Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SOLICITUD D

00 68183

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

No. de Identificación:

Representante Legal (Persona Jurídica):

País de Domicilio: Alemania

Departamento o Estado:

Dirección: D- 51368, Leverkusen

Ciudad:

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre: EMILIO FERRERO

Dirección y Domicilio: Carrera 4 no 72-35 piso 4o.,

Ciudad: BOGOTA COLOMBIA

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

1- Dr Hans-Jochem RIEBEL
2- Dr Stefan LEHR
3- Dr Kristian KATHER
4- Dr Stefan HERRMANN
5- Dr Mark-Wilhelm DREWES
6- Dr Peter DAHMEN
7- Dr Dieter FEUCHT
8- Dr Rolf PONTZEN
9- Dr Yukiyoshi WATANABE
10- Toshio GOTO

Identificación:

Dirección:

1- Heimatstr 1, 56242 Selters, Alemania
2- Ricarda-Huch-Str 36, 40764, Langenfeld, Alemania
3- Grabenstr.21, 40789 Monheim, Alemania
4- Vimeburgstr 4a, 40764 Langenfeld, Alemania
5- Goethestr.38, 40764 Langenfeld, Alemania

Ciudad: Continua hoja anexa

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

ARILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS

PRIORIDAD REIVINDICADA SI ☒ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País: DE. Convención de París.

Fecha: 04 de Agosto de 1999

No. Solicitud: 199 36 633.0

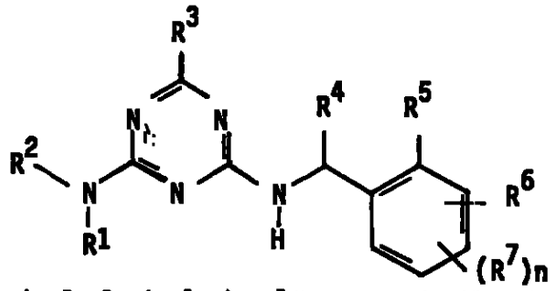
Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

Colo:00698 801 119 0
JB/Mrh- Id 828

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL: A01N 043/066 -2 FEB 2000

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



(I)

en la que n, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en la descripción. A un procedimiento y a productos intermedios para su obtención y a su empleo com herbicidas.

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	☒
Recibo de la tasa respectiva por v/r de $608.000.=	☒
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:	
Copia certificada de la primera solicitud: Alemania No. 199 36 633.0	☒
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	☒
Dibujos, planos necesarios	☐
Capítulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propietarios según formato	☒
Tarjeta archivo temático según formato	☒
Extracto para publicación según formato	☒
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 EMILIO FERRERO CC. 438.019 de Usaquén T.P.No. 31.929

Continuación domicilio inventores :

6- Altebrückerst.61, 41470 Neuss, Alemania
7- Ackerweg 9, 40789 Monheim, Alemania
8- Am Kloster 69, 42799 Leichlingen, Alemania
9- Hanagaki-cho, 2-8-24, Oyama-shi, Tochigi 323, Japón
10- Koganei 214-18, Kokubunji-machi, Shimotsuga-gun, Tochigi 329-04, Japón

COLOMBIA

LeA 33909-CO.

MEMORIA DESCRIPTIVA

Sobre:

ARILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.

Solicitante.- BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana.

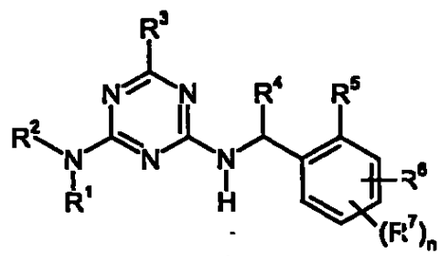
Residente.- D-51368, Leverkusen, República Federal de Alemania.

ARILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas arilalquilaminas-1,3,5-triazinas substituidas, a un procedimiento y a nuevos productos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se conoce ya una serie de arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas por la literatura (de patentes) (véanse las US-A-3816419, US-A3932167, EP-A-19146, EP-A-273328, EP-A-411153 / WO-A-90/09378, WO-A-98/15536, WO-A-98/42684 JP-A-62294669 – citado en Chem. Abstracts 109:129062v, JP-A-63051379 – citada en Chem. Abstracts 109:231079). Sin embargo estos compuestos no han adquirido hasta el presente ningún significado especial.

