prociazina; prodiamina; profluralina; proglinazina(-etilo); prometón; prometrin; propacloro; propanilo; propaquizafop y sus ésteres; propazina; profam; propisocloro; propizamida; prosulfalina; prosulfocarb; prosulfurón; prinacloro;

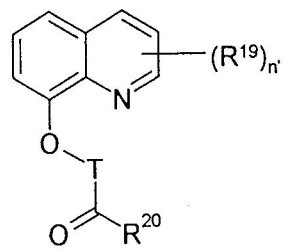
piroflufeno(-etilo); pirazolinato; pirazona; pirazosulfuron(-etilo); pirazoxifeno; piribenzoxima; piributicarb; piridafol; piridato; piriminobaco(-metilo); piritiobaco(-sodio); piroxofop y sus ésteres (p.ej. pirofop-propargilo); quincloraco; quinmeraco; quinofop y sus derivados ésteres; quinoclamina; quizalofop y quizalofop-P y sus derivados ésteres (p.ej. quizalofop-etilo; quizalofop-p-tefurilo y -etilo); renridurón; rimsulfurón; S 275, es decir 2-[4-cloro-2-fluoro-5-(2-propiniloxi)-fenil]-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol; secbumetona; setoxidim; sidurón; simazina; simetrin; SN 106279, es decir ácido 2-[[7-[2-cloro-4-(trifluoro-metil)-fenoxi]-2-naftalenil]-oxi]-propanoico y su éster metílico; sulcotriona; sulfentrazona; sulfazurona; sulfometurón(-metilo); sulfosato (ICI-A0224); sulfosulfurón; TCA(-sodio); tebutam; tebutiurón; tepraloxidim; terbacilo; terbucarb; terbucloro; terbumeton; terbutilazina; terbutrin; TFH 450, es decir N,N-dietil-3-[(2-etil-6-metil-fenil)-sulfonil]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamida ; tenilcloro; tiafluamida; tiazaflurón; tiazopir; tidiazimina (SN-24085); tifensulfurón(-metilo); tiobencarb; tiocarbazilo; tralcoxidim; tri-allato; triasulfurón; triaziflam; triazofenamida; tribenurón(-metilo); triclopir; tridifano; trietazina; trifluralina; triflusulfurón(-metilo); tritosulfurón; trimeturón; tsitodef; vernolato; WL 110547, es decir 5-fenoxi-1-[3-(trifluorometil)-fenil]-1H-tetrazol; AMS-13668; D-489; BH-60229; BH-71712; DK-8910; DOWCO-535; DPX-N8189; JTC-101; KH-218; KPP-300; KPP-421; LS 82-556; MBH-001; MT-146; MT-147; NC-324; NC-330; OK-9403; OK-9604; OK-9701; PP-600; SC-0774 y UBH-509.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden emplear también en combinación con uno o varios de los compuestos que actúan como antídotos. Ejemplos de los antídotos son:

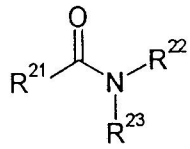
a) Compuestos de las fórmulas (XIII) hasta (XV),



(XIII)



(XIV)



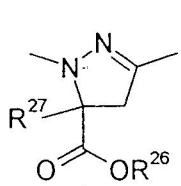
(XV)

teniendo los símbolos e índices los siguientes significados:

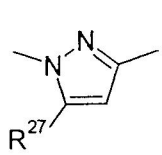
n' es un número natural de 0 a 5, con preferencia de 0 a 3;

T es una cadena de alcanodiílo (C_1 ó C_2), que está sin sustituir o sustituida con uno o dos radicales alquilo (C_1-C_4) o con [alcoxi (C_1-C_3)]carbonilo;

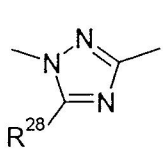
W^+ es un radical heterocíclico divalente sin sustituir o sustituido tomado entre el grupo de los heterociclos con anillo de cinco miembros, parcialmente insaturados o aromáticos, con 1 a 3 heteroátomos de anillo del tipo de N u O, estando contenido en el anillo por lo menos un átomo de N y a lo sumo un átomo de O, preferiblemente un radical tomado entre el grupo formado por (W^+1) hasta (W^+4),



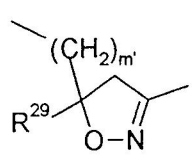
W^+1



W^+2



W^+3



W^+4

m' es 0 ó 1;

R^{17}, R^{19} son, iguales o diferentes, hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), nitro o halo-alquilo (C_1-C_4);

R^{18}, R^{20} son, iguales o diferentes, OR^{24}, SR^{24} ó $NR^{24}R^{25}$ o un heterociclo de 3 a 7 miembros saturado o insaturado que tiene por lo menos un átomo de N y hasta llegar a 3 heteroátomos, preferiblemente tomados entre el grupo formado por O y S, que está unido a través del átomo de N con el grupo carbonilo existente en (XIII) o (XIV) y está sin sustituir o sustituido con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o fenilo eventualmente sustituido, preferiblemente un radical de las fórmulas OR^{24}, NHR^{25} ó $N(CH_3)_2$, en particular de la fórmula OR^{24};

R^{24} es hidrógeno o un radical hidrocarbilo alifático sin sustituir o sustituido, que tiene preferiblemente en total de 1 a 18 átomos de C;

R^{25} es hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6) o fenilo sustituido o sin sustituir;

R^{26} es hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), halo-alquilo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), hidroxi-alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_{12}) o tri-alquil (C_1-C_4)-sililo;

R^{27}, R^{28} y R^{29} son, iguales o diferentes, hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), halo-alquilo (C_1-C_8), cicloalquilo (C_3-C_{12}) o fenilo sustituido o sin sustituir;

R^{21} es alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_4), halo-alquenilo (C_2-C_4), cicloalquilo (C_3-C_7), preferiblemente diclorometilo;

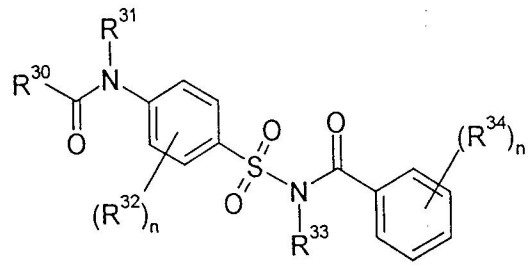
R^{22}, R^{23} son, iguales o diferentes, hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_4), alquinilo (C_2-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), halo-alquenilo (C_2-C_4), alquil (C_1-C_4)-carbamoil-alquilo (C_1-C_4), alquenil (C_2-C_4)-carbamoil-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), dioxolanil-alquilo (C_1-C_4), tiazolilo, furilo, furil-alquilo, tienilo, piperidilo, fenilo sustituido o sin sustituir, o R^{22} y R^{23} forman en común un anillo

heterocíclico sustituido o sin sustituir, preferiblemente un anillo de oxazolidina, tiazolidina, piperidina, morfolina, dihidropirimidina o benzoxazina;

o

b) uno o varios compuestos tomados entre el grupo formado por
anhídrido de ácido 1,8-naftálico,
difenil-metoxi-acetato de metilo,
ciano-metoxiimino(fenil)acetonitrilo (ciometrinilo),
1,3-dioxola-2-il-metoxiimino(fenil)acetonitrilo (oxabetrinilo),
O-1,3-dioxolan-2-il-metil-oxima de 4'-cloro-2,2,2-trifluoro-acetofenona (fluxofenima),
4,6-dicloro-2-fenil-pirimidina (fenclorima),
2-cloro-4-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxilato de bencilo (flurazol),
2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano (MG-191),
N-(4-metil-fenil)-N'-(1-metil-1-fenil-etil)urea (dimrón),
1-[4-(N-2-metoxi-benzoil-sulfamoil)fenil]-3-metil-urea,
1-[4-(N-2-metoxi-benzoil-sulfamoil)fenil]-3,3-dimetil-urea;
1-[4-(N-4,5-dimetil-benzoil-sulfamoil)fenil]-3-metil-urea,
1-[4-(N-naftoil-sulfamoil)fenil]-3,3-dimetil-urea,
ácido (2,4-dicloro-fenoxi)acético (2,4-D),
ácido (4-cloro-fenoxi)acético,
ácido (R,S)-2-(4-cloro-o-toliloxi)propiónico (mecoprop),
ácido 4-(2,4-dicloro-fenoxi)butírico (2,4-DB),
ácido (4-cloro-o-toliloxi)acético (MCPA),
ácido 4-(4-cloro-o-toliloxi)butírico,
ácido 4-(4-cloro-fenoxi)butírico,
ácido 3,6-dicloro-2-metoxi-benzoico (dicamba),
3,6-dicloro-2-metoxi-benzoato de 1-(etoxicarbonil)etilo (lactidicloro) así como sus sales y ésteres, preferiblemente ésteres (C_1-C_8);

c) N-acil-sulfonamidas de la fórmula (XVI) y sus sales



(XVI)

en las que

R^{30} significa hidrógeno, un radical hidrocarbilo, un radical hidrocarbil-oxi, un radical hidrocarbil-tio o un radical heterociclilo, estando cada uno de los 4 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales iguales o diferentes tomados entre el grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, carboxi, formilo, carboxamida, sulfonamida y radicales de la fórmula $-Z^a-R^a$, teniendo cada parte de hidrocarbilo preferiblemente de 1 a 20 átomos de C y un radical R^{30} que contiene C y que, inclusive los sustituyentes, tiene preferiblemente de 1 a 30 átomos de C;

R^{31} significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_4), preferiblemente hidrógeno, o

R^{30} y R^{31} en común con el grupo de la fórmula -CO-N-, significa el radical de un anillo saturado o insaturado de 3 a 8 miembros;

R^{32} iguales o diferentes, significan halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, carboxi, formilo, $CONH_2$, SO_2NH_2 o un radical de la fórmula $-Z^b-R^b$;

R^{33} significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_4), preferiblemente H; los

R^{34} iguales o diferentes, significan halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, carboxi, CHO, $CONH_2$, SO_2NH_2 o un radical de la fórmula Z^c-R^c;

R^a significa un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales iguales o diferentes tomados entre el grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, mono- y di-[alquil (C_1-C_4)]amino, o significa un radical alquilo, en el que varios, preferiblemente 2 ó 3, grupos CH_2 no contiguos están reemplazados en cada caso por un átomo de oxígeno;

R^b, R^c iguales o diferentes, significan un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales iguales o diferentes, tomados entre el grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, fosforilo, halógeno-alcoxi (C_1-C_4), mono- y di-[alquil (C_1-C_4)]-amino, o un radical alquilo, en el que varios, preferiblemente 2 ó 3, grupos CH_2 no contiguos están reemplazados en cada caso por un átomo de oxígeno;

Z^a significa un grupo divalente de la fórmula -O-, -S-, -CO-, -CS-, -CO-O-, -CO-S-, -O-CO-, -S-CO-, -SO-, $-SO_2-$, $-NR^+-$, $-CO-NR^+-$, $-NR^+-CO-$, $-SO_2-NR^+-$ ó $-NR^+-SO_2-$, siendo el enlace indicado a la derecha del respectivo grupo divalente el enlace dirigido hacia el radical R^a y significando los R^+ en los 5 radicales mencionados en último término, independientemente unos de otros, en cada caso H, alquilo (C_1-C_4) o halo-alquilo (C_1-C_4);

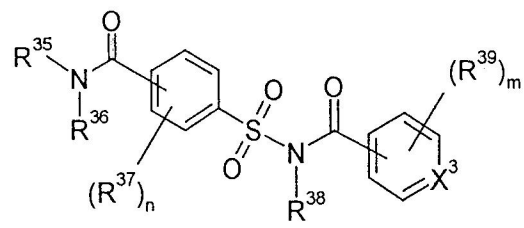
Z^b, Z^c independientemente uno de otro, significan un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O-, -S-, -CO-, -CS-, -CO-O-, -CO-S-, -O-CO-, -S-CO-, -SO-, $-SO_2-$, $-NR^+-$, $-SO_2-NR^+-$, $-NR^+-SO_2-$, $-CO-NR^+-$ ó $-NR^+-CO-$ siendo el enlace indicado a la derecha del respectivo grupo divalente el enlace dirigido hacia el radical R^b o R^c respectivamente y significando los R^+ en los 5 radicales mencionados en último término,

independientemente unos de otros, en cada caso H, alquilo (C_1-C_4) o halo-alquilo (C_1-C_4);

n significa un número entero de 0 a 4, preferiblemente 0, 1 ó 2, especialmente 0 ó 1, y

m significa un número entero de 0 a 5, preferiblemente 0, 1, 2 ó 3, especialmente 0, 1 ó 2;

d) amidas de ácidos acil-sulfamoil-benzoicos de la fórmula general (XVII), eventualmente también en forma de una sal,



(XVII)

en la que

X^3 significa CH ó N;

R^{35} significa hidrógeno, heterociclilo o un radical hidrocarbilo, estando los dos radicales mencionados en último término eventualmente sustituidos con uno o varios radicales iguales o diferentes, tomados entre el grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, carboxi, CHO, $CONH_2$, SO_2NH_2 y Z^a-R^a;

R^{36} significa hidrógeno, hidroxi, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alcoxi (C_1-C_6), alquenil (C_2-C_6)-oxi, estando los cinco radicales mencionados en último término eventualmente sustituidos con uno o varios radicales, iguales o diferentes, tomados entre el grupo formado por halógeno, hidroxi, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o

R^{35} y R^{36} en común con el átomo de nitrógeno que los lleva, significan un anillo saturado o insaturado de 3 a 8 miembros;

R^{37} significa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, carboxi, CHO, $CONH_2$, SO_2NH_2 ó Z^b-R^b;

R^{38} significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_4) o alquinilo (C_2-C_4);

R^{39} significa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, carboxi, fosforilo, CHO, $CONH_2$, SO_2NH_2 ó Z^c-R^c;

R^a significa un radical alquilo (C_2-C_{20}), cuya cadena de carbonos está interrumpida una vez o múltiples veces por átomos de oxígeno, o significa heterociclilo o un radical hidrocarbilo, estando los dos radicales mencionados en último término eventualmente sustituidos con uno o varios radicales iguales o diferentes, tomados entre el grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, mono- y di-[alquil (C_1-C_4)]amino;

R^b y R^c iguales o diferentes, significan un radical alquilo (C_2-C_{20}), cuya cadena de carbonos está interrumpida una vez o múltiples veces por átomos de oxígeno, o significan heterociclilo o un radical hidrocarbilo, estando los dos radicales mencionados en último término eventualmente sustituidos con uno o varios radicales iguales o diferentes, tomados entre el grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxi, fosforilo, halo-alcoxi (C_1-C_4), mono- y di-[alquil (C_1-C_4)]amino;

Z^a significa una unidad divalente tomada entre el grupo formado por O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO_2, NR^d, $C(O)NR^d$ ó SO_2NR^d;

Z^b, Z^c iguales o diferentes, significan un enlace directo o una unidad divalente tomada entre el grupo formado por O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO_2, NR^d, SO_2NR^d ó $C(O)NR^d$;

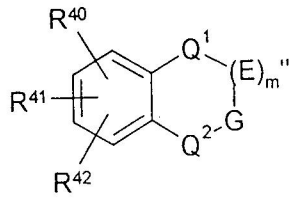
R^d significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_4) o halo-alquilo (C_1-C_4);

n es un número entero de 0 a 4, y

m en el caso de que X represente CH, significa un número entero de 0 a 5, y en el caso de que X represente N,

significa un número entero de 0 a 4;

e) Compuestos de la fórmula (XVIII),



(XVIII)

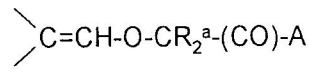
en la que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

R^{40} es H, alquilo (C_1-C_4), alquilo (C_1-C_4) sustituido con alquil (C_1-C_4)-X^4 o halo-alquil (C_1-C_4)-X^4, halo-alquilo (C_1-C_4), NO_2, CN, -COO-R^{43}, NR_2^{44}, $SO_2NR_2^{45}$ ó $CONR_2^{46}$;

R^{41} es H, halógeno, alquilo (C_1-C_4), CF_3, alcoxi (C_1-C_4) o halo-alcoxi (C_1-C_4);

R^{42} es H, halógeno o alquilo (C_1-C_4);

Q^1, Q^2, E, G son, iguales o diferentes, -O-, -S-, $-CR_{247}-$, -CO-, NR^{48}- o un grupo de la fórmula (XIX),



(XIX)

con la condición de que

a) por lo menos uno de los grupos **Q^1, Q^2, E, G** sea un grupo carbonilo, de que exactamente uno de estos grupos sea un radical de la fórmula (XIX) y de que el grupo de la fórmula (XIX) esté contiguo a un grupo carbonilo, y

b) de que dos grupos contiguos **Q^1, Q^2, E** y **G** no pueden ser simultáneamente oxígeno; los

R^a son, iguales o diferentes, H o alquilo (C_1-C_8) o los dos radicales **R^a** en común son alquileno (C_2-C_6);

A es R^b-Y^3- ó $-NR_2^{49}$;

X^4 es -O- ó $-S(O)_p-$;

Y^3 es -O- ó -S-;

R^b es H, alquilo (C_1-C_8), halo-alquilo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_8), alquenil (C_3-C_6)-oxi-alquilo (C_1-C_8), o fenil-alquilo (C_1-C_8), estando el anillo de fenilo eventualmente sustituido con halógeno, alquilo (C_1-C_4), CF_3, metoxi o metil-$S(O)_p$; o es alquenilo (C_3–C_6), halo-alquenilo (C_3-C_6), fenil-alquenilo (C_3–C_6), alquinilo (C_3-C_6), fenil-alquinilo (C_3-C_6), oxetanilo, furfurilo, tetrahidrofurfurilo;

R^{43} es H o alquilo (C_1-C_4); los

R^{44} son, iguales o diferentes, H, alquilo (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-carbonilo o los dos radicales R^{44} son en común alquileno (C_4-C_5);

R^{45}, R^{46} son independientemente uno de otro, en cada caso iguales o diferentes, H, alquilo (C_1-C_4), o los dos radicales R^{45} y/o R^{46} en común son alquileno (C_4-C_5), pudiendo un grupo CH_2 estar reemplazado por O ó S, o uno o dos grupos CH_2 estar reemplazado(s) por -NR^c-;

R^c es H o alquilo (C_1-C_8); los

R^{47} son, iguales o diferentes, H, alquilo (C_1-C_8), o los dos radicales R^{47} en común son alquileno (C_2-C_6);

R^{48} es H, alquilo (C_1-C_8), fenilo sustituido o sin sustituir, o bencilo sin sustituir o sustituido en el anillo de fenilo; los

R^{49} son, iguales o diferentes, H, alquilo (C_1-C_8), fenilo, fenil-alquilo (C_1-C_8), pudiendo un anillo de fenilo estar sustituido con F, Cl, Br, NO_2, CN, OCH_3, alquilo (C_1-C_4) ó CH_3SO_2-; son alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3–C_6) o dos radicales R^{49} en común son alquileno (C4–C_5), pudiendo un grupo CH_2 estar reemplazado por O ó S, o uno o dos grupos CH_2 estar reemplazado(s) por –NR^d-;

R^d es H o alquilo (C_1-C_4);

m'' es 0 ó 1; y

p es 0, 1 ó 2;

inclusive los estereoisómeros y las sales habituales en la agricultura.

Para la aplicación, las formulaciones presentes en una

forma usual en el comercio se diluyen eventualmente de un modo usual, p.ej. mediante agua en el caso de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables en agua. Los preparados en forma de polvos finos, los granulados para el suelo o para esparcir así como las soluciones atomizables ya no son diluidas usualmente antes de la aplicación con otros materiales inertes.

Con las condiciones externas, tales como la temperatura, la humedad, el tipo del herbicida utilizado, etc, varía la cantidad consumida necesaria de los compuestos de la fórmula (I). Ésta puede fluctuar dentro de amplios límites, p.ej. entre 0,001 y 10,0 kg/ha y más de sustancia activa, pero preferiblemente está situada entre 0,005 y 5 kg/ha.

Ejemplos

A. Ejemplos químicos

Ejemplo A1

2-[(*terc*.-Butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo

A una solución de 1,00 g (3,58 mmol) de 2-(cloro-sulfonil)-6-nitro-benzoato de metilo en 8 ml de diclorometano se le añaden gota a gota a 0°C 1,4 ml (13,3 mmol) de terc.-butil-amina y la mezcla de reacción se deja llegar luego a la temperatura ambiente. Después de 2 h la mezcla de reacción se vierte sobre una mezcla de hielo y agua, se ajusta a pH 3 con ácido clorhídrico acuoso 2 N y se extrae con diclorometano. A continuación, la fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio, se separa por filtración y se concentra hasta sequedad en vacío. El residuo remanente se digiere con dietil-éter y se filtra con succión. De esta manera se obtienen 1,06 g (91 % del rendimiento teórico) de 2-[(terc.-butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo de p. f. 89-91°C.

Ejemplo A2

2-(Amino-sulfonil)-6-nitro-benzoato de metilo

300 mg (0,948 mmol) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo se agitan a la temperatura ambiente durante 4 h en 8 ml de ácido trifluoroacético. A continuación se concentra hasta sequedad en vacío y el residuo se digiere con dietil-éter. Después de haber filtrado con succión y secado quedan 230 mg (93 % del rendimiento teórico) de 2-(amino-sulfonil)-6-nitro-benzoato de metilo de p. f. 227-229°C.