Se han encontrado ahora nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



(I)

en la que

n significa los números 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R^2 significa hidrógeno, significa formilo, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo o alquilaminocarbonilo con, respectivamente, 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa también dialquilaminoalquilidenamino con 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo o bien en los grupos alquilideno,

R^3 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituido en caso dado por hidroxi, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-sulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^4 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^5 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino o dialquilamino respectivamente con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y –en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, o dialquil-amino con respectivamente 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo,

substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, y

R^7 significa halógeno o significa alquilo o alcoxi con, respectivamente, 1 a 3 átomos de carbono.

Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas indicadas anteriormente o que se indicarán a continuación, se describen seguidamente.

Preferentemente,

n significa los números 0, 1, 2 o 3.

Preferentemente,

R^1 significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R^2 significa hidrógeno, formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$, significa, preferentemente, también dimetilaminometilenamino o dietilaminometilenamino.

Preferentemente,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por hidroxi, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo,

por n- o i-butiroilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

Preferentemente,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo.

Preferentemente,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y -en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno.

Preferentemente,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-

propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

De forma especialmente preferente,

n significa los números 0, 1 o 2.

De forma especialmente preferente,

R^1 significa hidrógeno, metilo o etilo.

De forma especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, formilo, metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa, preferentemente también, dimetilamino-metilenamino.

De forma especialmente preferente,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por acetilo, por propionilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro o por metilo.

De forma especialmente preferente,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado

por flúor o por cloro, o significa ciclopropilo, substituido respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, o por metilo.

De forma especialmente preferente,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa también hidrógeno.

De forma especialmente preferente,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, o etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

n significa los números 0 o 1.

De forma muy especialmente preferente,

R^1 significa hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, formilo, acetilo o propionilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa, preferentemente, también dimetilamino-metilenamino.

De forma muy especialmente preferente,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R^4 significa metilo o etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa también hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino.

De forma muy especialmente preferente,

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

Un grupo especialmente preferente son los compuestos de la fórmula general (I), en los cuales los substituyentes en el átomo de carbono, con el que está enlazado R^4, estén dispuestos en la configuración R.

Otro grupo especialmente preferente son los compuestos de la fórmula general (I) en los cuales los substituyentes en el átomo de carbono, con el que está enlazado R^4, estén dispuestos en la configuración S.

Las definiciones de los restos, dadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los productos de partida o los productos intermedios necesarios respectivamente para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Según la invención son preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera especialmente preferente.

Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

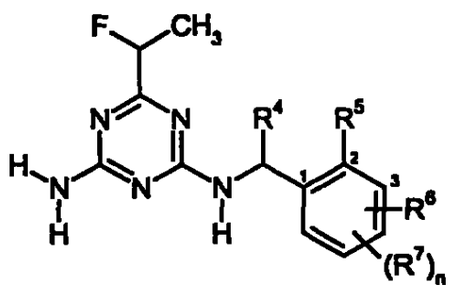
Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados tales como alquilo, son –incluso en combinación con heteroátomos, como en alcoxi- en tanto en cuanto sea posible, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los restos substituidos en caso dado pueden estar mono o polisubstituidos, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en el caso de una polisubstitución

Los grupos alquilo en la definición de R^3 pueden contener en caso dado también átomos de carbono substituidos de manera asimétrica En estos casos se reivindicarán según la invención tanto las formas respectivamente posibles R y S así como también las mezclas de las mismas

Ejemplos de compuestos según la invención de la fórmula (I) se han indicado en los grupos siguientes

Grupo 1



En este caso R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$, tienen, de manera ejemplificativa, los significados indicados en la tabla siguiente