Ejemplo A3

2-[(*terc.*-Butil-amino)sulfonil]-6-(isopropil-amino)benzoato de metilo

A una temperatura de 5 - 10°C se incorporan con agitación 925 mg (24,4 mmol) de borohidruro de sodio en 14 ml de ácido acético. Después de 1 h, esta mezcla se reúne primeramente con 1,42 g (24,4 mmol) de acetona, luego se mezcla con 700 mg (2,44 mmol) de 2-amino-6-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]benzoato de metilo y se agita durante 2,5 h a 5 - 10°C). Para el tratamiento, la mezcla de reacción se vierte sobre una mezcla de hielo y agua, se neutraliza con una solución acuosa de amoníaco y se extrae con diclorometano. La fase orgánica se concentra y el residuo remanente se tritura con diisopropil-éter. Después de haber filtrado con succión y secado quedan 700 mg (89 % del rendimiento teórico) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-(isopropil-amino)benzoato de metilo como un material sólido de color blanco de p.f. 110 - 112°C.

Ejemplo A4

2-Amino-6-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]benzoato de metilo

Una solución de 8,00 g (25,3 mmol) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo se mezcla con 3,2 g de paladio sobre carbón activo (al 5%) y se hidrogena bajo la presión normal durante 6 h a la temperatura ambiente. A continuación, la mezcla de reacción se filtra, el material

filtrado se concentra hasta sequedad y el residuo se purifica por cromatografía en gel de sílice [DC (SiO_2) en acetato de etilo/n-heptano 1:1; R_f = 0,38] con una mezcla de acetato de etilo y n-heptano (1:1). Después de evaporación se obtienen 6,23 g (86 % del rendimiento teórico) de 2-amino-6-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]benzoato de metilo como un material sólido de color beige con un punto de fusión de 132 - 133°C.

Ejemplo A5

2-(Diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo

700 mg (2,04 mmol) de 2-(diisobutil-amino)-6-(sulfonil-amino)benzoato de metilo y 619 mg (2,25 mmol) de éster fenílico de ácido N-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)carbámico se disponen previamente en 10 ml de acetonitrilo. A la temperatura ambiente se añaden luego gota a gota 375 mg (2,51 mmol) de 1,8-diaza-biciclo[5.4.0]undec-7-eno (1,5-5) (DBU) y la mezcla de reacción se agita a esta temperatura durante 3 h. A continuación se vierte sobre una mezcla de hielo y agua y la solución se ajusta lentamente a pH 1 con ácido clorhídrico 2 N. El material sólido precipitado se filtra con succión, se lava posteriormente con agua y se seca. Se obtienen de esta manera 910 mg (91 % del rendimiento teórico) de 2-(diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)amino]carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo de p.f. 166 - 167°C.

Ejemplo A6

2-[([(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)-sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo

A una suspensión de 2,79 g (17,9 mmol) de 2-amino-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazina, 1,28 g (19,7 mmol) de cianato de sodio, 1,45 ml (17,9 mmol) de piridina y 500 mg de un tamiz molecular recientemente activado (tamaño de poros 3Å) en 85 ml de acetonitrilo seco, se le añade gota a gota a 55 - 60°C en el transcurso de 2 h bajo argón una solución de 5,0 g

(17,9 mmol) de éster metílico del ácido 2-cloro-sulfonil-6-nitro-benzoico en 55 ml de diclorometano seco. Después de haber agitado durante 7 h a esta temperatura se deja llegar a la temperatura ambiente. Después de otras 12 h la mezcla de reacción se concentra, el residuo se suspende en 200 ml de agua y se ajusta a pH 10 con una solución acuosa 2 N de hidróxido de sodio. El material sólido precipitado se filtra con succión y el material filtrado se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa y la fase acuosa se ajusta a pH 1,5 con una solución acuosa 3 N de ácido clorhídrico y se sigue agitando durante 15 min en un baño de hielo. A continuación el material sólido precipitado se filtra con succión, se lava posteriormente primero con agua y luego con metanol, y se seca en vacío. De este modo se obtienen 2,88 g (36 % del rendimiento teórico) de 2-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo de p.f. 185 - 195°C (con descomposición).

Ejemplo A7

2-Amino-6-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]-carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo

50 mg (113 µmol) de 2-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo se suspenden en 3 ml de una mezcla de metanol y dimetil-formamida (5:1), se mezclan con 10 mg de paladio sobre carbón activo (al 5 %) y 1 mg (8,20 µmol) de (meta)vanadato de sodio y se hidrogena durante 3 h a la temperatura ambiente bajo la presión normal. A continuación, se separa por filtración, el material filtrado se concentra, el residuo se recoge en agua y se ajusta a pH 1,5 con una solución acuosa 3 N de ácido clorhídrico. El precipitado depositado se sigue agitando durante 10 min en un baño de hielo, luego se filtra con succión y se seca en vacío. Se obtienen 41 mg (87 % del rendimiento teórico) de 2-amino-6-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)-sulfonil]benzoato de metilo de p.f. 129 - 134°C (con descomposición).

Ejemplo A8

2-(Diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo, sal de sodio

En 5 ml de tetrahidrofurano se incorporan con agitación 0,2 g (0,382 mmol) de 2-(diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)amino]carbonil-amino)sulfonil]-benzoato de metilo y a continuación se añaden 0,04 g (416 µmol) de terc.-butilato de sodio. Después de 6 h, el material sólido resultante se filtra con succión y se seca. Se obtienen 0,19 g (93 % del rendimiento teórico) de 2-(diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)amino]-carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo, sal de sodio, como un material sólido incoloro de p.f. 215 - 217°C.

Los compuestos descritos en las siguientes Tablas 1, 2 y 3 se obtienen de acuerdo con los Ejemplos A1 - A8 anteriores o análogamente a ellos.

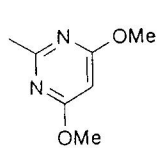
Abreviaturas en las Tablas 1, 2 y 3

p.f. = punto de fusión en °C
(Z) = punto de fusión con descomposición
Bu = n-butilo (correspondientemente Pe = n-pentilo, Hex = n-hexilo)
Et = etilo
Me = metilo
Ph = fenilo
Pr, i-Pr, c-Pr = n-propilo, isopropilo o ciclopropilo
Un di-radical tal como butileno de la fórmula

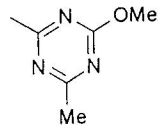


en las columnas para R^2, R^3 significa que R^2 y R^3 significan en común el puente de di-radical y forman con el átomo de N del grupo R^2R^3N una amina cíclica.

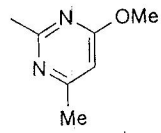
Het = heterociclo, representando Het uno de los radicales desde T1 hasta T20



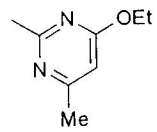
T1



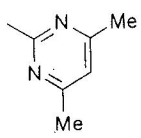
T2



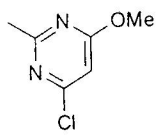
T3



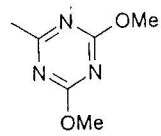
T4



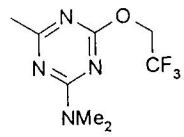
T5



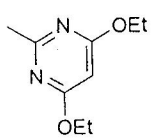
T6



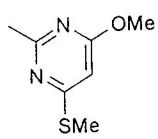
T7



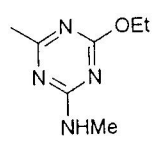
T8



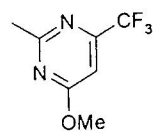
T9



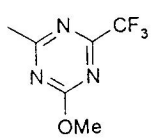
T10



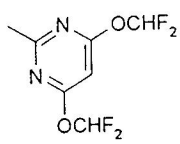
T11



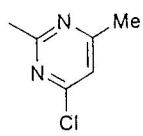
T12



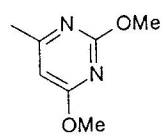
T13



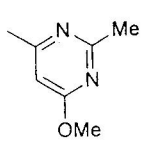
T14



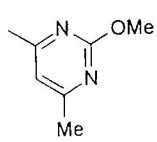
T15



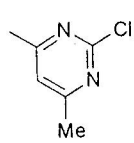
T16



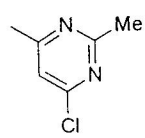
T17



T18

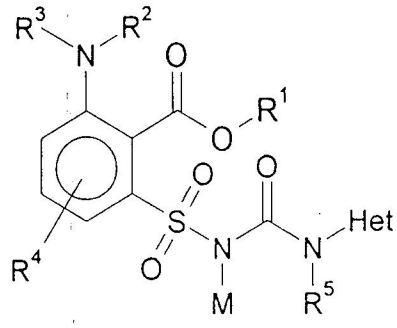


T19



T20

Tabla 1: Compuestos de la fórmula (Ia)



(Ia)

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-1.	H	H	H	-	H	H	T1	
1-2.	H	H	H	-	H	Na	T1	
1-3.	H	H	H	-	H	H	T2	
1-4.	H	H	H	-	H	Na	T2	
1-5.	H	H	H	-	H	H	T5	
1-6.	H	H	H	-	H	Na	T5	
1-7.	H	H	H	-	H	H	T6	
1-8.	H	H	H	-	H	Na	T6	
1-9.	H	H	H	-	H	H	T7	141-142
1-10.	H	H	H	-	H	Na	T7	
1-11.	Me	H	H	-	H	H	T1	171-173
1-12.	Me	H	H	-	H	Na	T1	
1-13.	Me	H	H	-	Me	H	T2	
1-14.	Me	H	H	-	Me	Na	T2	
1-15.	Me	H	H	-	H	H	T2	126-127 (Z)
1-16.	Me	H	H	-	H	Na	T2	239-242
1-17.	Me	H	H	-	H	H	T3	137-139 (Z)
1-18.	Me	H	H	-	H	Na	T3	
1-19.	Me	H	H	-	H	H	T4	
1-20.	Me	H	H	-	H	Na	T4	
1-21.	Me	H	H	-	H	H	T5	
1-22.	Me	H	H	-	H	Na	T5	
1-23.	Me	H	H	-	H	H	T6	137-139
1-24.	Me	H	H	-	H	Na	T6	
1-25.	Me	H	H	-	H	H	T7	129-134 (Z)
1-26.	Me	H	H	-	H	Na	T7	257-260 (Z)
1-27.	Me	H	H	-	Me	H	T7	
1-28.	Me	H	H	-	Me	Na	T7	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-29.	Me	H	H	-	H	H	T8	
1-30.	Me	H	H	-	H	Na	T8	
1-31.	Me	H	H	-	H	H	T9	
1-32.	Me	H	H	-	H	Na	T9	
1-33.	Me	H	H	-	H	H	T10	
1-34.	Me	H	H	-	H	Na	T10	
1-35.	Me	H	H	-	H	H	T11	
1-36.	Me	H	H	-	H	Na	T11	
1-37.	Me	H	H	-	H	H	T12	
1-38.	Me	H	H	-	H	Na	T12	
1-39.	Me	H	H	-	H	H	T13	
1-40.	Me	H	H	-	H	Na	T13	
1-41.	Me	H	H	-	H	H	T14	162-164 (Z)
1-42.	Me	H	H	-	H	Na	T14	
1-43.	Me	H	H	-	H	H	T15	
1-44.	Me	H	H	-	H	Na	T15	
1-45.	Et	H	H	-	H	H	T1	164-166
1-46.	Et	H	H	-	H	Na	T1	
1-47.	Et	H	H	-	H	H	T2	149-151
1-48.	Et	H	H	-	H	Na	T2	
1-49.	Et	H	H	-	H	H	T3	
1-50.	Et	H	H	-	H	Na	T3	
1-51.	Et	H	H	-	H	H	T4	
1-52.	Et	H	H	-	H	Na	T4	
1-53.	Et	H	H	-	H	H	T5	
1-54.	Et	H	H	-	H	Na	T5	
1-55.	Et	H	H	-	H	H	T6	157-158
1-56.	Et	H	H	-	H	Na	T6	
1-57.	Et	H	H	-	H	H	T7	158-160
1-58.	Et	H	H	-	H	Na	T7	
1-59.	Et	H	H	-	H	H	T8	
1-60.	Et	H	H	-	H	Na	T8	
1-61.	Et	H	H	-	H	H	T9	
1-62.	Et	H	H	-	H	Na	T9	
1-63.	Et	H	H	-	H	H	T10	
1-64.	Et	H	H	-	H	Na	T10	
1-65.	Et	H	H	-	H	H	T11	
1-66.	Et	H	H	-	H	Na	T11	
1-67.	Et	H	H	-	H	H	T12	
1-68.	Et	H	H	-	H	Na	T12	
1-69.	Et	H	H	-	H	H	T13	
1-70.	Et	H	H	-	H	Na	T13	
1-71.	Et	H	H	-	H	H	T14	
1-72.	Et	H	H	-	H	Na	T14	
1-73.	Et	H	H	-	H	H	T15	
1-74.	Et	H	H	-	H	Na	T15	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-75.	i-Pr	H	H	-	H	H	T1	
1-76.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T1	
1-77.	i-Pr	H	H	-	H	H	T2	
1-78.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T2	
1-79.	i-Pr	H	H	-	H	H	T5	
1-80.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T5	
1-81.	i-Pr	H	H	-	H	H	T6	
1-82.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T6	
1-83.	i-Pr	H	H	-	H	H	T7	
1-84.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T7	
1-85.	Alil	H	H	-	H	H	T1	
1-86.	Alil	H	H	-	H	Na	T1	
1-87.	Alil	H	H	-	H	H	T2	
1-88.	Alil	H	H	-	H	Na	T2	
1-89.	Alil	H	H	-	H	H	T5	
1-90.	Alil	H	H	-	H	Na	T5	
1-91.	Alil	H	H	-	H	H	T6	
1-92.	Alil	H	H	-	H	Na	T6	
1-93.	Alil	H	H	-	H	H	T7	
1-94.	Alil	H	H	-	H	Na	T7	
1-95.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T1	
1-96.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T1	
1-97.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T2	
1-98.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T2	
1-99.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T5	
1-100.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T5	
1-101.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T6	
1-102.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T6	
1-103.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T7	
1-104.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T7	
1-105.	Me	Me	H	-	H	H	T1	169-171
1-106.	Me	Me	H	-	H	Na	T1	
1-107.	Me	Me	H	-	H	H	T2	
1-108.	Me	Me	H	-	H	Na	T2	
1-109.	Me	Me	H	-	H	H	T6	
1-110.	Me	Me	H	-	H	Na	T6	
1-111.	Me	Me	H	-	H	H	T7	
1-112.	Me	Me	H	-	H	Na	T7	
1-113.	Et	Me	H	-	H	H	T1	
1-114.	Et	Me	H	-	H	Na	T1	
1-115.	Et	Me	H	-	H	H	T2	
1-116.	Et	Me	H	-	H	Na	T2	
1-117.	i-Pr	Me	H	-	H	H	T1	
1-118.	i-Pr	Me	H	-	H	Na	T1	
1-119.	i-Pr	Me	H	-	H	H	T2	
1-120.	i-Pr	Me	H	-	H	Na	T2	
1-121.	Alil	Me	H	-	H	H	T1	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-122.	Alil	Me	H	-	H	Na	T1	
1-123.	Alil	Me	H	-	H	H	T2	
1-124.	Alil	Me	H	-	H	Na	T2	
1-125.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	H	T1	
1-126.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	Na	T1	
1-127.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	H	T2	
1-128.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	Na	T2	
1-129.	Me	Et	H	-	H	H	T1	164-166
1-130.	Me	Et	H	-	H	Na	T1	
1-131.	Me	Et	H	-	H	H	T2	215-217
1-132.	Me	Et	H	-	H	Na	T2	
1-133.	Me	Et	H	-	H	H	T6	
1-134.	Me	Et	H	-	H	Na	T6	
1-135.	Me	Et	H	-	H	H	T7	170-172
1-136.	Me	Et	H	-	H	Na	T7	
1-137.	Et	Et	H	-	H	H	T1	
1-138.	Et	Et	H	-	H	Na	T1	
1-139.	Et	Et	H	-	H	H	T2	
1-140.	Et	Et	H	-	H	Na	T2	
1-141.	i-Pr	Et	H	-	H	H	T1	
1-142.	i-Pr	Et	H	-	H	Na	T1	
1-143.	i-Pr	Et	H	-	H	H	T2	
1-144.	i-Pr	Et	H	-	H	Na	T2	
1-145.	Alil	Et	H	-	H	H	T1	
1-146.	Alil	Et	H	-	H	Na	T1	
1-147.	Alil	Et	H	-	H	H	T2	
1-148.	Alil	Et	H	-	H	Na	T2	
1-149.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	H	T1	
1-150.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	Na	T1	
1-151.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	H	T2	
1-152.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	Na	T2	
1-153.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T1	165-167
1-154.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T1	124-126
1-155.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T2	139-140 (Z)
1-156.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-157.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-158.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-159.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T7	161-163 (Z)
1-160.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-161.	Et	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-162.	Et	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-163.	Et	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-164.	Et	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-165.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-166.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	Na	T1	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-167.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-168.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-169.	Alil	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-170.	Alil	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-171.	Alil	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-172.	Alil	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-173.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-174.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-175.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-176.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-177.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	163-165
1-178.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-179.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	171-173 (Z)
1-180.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-181.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-182.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-183.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T7	174-176 (Z)
1-184.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-185.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-186.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-187.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-188.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-189.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-190.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-191.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-192.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-193.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-194.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-195.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-196.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-197.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-198.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-199.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-200.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-201.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-202.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-203.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-204.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-205.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-206.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-207.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-208.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-209.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T6	
1-210.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T6	
1-211.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T7	

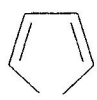
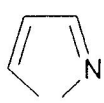
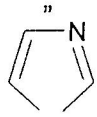
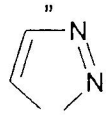
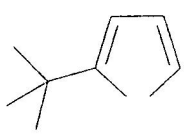
Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-212.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T7	
1-213.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-214.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-215.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-216.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-217.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T6	
1-218.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T6	
1-219.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T7	
1-220.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T7	
1-221.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-222.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-223.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-224.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-225.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-226.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-227.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-228.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-229.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-230.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-231.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-232.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-233.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T1	
1-234.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T1	
1-235.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T2	
1-236.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T2	
1-237.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T6	
1-238.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T6	
1-239.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T7	
1-240.	Me	$CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T7	
1-241.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T1	173-175
1-242.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T1	
1-243.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T2	177-179
1-244.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T2	
1-245.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T6	
1-246.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T6	
1-247.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	H	T7	171-173
1-248.	Me	$CH_2CH_2CH_2CF_3$	H	-	H	Na	T7	
1-249.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T1	
1-250.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T1	
1-251.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T2	
1-252.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T2	
1-253.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T6	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-254.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T6	
1-255.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T7	
1-256.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T7	
1-257.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	H	T1	
1-258.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	Na	T1	
1-259.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	H	T2	
1-260.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	Na	T2	
1-261.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	H	T6	
1-262.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	Na	T6	
1-263.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	H	T7	
1-264.	Me	$CH(Me)CH_2C(O)NH_2$	H	-	H	Na	T7	
1-265.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	H	T1	171-173
1-266.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	Na	T1	
1-267.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	H	T2	154-156
1-268.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	Na	T2	
1-269.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	H	T6	
1-270.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	Na	T6	
1-271.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	H	T7	172-174
1-272.	Me	$CH(Me)CH_2CH_3$	H	-	H	Na	T7	
1-273.	Me	Alil	H	-	H	H	T1	
1-274.	Me	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-275.	Me	Alil	H	-	H	H	T2	
1-276.	Me	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-277.	Me	Alil	H	-	H	H	T6	
1-278.	Me	Alil	H	-	H	Na	T6	
1-279.	Me	Alil	H	-	H	H	T7	
1-280.	Me	Alil	H	-	H	Na	T7	
1-281.	Et	Alil	H	-	H	H	T1	
1-282.	Et	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-283.	Et	Alil	H	-	H	H	T2	
1-284.	Et	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-285.	Et	Alil	H	-	H	H	T6	
1-286.	Et	Alil	H	-	H	Na	T6	
1-287.	Et	Alil	H	-	H	H	T7	
1-288.	Et	Alil	H	-	H	Na	T7	
1-289.	i-Pr	Alil	H	-	H	H	T1	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-290.	i-Pr	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-291.	i-Pr	Alil	H	-	H	H	T2	
1-292.	i-Pr	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-293.	Alil	Alil	H	-	H	H	T1	
1-294.	Alil	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-295.	Alil	Alil	H	-	H	H	T2	
1-296.	Alil	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-297.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	H	T1	
1-298.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-299.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	H	T2	
1-300.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-301.	Me	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-302.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-303.	Me	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-304.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-305.	Me	Propargil	H	-	H	H	T6	
1-306.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T6	
1-307.	Me	Propargil	H	-	H	H	T7	
1-308.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T7	
1-309.	Et	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-310.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-311.	Et	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-312.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-313.	Et	Propargil	H	-	H	H	T6	
1-314.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T6	
1-315.	Et	Propargil	H	-	H	H	T7	
1-316.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T7	
1-317.	i-Pr	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-318.	i-Pr	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-319.	i-Pr	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-320.	i-Pr	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-321.	Alil	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-322.	Alil	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-323.	Alil	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-324.	Alil	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-325.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-326.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-327.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-328.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-329.	Me	OMe	H	-	H	H	T1	
1-330.	Me	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-331.	Me	OMe	H	-	H	H	T2	
1-332.	Me	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-333.	Me	OMe	H	-	H	H	T6	
1-334.	Me	OMe	H	-	H	Na	T6	
1-335.	Me	OMe	H	-	H	H	T7	
1-336.	Me	OMe	H	-	H	Na	T7	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-337.	Et	OMe	H	-	H	H	T1	
1-338.	Et	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-339.	Et	OMe	H	-	H	H	T2	
1-340.	Et	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-341.	Et	OMe	H	-	H	H	T6	
1-342.	Et	OMe	H	-	H	Na	T6	
1-343.	Et	OMe	H	-	H	H	T7	
1-344.	Et	OMe	H	-	H	Na	T7	
1-345.	i-Pr	OMe	H	-	H	H	T1	
1-346.	i-Pr	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-347.	i-Pr	OMe	H	-	H	H	T2	
1-348.	i-Pr	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-349.	Alil	OMe	H	-	H	H	T1	
1-350.	Alil	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-351.	Alil	OMe	H	-	H	H	T2	
1-352.	Alil	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-353.	Me	c-Pr	H	-	H	H	T1	148-150 (Z)
1-354.	Me	c-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-355.	Me	c-Pr	H	-	H	H	T2	147-149
1-356.	Me	c-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-357.	Me	c-Pr	H	-	H	H	T6	
1-358.	Me	c-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-359.	Me	c-Pr	H	-	H	H	T7	177-179
1-360.	Me	c-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-361.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	H	T1	
1-362.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-363.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	H	T2	
1-364.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-365.	Me	NMe_2	H	-	H	H	T1	
1-366.	Me	NMe_2	H	-	H	Na	T1	
1-367.	Me	NMe_2	H	-	H	H	T2	
1-368.	Me	NMe_2	H	-	H	Na	T2	
1-369.	Me	NHCHO	H	-	H	H	T1	
1-370.	Me	NHCHO	H	-	H	Na	T1	
1-371.	Me	NHCHO	H	-	H	H	T2	
1-372.	Me	NHCHO	H	-	H	Na	T2	
1-373.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	H	T1	
1-374.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	Na	T1	
1-375.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	H	T2	
1-376.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	Na	T2	
1-377.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	H	T1	
1-378.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	Na	T1	
1-379.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	H	T2	
1-380.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	Na	T2	
1-381.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T1	189-191
1-382.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T1	