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
CH_3	F	(3) F	-
C_2H_5	F	(3) F	-
CH_3	F	(3) Cl	-
C_2H_5	F	(3) Cl	-
CH_3	F	(3) Br	-
C_2H_5	F	(3) Br	-
CH_3	F	(3) CH_3	-
C_2H_5	F	(3) CH_3	-
CH_3	F	(3) OCH_3	-
C_2H_5	F	(3) OCH_3	-
CH_3	F	(3) SCH_3	-
C_2H_5	F	(3) SCH_3	-
CH_3	F	(3) $SOCH_3$	-
C_2H_5	F	(3) $SOCH_3$	-
CH_3	F	(3) SO_2CH_3	-
C_2H_5	F	(3) SO_2CH_3	-
CH_3	F	(3) CF_3	-
C_2H_5	F	(3) CF_3	-
CH_3	F	(3) OCF_3	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	F	(3) OCF_3	-
CH_3	F	(3) SCF_3	-
C_2H_5	F	(3) SCF_3	-
CH_3	Cl	(3) F	-
C_2H_5	Cl	(3) F	-
CH_3	Cl	(3) Cl	-
C_2H_5	Cl	(3) Cl	-
CH_3	Cl	(3) Br	-
C_2H_5	Cl	(3) Br	-
CH_3	Cl	(3) CH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	-
CH_3	Cl	(3) OCH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	-
CH_3	Cl	(3) SCH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SCH_3	-
CH_3	Cl	(3) $SOCH_3$	-
C_2H_5	Cl	(3) $SOCH_3$	-
CH_3	Cl	(3) SO_2CH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SO_2CH_3	-
CH_3	Cl	(3) CF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) CF_3	-
CH_3	Cl	(3) OCF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) OCF_3	-
CH_3	Cl	(3) SCF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SCF_3	-
CH_3	CH_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	-
CH_3	CH_3	(3) F	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	CH_3	(3) F	-
CH_3	CH_3	(3) Cl	-
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	-
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	-
CH_3	CH_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) CF_3	-
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	-
CH_3	OCH_3	(3) F	-
C_2H_5	OCH_3	(3) F	-
CH_3	OCH_3	(3) Cl	-
C_2H_5	OCH_3	(3) Cl	-
CH_3	OCH_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) OCH_3	-
CH_3	OCH_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) CF_3	-
CH_3	CF_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) CF_3	-
CH_3	CF_3	(3) F	-
C_2H_5	CF_3	(3) F	-
CH_3	CF_3	(3) Cl	-
C_2H_5	CF_3	(3) Cl	-
CH_3	CF_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) CH_3	-
CH_3	CF_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) OCH_3	-
CH_3	F	(4) F	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	F	(4) F	-
CH_3	F	(4) Cl	-
C_2H_5	F	(4) Cl	-
CH_3	F	(4) Br	-
C_2H_5	F	(4) Br	-
CH_3	F	(4) CH_3	-
C_2H_5	F	(4) CH_3	-
CH_3	F	(4) OCH_3	-
C_2H_5	F	(4) OCH_3	-
CH_3	F	(4) SCH_3	-
C_2H_5	F	(4) SCH_3	-
CH_3	F	(4) $SOCH_3$	-
C_2H_5	F	(4) $SOCH_3$	-
CH_3	F	(4) SO_2CH_3	-
C_2H_5	F	(4) SO_2CH_3	-
CH_3	F	(4) CF_3	-
C_2H_5	F	(4) CF_3	-
CH_3	F	(4) OCF_3	-
C_2H_5	F	(4) OCF_3	-
CH_3	F	(4) SCF_3	-
C_2H_5	F	(4) SCF_3	-
CH_3	Cl	(4) F	-
C_2H_5	Cl	(4) F	-
CH_3	Cl	(4) Cl	-
C_2H_5	Cl	(4) Cl	-
CH_3	Cl	(4) Br	-
C_2H_5	Cl	(4) Br	-
CH_3	Cl	(4) CH_3	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	Cl	(4) CH_3	-
CH_3	Cl	(4) OCH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) OCH_3	-
CH_3	Cl	(4) SCH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SCH_3	-
CH_3	Cl	(4) $SOCH_3$	-
C_2H_5	Cl	(4) $SOCH_3$	-
CH_3	Cl	(4) SO_2CH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SO_2CH_3	-
CH_3	Cl	(4) CF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) CF_3	-
CH_3	Cl	(4) OCF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) OCF_3	-
CH_3	Cl	(4) SCF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SCF_3	-
CH_3	CH_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	C_2H_5	(4) CH_3	-
CH_3	CH_3	(4) F	-
C_2H_5	CH_3	(4) F	-
CH_3	CH_3	(4) Cl	-
C_2H_5	CH_3	(4) Cl	-
CH_3	CH_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	CH_3	(4) OCH_3	-
CH_3	CH_3	(4) CF_3	-
C_2H_5	CH_3	(4) CF_3	-
CH_3	OCH_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) OCH_3	-
CH_3	OCH_3	(4) F	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	OCH_3	(4) F	-
CH_3	OCH_3	(4) Cl	-
C_2H_5	OCH_3	(4) Cl	-
CH_3	OCH_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) CH_3	-
CH_3	OCH_3	(4) CF_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) CF_3	-
CH_3	CF_3	(4) F	-
C_2H_5	CF_3	(4) F	-
CH_3	CF_3	(4) Cl	-
C_2H_5	CF_3	(4) Cl	-
CH_3	CF_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	CF_3	(4) CH_3	-
CH_3	CF_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	CF_3	(4) OCH_3	-
CH_3	F	(4) F	(5) F
C_2H_5	F	(4) F	(5) F
CH_3	H	(3) F	(4,5) F_2
C_2H_5	H	(3) F	(4,5) F_2
CH_3	F	(3) F	(5,6) F_2
C_2H_5	F	(3) F	(5,6) F_2
CH_3	F	(3) F	(4,5,6) F_3
C_2H_5	F	(3) F	(4,5,6) F_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) F
CH_3	F	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) F
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) F