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-383.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T2	151-153
1-384.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T2	
1-385.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T6	
1-386.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T6	
1-387.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T7	166-168 (Z)
1-388.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T7	
1-389.	Me	CH_2OMe	H	-	H	H	T1	
1-390.	Me	CH_2OMe	H	-	H	Na	T1	
1-391.	Me	CH_2OMe	H	-	H	H	T2	
1-392.	Me	CH_2OMe	H	-	H	Na	T2	
1-393.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	H	T1	
1-394.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	Na	T1	
1-395.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	H	T2	
1-396.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	Na	T2	
1-397.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T1	
1-398.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T1	
1-399.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T2	
1-400.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T2	
1-401.	Me	Me	Me	-	H	H	T1	194-196
1-402.	Me	Me	Me	-	H	Na	T1	
1-403.	Me	Me	Me	-	H	H	T2	
1-404.	Me	Me	Me	-	H	Na	T2	
1-405.	Me	Me	Me	-	H	H	T6	
1-406.	Me	Me	Me	-	H	Na	T6	
1-407.	Me	Me	Me	-	H	H	T7	
1-408.	Me	Me	Me	-	H	Na	T7	
1-409.	Me	Me	Et	-	H	H	T1	
1-410.	Me	Me	Et	-	H	Na	T1	
1-411.	Me	Me	Et	-	H	H	T2	
1-412.	Me	Me	Et	-	H	Na	T2	
1-413.	Me	Me	i-Pr	-	H	H	T1	
1-414.	Me	Me	i-Pr	-	H	Na	T1	
1-415.	Me	Me	i-Pr	-	H	H	T2	
1-416.	Me	Me	i-Pr	-	H	Na	T2	
1-417.	Me	Et	Et	-	H	H	T1	207-209
1-418.	Me	Et	Et	-	H	Na	T1	
1-419.	Me	Et	Et	-	H	H	T2	
1-420.	Me	Et	Et	-	H	Na	T2	
1-421.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	H	T1	
1-422.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	Na	T1	
1-423.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	H	T2	
1-424.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	Na	T2	
1-425.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	H	T1	166-167
1-426.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	Na	T1	215-217

Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-427.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	H	T2	
1-428.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	Na	T2	
1-429.	Me			-	H	H	T1	
1-430.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-431.	Me	"		-	H	H	T2	
1-432.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-433.	Me			-	H	H	T1	216-218
1-434.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-435.	Me	"		-	H	H	T2	193-195
1-436.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-437.	Me	"		-	H	H	T6	
1-438.	Me	"		-	H	Na	T6	
1-439.	Me	"		-	H	H	T7	200-202
1-440.	Me	"		-	H	Na	T7	
1-441.	Me			-	H	H	T1	
1-442.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-443.	Me	"		-	H	H	T2	
1-444.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-445.	Me			-	H	H	T1	
1-446.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-447.	Me	"		-	H	H	T2	
1-448.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-449.	Me			-	H	H	T1	
1-450.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-451.	Me	"		-	H	H	T2	
1-452.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-453.	Me			-	H	H	T1	211-213 (Z)
1-454.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-455.	Me	"		-	H	H	T2	208-209
1-456.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-457.	Me	"		-	H	H	T6	
1-458.	Me	"		-	H	Na	T6	

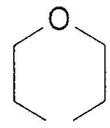
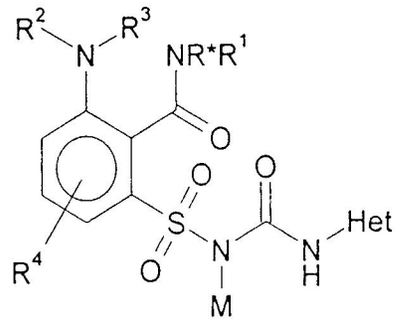
Ej. Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-459.	Me	"		-	H	H	T7	201-203
1-460.	Me	"		-	H	Na	T7	
1-461.	Me			-	H	H	T1	
1-462.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-463.	Me	"		-	H	H	T2	
1-464.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-465.	Me	H	H	5-Me	H	H	T1	
1-466.	Me	H	H	5-Me	H	Na	T1	
1-467.	Me	H	H	5-Me	H	H	T2	
1-468.	Me	H	H	5-Me	H	Na	T2	
1-469.	Me	H	H	5-F	H	H	T1	
1-470.	Me	H	H	5-F	H	Na	T1	
1-471.	Me	H	H	5-F	H	H	T2	
1-472.	Me	H	H	5-F	H	Na	T2	
1-473.	Me	H	H	5-Cl	H	H	T1	
1-474.	Me	H	H	5-Cl	H	Na	T1	
1-475.	Me	H	H	5-Cl	H	H	T2	
1-476.	Me	H	H	5-Cl	H	Na	T2	
1-477.	Me	H	H	5-OMe	H	H	T1	
1-478.	Me	H	H	5-OMe	H	Na	T1	
1-479.	Me	H	H	5-OMe	H	H	T2	
1-480.	Me	H	H	5-OMe	H	Na	T2	
1-481.	Me	H	H	5-NO_2	H	H	T1	
1-482.	Me	H	H	5-NO_2	H	Na	T1	
1-483.	Me	H	H	5-NO_2	H	H	T2	
1-484.	Me	H	H	5-NO_2	H	Na	T2	
1-485.	Me	H	H	6-Me	H	H	T1	
1-486.	Me	H	H	6-Me	H	Na	T1	
1-487.	Me	H	H	6-Me	H	H	T2	
1-488.	Me	H	H	6-Me	H	Na	T2	
1-489.	Me	H	H	6-Cl	H	H	T1	
1-490.	Me	H	H	6-Cl	H	Na	T1	
1-491.	Me	H	H	6-Cl	H	H	T2	
1-492.	Me	H	H	6-Cl	H	Na	T2	

Tabla 2: Compuestos de la fórmula (Ib)

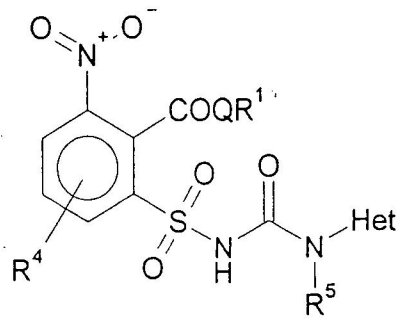


(Ib)

Ej. Nº	R^1	R*	R^2	R^3	R^4	M	Het	P.f.
2-1.	H	H	H	H	-	H	T1	
2-2.	H	H	H	H	-	Na	T1	
2-3.	H	H	H	H	-	H	T2	
2-4.	H	H	H	H	-	Na	T2	
2-5.	Me	Me	H	H	-	H	T1	
2-6.	Me	Me	H	H	-	Na	T1	
2-7.	Me	Me	H	H	-	H	T2	
2-8.	Me	Me	H	H	-	Na	T2	
2-9.	Me	Me	H	H	-	H	T5	
2-10.	Me	Me	H	H	-	Na	T5	
2-11.	Me	Me	H	H	-	H	T6	
2-12.	Me	Me	H	H	-	Na	T6	
2-13.	Me	Me	H	H	-	H	T7	
2-14.	Me	Me	H	H	-	Na	T7	
2-15.	Me	Me	Me	H	-	H	T1	
2-16.	Me	Me	Me	H	-	Na	T1	
2-17.	Me	Me	Me	H	-	H	T2	
2-18.	Me	Me	Me	H	-	Na	T2	
2-19.	Me	Me	Me	H	-	H	T5	
2-20.	Me	Me	Me	H	-	Na	T5	
2-21.	Me	Me	Me	H	-	H	T6	
2-22.	Me	Me	Me	H	-	Na	T6	
2-23.	Me	Me	Me	H	-	H	T7	
2-24.	Me	Me	Me	H	-	Na	T7	
2-25.	Me	Me	H	H	5-Me	H	T1	
2-26.	Me	Me	H	H	5-Me	Na	T1	
2-27.	Me	Me	H	H	5-Me	H	T2	
2-28.	Me	Me	H	H	5-Me	Na	T2	
2-29.	Me	Me	H	H	5-F	H	T1	
2-30.	Me	Me	H	H	5-F	Na	T1	
2-31.	Me	Me	H	H	5-F	H	T2	

Ej. N°	R^1	R*	R^2	R^3	R^4	M	Het	P.f.
2-32.	Me	Me	H	H	5-F	Na	T2	
2-33.	Me	Me	H	H	5-Cl	H	T1	
2-34.	Me	Me	H	H	5-Cl	Na	T1	
2-35.	Me	Me	H	H	5-OMe	H	T1	
2-36.	Me	Me	H	H	5-OMe	Na	T1	
2-37.	Me	Me	H	H	5-NO_2	H	T1	
2-38.	Me	Me	H	H	5-NO_2	Na	T1	
2-39.	Me	Me	H	H	6-Me	H	T1	
2-40.	Me	Me	H	H	6-Me	Na	T1	
2-41.	Me	Me	H	H	6-Cl	H	T1	
2-42.	Me	Me	H	H	6-Cl	Na	T1	
2-43.	Me	Me	Me	H	5-Me	H	T1	
2-44.	Me	Me	Me	H	5-Me	Na	T1	
2-45.	Me	Me	Me	H	5-Cl	H	T1	
2-46.	Me	Me	Me	H	5-Cl	Na	T1	
2-47.	Me	Me	Me	H	5-OMe	H	T1	
2-48.	Me	Me	Me	H	5-OMe	Na	T1	
2-49.	Me	Me	Me	H	5-NO_2	H	T1	
2-50.	Me	Me	Me	H	5-NO_2	Na	T1	
2-51.	Me	Me	Me	H	6-Me	H	T1	
2-52.	Me	Me	Me	H	6-Me	Na	T1	
2-53.	Me	Me	Me	H	6-Cl	H	T1	
2-54.	Me	Me	Me	H	6-Cl	Na	T1	

Tabla 3: Compuestos de la fórmula (VIII)



(VIII)

Ej. Nº	R^1	Q	R^4	R^5	Het	P.f.
3-1.	Me	O	-	H	T1	
3-2.	Me	O	-	Me	T1	161-163
3-3.	Me	O	-	H	T2	212-214
3-4.	Me	O	-	H	T3	218-220
3-5.	Me	O	-	H	T4	
3-6.	Me	O	-	H	T5	
3-7.	Me	O	-	H	T6	
3-8.	Me	O	-	H	T7	211-213
3-9.	Me	O	-	H	T8	
3-10.	Me	O	-	H	T9	
3-11.	Me	O	-	H	T10	
3-12.	Me	O	-	H	T11	
3-13.	Me	O	-	H	T12	
3-14.	Me	O	-	H	T13	
3-15.	Me	O	-	H	T14	
3-16.	Me	O	-	H	T15	
3-17.	Me	O	-	H	T16	
3-18.	Me	O	-	H	T17	
3-19.	Me	O	-	H	T18	
3-20.	Me	O	-	H	T19	
3-21.	Me	O	-	H	T20	
3-22.	Et	O	-	H	T1	223-225
3-23.	Et	O	-	H	T2	194-196
3-24.	Et	O	-	H	T6	
3-25.	Et	O	-	H	T7	
3-26.	Me	NMe	-	H	T1	
3-27.	Me	NMe	-	H	T2	
3-28.	Me	NMe	-	H	T6	
3-29.	Me	NMe	-	H	T7	

B. Ejemplos de formulación

a) Se obtiene un agente para espolvorear, mezclando 10 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y 90 partes en peso de talco como material inerte y desmenuzándolas en un molino de impactos.

b) Se obtiene un polvo humectable, fácilmente dispersable en agua, mezclando 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I), 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como material inerte, 10 partes en peso de la sal de potasio de ácido lignina-sulfónico y 1 parte en peso de la sal de sodio de ácido oleoil-metil-táurico como agente humectante y dispersante y moliéndolas en un molino de púas.

c) Se obtiene un concentrado para dispersión fácilmente dispersable en agua, mezclando 20 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) con 6 partes en peso de un alquilfenol-poliglicol-éter (®Triton X-207), 3 partes en peso de isotridecanol-poliglicol-éter (8 OE = óxido de etileno) y 71 partes en peso de un aceite mineral parafínico (margen de ebullición p.ej. aproximadamente 255° hasta más de 277°C) y moliéndolas en un molino de bolas con fricción hasta una finura inferior a 5 micrómetros.

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

e) Se obtiene un granulado dispersable en agua, mezclando 75 partes en peso de un compuesto de fórmula (I), 10 partes en peso de la sal de calcio de ácido lignina-sulfónico,

5 partes en peso de lauril-sulfato de sodio,
3 partes en peso de un poli(alcohol vinílico) y
7 partes en peso de caolín
moliéndolas en un molino de púas y granulando el polvo en un lecho fluidizado mediante aplicación por atomización de agua como líquido de granulación.

f) Se obtiene también un granulado dispersable en agua, homogeneizando y desmenuzando previamente en un molino de coloides
25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I),
5 partes en peso de la sal de sodio de ácido 2,2'-dinaftilmetano-6,6-disulfónico,
2 partes en peso de la sal de sodio de ácido oleoil-metiltáurico,
1 parte en peso de un poli(alcohol vinílico),
17 partes en peso de carbonato de calcio y
50 partes en peso de agua
a continuación moliéndolas en un molino de perlas, y atomizando y secando la suspensión así obtenida en una torre de atomización mediante una boquilla para un sólo material y secándola.

C. Ejemplos biológicos

1. Efecto sobre las malezas según el procedimiento de antes del brote

Semillas o trozos de rizomas de plantas de malezas mono- y di-cotiledóneas se extendieron sobre macetas de cartón dentro de tierra de légamo arenosa y se cubrieron con tierra. Los compuestos conformes al invento formulados en forma de polvos humectables o concentrados para emulsión se aplicaron luego como suspensiones o emulsiones acuosas con una cantidad consumida de agua, convertida por cálculo es de 600 a 800 l/ha en diferentes dosificaciones sobre la superficie de la tierra cubriente.

Después del tratamiento, las macetas se colocaron en un

invernadero y se mantuvieron en buenas condiciones de crecimiento para las malezas. La evaluación visual de los daños para las plantas o para el brote se efectuó después de haber brotado las plantas experimentales después de un tiempo del experimento de 3 a 4 semanas en comparación con testigos sin tratar. Tal como lo muestran los resultados, los compuestos conformes al invento presentan una buena actividad herbicida antes del brote contra un amplio espectro de malezas y malas hierbas. Por ejemplo, los Ejemplos N°s. 1-9, 1-11, 1-15, 1-16, 1-17, 1-23, 1-25, 1-26, 1-41, 1-45, 1-47, 1-55, 1-57, 1-105, 1-129, 1-131, 1-135, 1—153, 1-154, 1-155, 1-159, 1-159, 1-177, 1-179, 1-189, 1—241, 1-243, 1-247, 1-265, 1-267, 1-271, 1-353, 1-355, 1—359, 1-381, 1-383, 1-387, 1-401, 1-417, 1-425, 1-426, 1—433, 1-435, 1-439, 1-453, 1-455, 1-459 y otros compuestos de las Tablas 1 y 2 manifiestan un muy buen efecto herbicida contra plantas dañinas tales como Sinapis alba, Chrysanthemun segetum, Avena sativa, Stellaria media, Echinochloa crus-gralli, Lolium multiflorum, Setaria spp; Abutilon theoprasti, Amaranthus retroflexus y Panicum miliaceun según el procedimiento de antes del brote con una cantidad consumida de 0,3 kg y menos de sustancia activa por hectárea.

2. Efecto sobre las malezas según el procedimiento de después del brote

Semillas y trozos de rizomas de malezas mono- y dicotiledóneas se extendieron dentro de macetas de material plástico en tierra de légamo arenosa, se cubrieron con tierra y se cultivaron en un invernadero en buenas condiciones de crecimiento. A las tres semanas después de la siembra, las plantas experimentales se trataron en el estadio de tres hojas. Los compuestos conformes al invento formulados como polvos para proyectar o como concentrados para emulsión se proyectaron sobre las partes verdes de las plantas en diferentes dosificaciones con una cantidad consumida de agua que, convertida por cálculo, es de 600 a

800 l/ha. Después de un tiempo de permanencia en reposo de 3 a 4 semanas de las plantas experimentales en el invernadero en condiciones óptimas de crecimiento, se valoró visualmente el efecto de los preparados en comparación con el de los testigos sin tratar. Los agentes conformes al invento presentan también después del brote una buena actividad herbicida contra un amplio espectro de malezas y malas hierbas económicamente importantes. Por ejemplo, los Ejemplos 1-9, 1-11, 1-15, 1-16, 1-17, 1-23, 1-25, 1-26, 1-41, 1-45, 1-47, 1-55, 1-57, 1-105, 1-129, 1-131, 1-135, 1-153, 1-154, 1-155, 1-159, 1-177, 1-179, 1-189, 1-241, 1-243, 1-247, 1-265, 1-267, 1-271, 1-353, 1-355, 1-359, 1-381, 1-383, 1-387, 1-401, 1-417, 1-425, 1-426, 1-433, 1-435, 1-439, 1-453, 1-455, 1-459 y otros compuestos de las Tablas 1 y 2 tienen un efecto herbicida muy bueno contra plantas dañinas tales como Sinapis alba, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Chrysanthemun segetum, Setaria spp, Abutilon theoprasti, Amaranthus retroflexus, Panicum miliaceum y Avena sativa, según el procedimiento de después del brote con una cantidad consumida de 0,3 kg y menos de sustancia activa por hectárea.

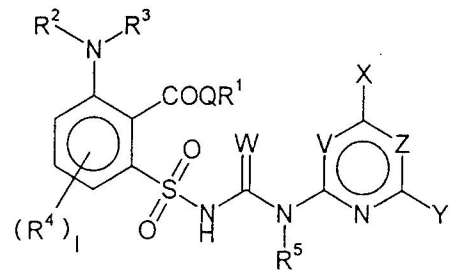
3. Compatibilidad con plantas cultivadas

En otros experimentos en un invernadero se colocaron semillas de un elevado número de plantas cultivadas y malezas en tierra de légamo arenoso y se cubrieron con tierra. Una parte de las macetas se trataron inmediatamente tal como se ha descrito en el párrafo 1, y las demás se colocaron en un invernadero hasta que las plantas hubieron desarrollado de dos a tres hojas verdaderas y luego se rociaron con las sustancias conformes al invento de la fórmula (I) en diferentes dosificaciones como se describe en el párrafo 2. A las cuatro hasta cinco semanas después de la aplicación y de tiempo de permanencia en el invernadero, se comprobó mediante valoración visual que los compuestos conformes al invento dejaron sin dañar a plantas cultivadas dicotiledóneas tales como de soja, algodón, colza, remolacha

azucarera o patatas según los procedimientos de antes y después del brote incluso en el caso de altas dosificaciones de sustancias activas. Algunas sustancias protegieron además de ello también a cultivos de gramíneas tales como cebada, trigo, centeno, mijo, maíz o arroz. Los compuestos de la fórmula (I) manifiestan en parte una alta selectividad y se adecuan por lo tanto para combatir un crecimiento indeseado de plantas en presencia de cultivos agrícolas.

REIVINDICACIONES

1.- Compuesto de la fórmula (I) de la fórmula (I) o una de sus sales,



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando **$R^\#$** un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C,

o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono o un radical que contiene carbono, que tiene de 1 a 30 átomos de C,

l es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C,

Q es O, S ó NR*,

R* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X, Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N.