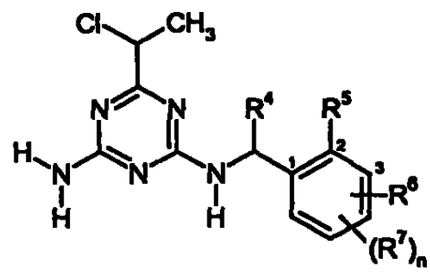
R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	F	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) F	(4) Cl
CH_3	F	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) F	(4) CH_3
CH_3	F	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	F	(3) Cl	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) CH_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	F	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	F	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) CH_3
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) F	(4) Cl

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) F
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) F	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) F
CH_3	Cl	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) CH_3
CH_3	Cl	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) F
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) F	(4) CH_3

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) F
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) F	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) F
CH_3	CH_3	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3

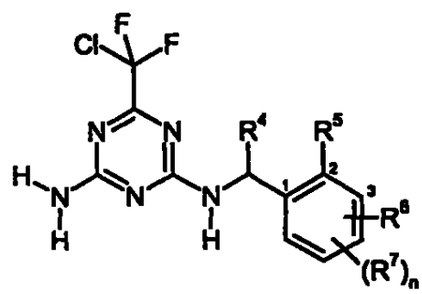
R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	OCH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) F
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) F
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) F
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) Cl
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) CH_3

Grupo 2



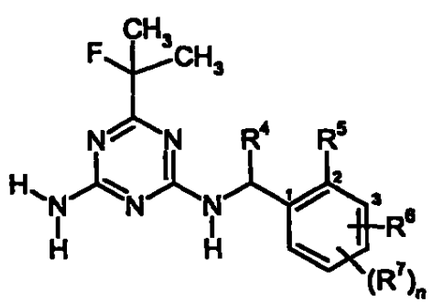
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1

Grupo 3



En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1

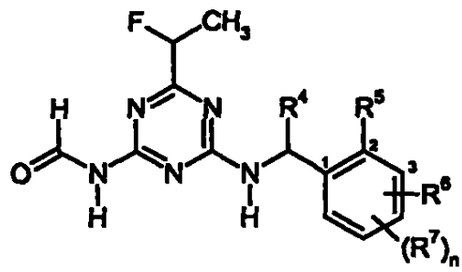
Grupo 4



En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados

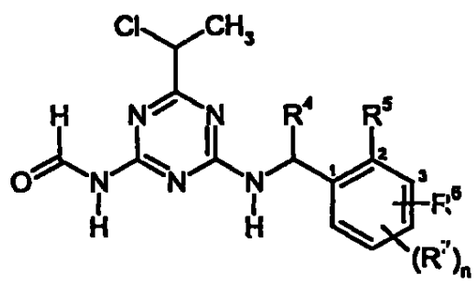
anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 5.



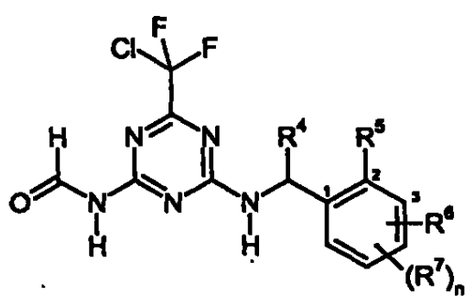
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 6.



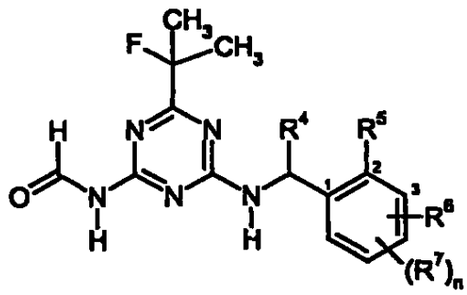
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 7.



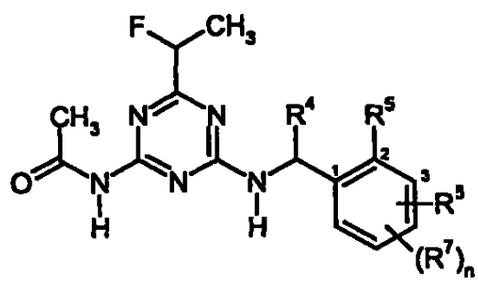
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 8.



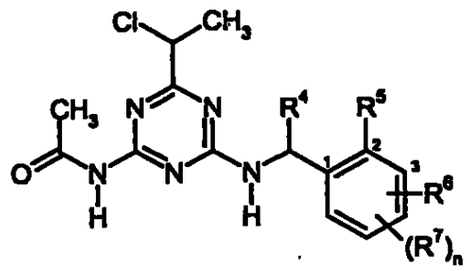
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 9.



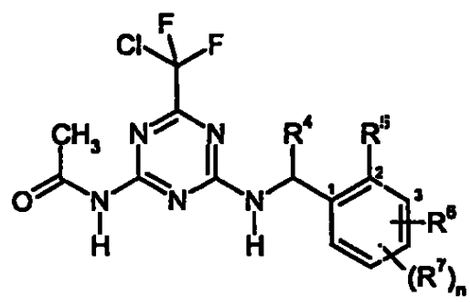
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 10.



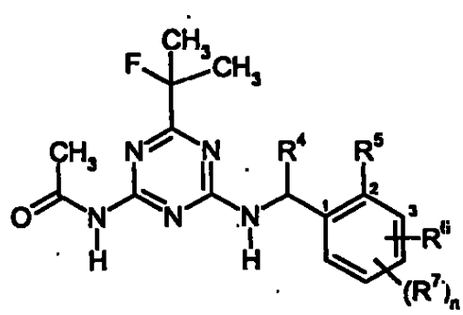
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 11.



En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 12.

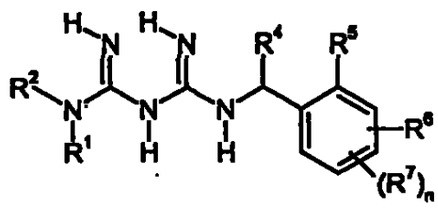


En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados

anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Las nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I) presentan interesantes propiedades biológicas. Se caracterizan especialmente por una potente actividad herbicida.

Se obtienen las nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I), si se hacen reaccionar biguanidas de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado anteriormente indicado,

-y/o aductos de ácido de los compuestos de la fórmula general (II)-

con compuestos de alcoxicarbonilo de la fórmula general (III)

$$R^3\text{-CO-OR'} \qquad \text{(III)}$$

en la que

R^3 tiene el significado anteriormente indicado y

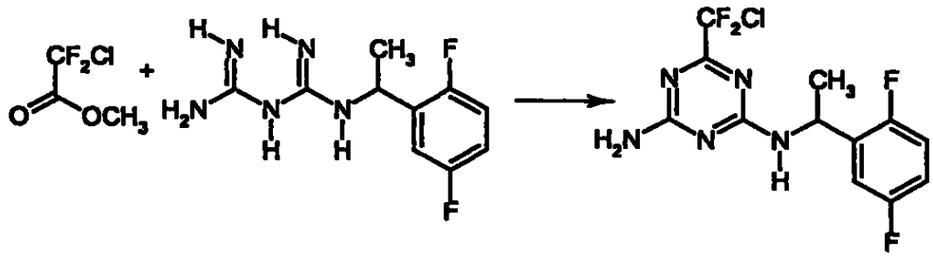
R' significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y, en caso dado, se llevan a cabo en los compuestos de la fórmula general (I