2.- Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según la reivindicación 1, en el que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo sin sustituir y sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir y sustituido, cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir y sustituido, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo y [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sustituido o sin

sustituir, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido,

llevando el fenilo sustituido, el heterociclilo sustituido, el cicloalquilo sustituido o el cicloalquenilo sustituido como sustituyentes uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), di-[alcoxi (C_1-C_4)]-alquilo (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, OH, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0,

en la que R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, SH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido,

o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_3-C_6), fenilo o heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, pudiendo los cuatro radicales mencionados en último término estar sin sustituir o sustituidos, y

en la que Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando $R^\#$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando

cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquiltio (C_1-C_6), halo-alquil (C_1-C_6)-tio, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, o fenilo sin sustituir o sustituido, y $\mathbf{R^0}$ y $\mathbf{R^\#}$, en común con el átomo de N del grupo $NR^\#R^0$ pueden formar un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo;

$\mathbf{R^3}$ significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, o fenilo sin sustituir o sustituido, y

$\mathbf{R^2}$ y $\mathbf{R^3}$ en común con el átomo de N del grupo NR^2R^3 (N^1), pueden formar un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales

tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en una posición contigua al átomo de N (N^1), y los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alqueniloxi (C_3-C_6), alquiniloxi (C_3-C_6), estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o hetrociclilo sin sustituir o sustituido, o

significan cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, fenilo sin sustituir o sustituido, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios átomos de halógeno, o significan un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', $S(O)_m$-Q^1-R'''', $P(O)_n$(-Q^1-R''''Q^2-R''), NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando **R'**, **R''** y **R'''**, independientemente unos de otros, un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, significando **R''''** un radical acilo que contiene carbono o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2, independientemente uno de otro, un enlace directo o

un grupo divalente de la fórmula —O- ó —N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y pudiendo ser **m** = 0, 1, 2 ó 3, así como **n** = 0, 1 ó 2, y pudiendo formar **R'** con **R''**, R^+ con **R'**, R^+ con **R''** ó R^+ con **R''''** en cada caso un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que puede estar sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0, 1 ó 2, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 es H o alquilo (C_1-C_4), que está sin sustituir o sustituido,

R^6 y R^7 independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

R^8 y R^9 independientemente uno de otro, significan alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo o, en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

Q es O, S ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo

(C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio y

R* y **R^1** en común con el átomo de N del grupo **NR^*R^1** pueden formar un radical heterociclilo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

X, Y independientemente uno de otro, significan H, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino, alquenilo (C_3-C_5), alquenil (C_3-C_5)-oxi, alquinilo (C_3-C_5) o alquinil (C_3-C_5)-oxi, y

teniendo los radicales **R^1, R^2, R^3** y **R^4**, inclusive los sustituyentes, en cada caso hasta 20 átomos de C.

3.- Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según la reivindicación 1 ó 2, en el que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, cicloalquilo (C_3-C_6), heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo y [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) o heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4),

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8),

alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3–C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1–C_4)]-carbonilo o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-

C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -$NR^{\#}$, en el que $R^{\#}$ es un átomo de hidrógeno o alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 y **R^3** en común con el átomo de N (N^1) pueden formar un heterociclo con 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o aromático, y adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), halógeno, [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_3) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1),

R^4 significa halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi, alquinil (C_3-C_6)-oxi,

estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o susti-

tuido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido, fenilo sin sustituir o sustituido o [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios átomos de halógeno, o significando un radical de la fórmula C(O)—NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando **R'**, **R''** y **R'''** independientemente unos de otros un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2 independientemente uno de otro un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido, y pudiendo formar **R'** con **R''** o R^+ con **R'** o R^+ con **R''** en cada caso un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0 ó 1,

R^6 y R^7, independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4), alquinilo (C_3-C_4), o fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 miembros de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados del

grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo,

R^8 y R^9 son alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, o en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo.

4.- Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 3, en el que

R^1 significa alquilo (C_1-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno y alcoxi (C_1-C_4), o
significa 3-oxetanilo, alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4),

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6),
estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o
significa cicloalquenilo (C_3-C_6), alcoxi (C_1-C_4), alquenil (C_1-C_4)-oxi, alquil (C_1-C_4)-amino o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino y

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6),
estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por

halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), o

R^2 y **R^3** en común con el átomo de N (N^1), pueden formar un heterociclo de 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o heteroaromático, que adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1), y

R^4 significa alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

R^5 significa H o metilo,

Q significa O ó NR*,

R* significa H o alquilo (C_1-C_4),

X e **Y** independientemente uno de otro, significan alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios átomos de halógeno, o significan alquil (C_1-C_4)-tio, halógeno o mono- o di-[alquil (C_1-C_2)]-amino, y

W significa un átomo de oxígeno.

5. Compuesto de la fórmula (I) o sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 4, en el que

R^1 significa alquilo (C_1-C_3), alilo o propargilo,

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

99

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^4 significa alquilo (C_1-C_3) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

Q significa O ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_3),

X significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), alquil (C_1-C_2)-tio, halo-alquilo (C_1-C_2) o halo-alcoxi (C_1-C_2),

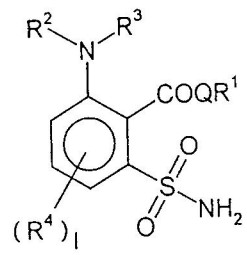
Y significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), halógeno, $NHCH_3$ ó $N(CH_3)_2$,

V significa CH ó N, preferiblemente N y

Z significa CH ó N.

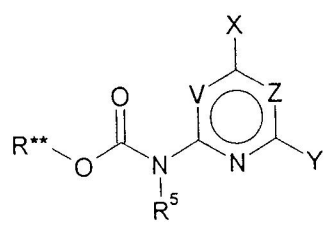
6.- Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula (I) o de sus sales como se definen en una o varias de las reivindicaciones 1 a 5, en el que

a) se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (II)



(II)

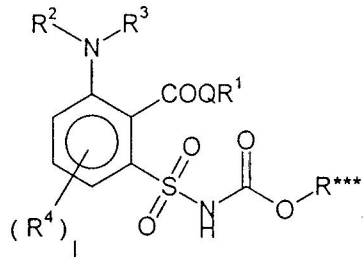
con un carbamato heterocíclico de la fórmula (III),



(III)

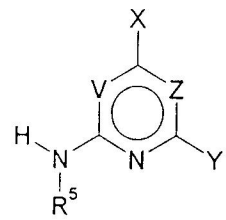
en la que **R**** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, o

b) se hace reaccionar un sulfonil-carbamato de la fórmula (IV)



(IV)

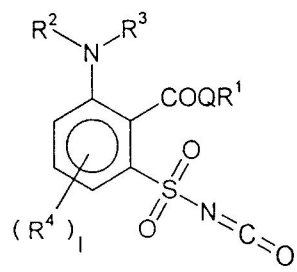
en la que **R***** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, con un amino-heterociclo de la fórmula (V)



(V)

o

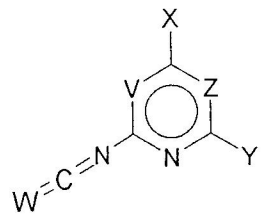
c) se hace reaccionar un sulfonil-isocianato de la fórmula (VI)



(VI)

con un amino-heterociclo de la fórmula (V), o

d) se hace reaccionar una sulfonamida de la fórmula (II) con un (tio)-isocianato de la fórmula (VII)

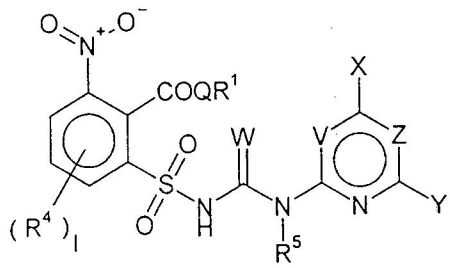


(VII)

en presencia de una base, o

e) se hace reaccionar un amino-heterociclo de la fórmula (V) en primer lugar de un modo catalizado por una base con un éster de ácido carbónico, y el compuesto intermedio formado se hace reaccionar en una reacción de un solo recipiente con una sulfonamida de la fórmula (II) (véase la variante a), o

f) se hace reaccionar una fenil-sulfonil-urea de la fórmula (VIII)



(VIII)

por reducción del grupo nitro, y eventualmente reacción ulterior de la función hidroxil-amino o amino puesta en libertad, para dar una sulfonil-urea de la fórmula (I) estando en las fórmulas (II)-(VIII) los radicales, grupos e índices **R^1-R^5, V, W, Y, Z** y **l** definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1.

7.- Agente herbicida o regulador del crecimiento de las plantas, que contiene a) por lo menos un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 5, y b) agentes coadyuvantes de formulaciones usuales en la protección de plantas.

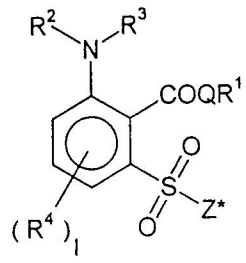
8.- Procedimiento para combatir plantas dañinas o para regular el crecimiento de plantas, aplicándose una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 5, sobre las plantas dañinas o sobre las plantas útiles, sus semillas de plantas o la superficie sobre la que crecen.

9.- Utilización de los compuestos de la fórmula (I) o sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 5 como agentes herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas.

10.- Utilización según la reivindicación 9, empleándose los compuestos de las fórmulas (I) o sus sales para combatir plantas dañinas o para regular el crecimiento en cultivos de plantas útiles u ornamentales.

11.- Utilización según la reivindicación 10, en que las plantas cultivadas son plantas cultivadas transgénicas.

12.- Compuesto de la fórmula (II*)

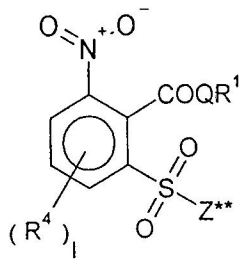


(II*)

en la que **Z*** = NH_2, NHCOOR***, NCO o NH-terc.-butilo, y R^1–R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1 y **R***** está definido como en la fórmula (IV) según la reivindicación 6.

13.- Utilización de un compuesto de la fórmula (II') como se define en la reivindicación 12, para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1.

14.- Compuesto de la fórmula (X*)



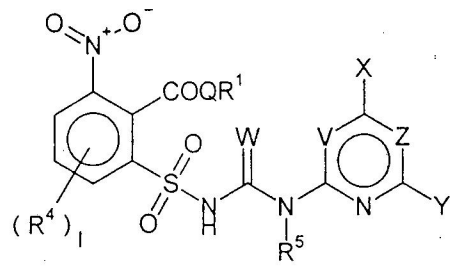
(X*)

en la que **Z**** significa = NH_2, NHCOOR***, NH-terc.-butilo o Cl y R^1, R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1 y **R***** está definido como en la fórmula (IV) según la reivindicación 6, y estando excluidos los compuestos en los que **Z**** es Cl, **l** = 0, **Q** = O y R^1 = H, metilo, etilo o alilo.

15.- Utilización de un compuesto de la fórmula (X') como se define en la reivindicación 14, en la que **Z**** es

igual a NH_2, NHCOOR*** o NH-terc.-butilo y **R***** está definido como en la fórmula (IV) según la reivindicación 6, para la preparación de un compuesto de la fórmula (II*) como se define en la reivindicación 12, en la que **Z*** es igual a NH_2, NHCOOR*** o NH-terc.-butilo.

16.- Compuestos de la fórmula (VIII)



(VIII)

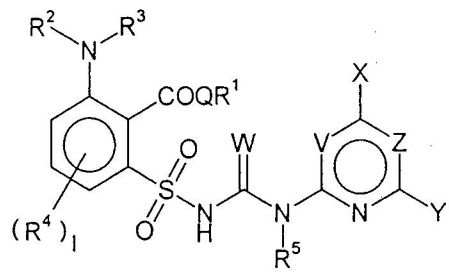
en la que **R^1**, **R^4**, **R^5**, **V**, **W**, **X**, **Y**, **Z** y **l** están definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1.

17.- Utilización de un compuesto de la fórmula (VIII) como se ha definido en la reivindicación 16, para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) como se ha definido en la reivindicación 1.

R E S U M E N

Fenil-sulfonil-ureas, procedimientos para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas

Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando **$R^\#$** un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin susti-

tuir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono, o un radical que contiene carbono,

l es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), preferiblemente H ó CH_3,

Q es O, S ó NR*,

R* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X, Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N,

se adecuan como herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas, p.ej. para combatir plantas dañinas en presencia de plantas cultivadas, también plantas cultivadas transgénicas. Se pueden preparar estos compuestos de acuerdo con procedimientos según la reivindicación 6 pasando en parte por productos intermedios nuevos (compárense los compuestos (II*) y (X*) y (VIII) según las reivindicaciones 12, 14 y 16).

106

107

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN

(21) No.SOLICITUD:

(22) FECHA DE PRESENTACIÓN:

(30) PRIORIDAD: SI

(31) No.DE SOLICITUD: 199 05 453.3

(32) FECHA DE PRESENTACIÓN: Febrero 10, 1999

(33) PAÍS: Alemania

(51) INT.CL.: C 07

(71) SOLICITANTE: HOECHST SCHERING AGREVO GmbH

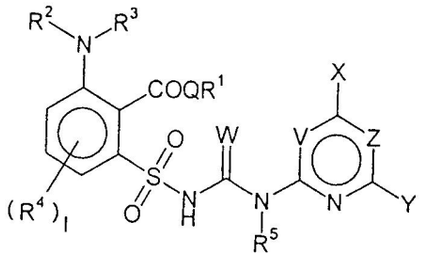
(72) INVENTOR(ES): Dr. Hansjörg DIETRIC(Kriftel, Alemania), Dr. Christian WALDRAFF(Frankfurt,Alemania), Dr. Lothar WILMS(Hofheim,Alemania), Dr. Hermann BIERINGER(Eppstein,Alemania), Dr Christopher ROSINGER(Hofheim,Alemania), Dr. Felix THURWÄCHTER(Bas Homburg,Alemania) y Dr. Thomas AULER(Bad Soden,Alemania).

(74) APODERADO: GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

(54) TÍTULO: "FENIL-SULFONIL-UREAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y SU UTILIZACION COMO HERBICIDAS Y REGULADORES DEL CRECIMIENTO DE LAS PLANTAS".

(57) RESUMEN:

Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átoos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^O-Q^O-, en la que R^O significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituidos y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, y Q^O significa un enlace directo o un grupo de la fórmula -O- ó -N($R^{\#}$)-, significando $R^{\#}$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical

heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono, o un radical que contiene carbono,

1 es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógreno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituír o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), preferiblemente H ó CH_3,

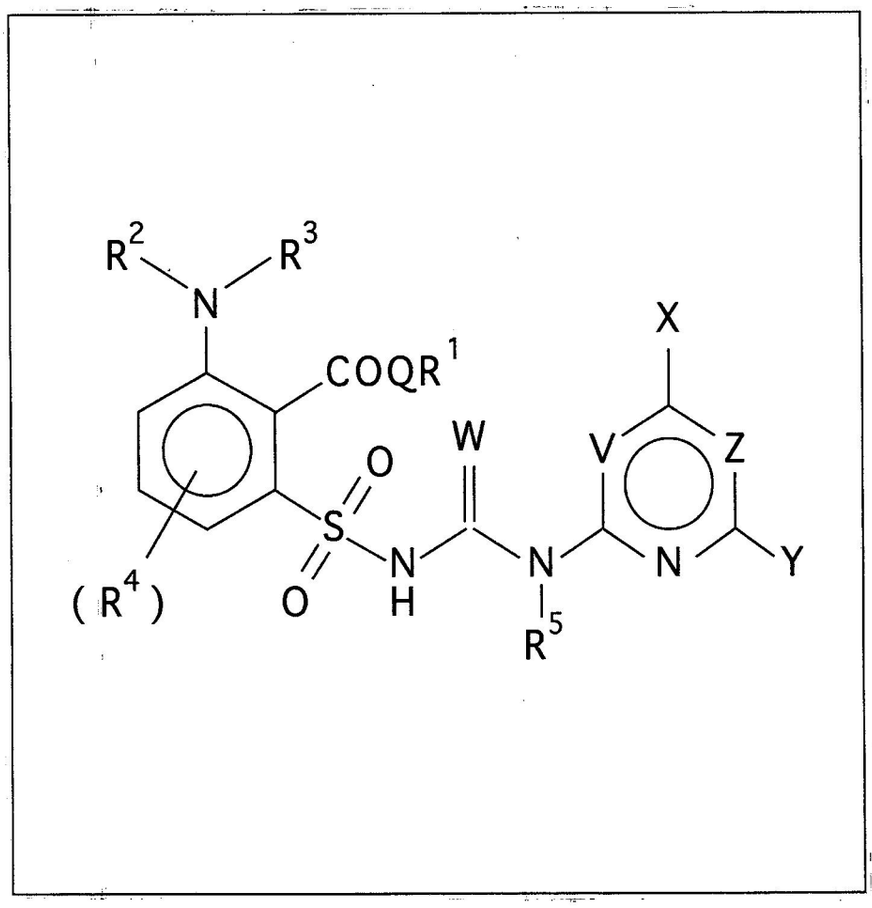
Q es O, S ó NR^*,

R^* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinio (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X y Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di- alquil (C_1-C_4) amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N, se adecuan como herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas, p.ej. para combatir plantas dañinas en presencia de plantascultivadas, también plantas cultivadas transgénicas. Se pueden preparar estos compuestos de acuerdo con procedimientos según la reivindicación 6 pasando en parte por productos intermedios nuevos (compárense los compuestos (II^*) y (X^*) y (VIII) según las reivindicaciones 12, 14 y 16).


R2
R3
N
COQR1
X
W
V
Z
O
S
N
N
Y
(R4)
O
H
R5

REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN/TRÁMITE

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00008334 00000030 Folios: 113
Fecha (AMD): 2000-02-09 15:39:55
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

110

114

Patente de Invención ☑	Modelo de Utilidad
☑ Nombre e identificación del solicitante	☐
☑ Nombre e identificación del inventor	☐
☑ Título o nombre de la invención	☐
☑ Descripción	☐
☑ Reivindicaciones	☐
☑ Resumen	☐
☑ Comprobante de pago	☐

COMPLETA ✓ INCOMPLETA

Diseño Industrial ☐

- ☐ Nombre e identificación del solicitante
- ☐ Nombre e identificación del inventor o diseñador
- ☐ Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse
- ☐ Representación gráfica
- ☐ Comprobante de pago

COMPLETA INCOMPLETA

FIRMA RESPONSABLE

Fecha _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 0-8334 .

Fecha: 10 de febrero del 2000 .

Se certifica que:

Desde fecha 15 de mayo de 1995 ,
del folio 80.969 al folio 80.964 del
libro de Protocolo N° _____ , obra el poder
N° 15.919 conferido por HOECHST SCHERING
AGREVO GmbH.

domiciliado(a) en Berlin - Alemania

al doctor GUSTAVO HOLLMAN RESTREPO

.

Representante en Santafé de Bogotá D.C. El
mismo .

Facultad para desistir SI .

Revisado _____.

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

112

2000-02-10
430

EXPEDIENTE 0-8334

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención:**

SI [x] **NO [ ]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a).

SI [x] **NO [ ]** **NO APLICABLE [ ]** Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94).

SI [x] **NO [ ]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000).

SI [x] **NO [ ]** **EXTEMPORANEAMENTE [ ]** Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris.

SI [ ] **NO [x]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional.

SI [ ] **NO [x]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.).

SI [ ] **NO [x]** **CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS**

OBSERVACIONES JURIDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, **en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses,** contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la perdida del derecho de prioridad.

OTRAS OBSERVACIONES: Debe presentar comprobante de pago por concepto de excedente de palabras,a partir de la 150 , en el extracto para publicación (articulo Primero de la Resolución 02 del 2000).

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

SI [ ] **NO [x]** Se ajusta a los aspectos **FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,

[ ] **NO [x]** Se recomienda **PUBLICAR** el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D.C.,10 de febrero del 2000.

EXAMINADOR JURIDICO: Código 202002

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia

Folio 117

113

2000-02-25
430

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES

Primer **EXAMEN DE FORMA**

RADICACIÓN Nº 0-8334

CONCEPTO TÉCNICO Nº 308 **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL DE PATENTES** A01N4'/36

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención:**

SI ☒ NO ☐	Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a).
SI ☒ NO ☐	Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a).
SI ☒ NO ☐	Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e).
SI ☐ NO ☒	Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b).
SI ☐ NO ☒	Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c).
SI ☒ NO ☒	Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94).
SI ☐ NO ☒	Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980).
SI ☐ NO ☒	Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d).
SI ☒ NO ☐	Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94.
SI ☒ NO ☐	Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94.
SI ☒ NO ☐	Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
SI ☒ NO ☐	Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
SI ☐ NO ☒	**CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 25-02-00

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
1er examen de forma

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

118

CONCEPTO TÉCNICO No. 308
EXPEDIENTE No. 0-8334 A01N47/36

En el folio 28 de la descripción hay un error de escritura por lo tanto se debe corregir. Así mismo en el folio 64 no es claro cuando se indica la fórmula del butileno puesto que no corresponde al mismo; en los folios 76 y 77, a partir del compuesto 1-429 los significados del radical R2 no son claros, no se entiende si corresponde a un ciclo o a un alifático puesto que no está cerrado dicho ciclo.

Las unidades de área se deben expresar según el Sistema Internacional de unidades (SI).

En la reivindicación 6 falta nombrar al final de la reivindicación la definición el radical X, así como se nombraron los demás.

La reivindicación 7 no está definiendo realmente ningún agente herbicida puesto que a él no sólo lo definen sus componentes sino la proporción en que se encuentran.

Respecto a las reivindicaciones 9, 10, 11, 13, 15 y 17 es de anotar que el artículo 1° de la Decisión 344 del Acuerdo de Cartagena dice que se otorgarán patentes para las invenciones sean de productos o de procedimientos, por lo tanto la utilización o el uso no es patentable.

La reivindicación 14 relacionada con un compuesto de fórmula X* se encuentra por fuera del objeto de la solicitud puesto que los compuestos intermedios sólo se aceptan en la medida en que son necesarios en el procedimiento reivindicado objeto de la solicitud.

Modificar el título indicando que se trata de fenilsulfonilúreas, procedimientos para su preparación y agentes herbicidas o reguladores del crecimiento.

De acuerdo a lo anterior se deben hacer las correcciones respectivas presentando **NUEVO capítulo reivindicatorio COMPLETO** de forma que sea claro y preciso.
Anexar nuevo extracto con el resumen corregido y tarjetas archivo temático y de propietarios.

CÓDIGO 202001
Examinador Técnico de Patentes

Santa Fe de Bogotá, D.C. 25 febrero de 2000

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

115

2000-03-02 430

EXPEDIENTE 0-8334

AUTO 0345

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor Gustavo Hollmann Restrepo, como apoderado del solicitante, en los términos y para los efectos del poder conferido

ARTICULO SEGUNDO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérese al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complemente los antecedentes señalados en el examen de forma.

ARTICULO TERCERO: Notificar por estado el presente auto, advirtiendo que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE
Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los 29 FEB. 2000

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 02 MAR 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI____ NO____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia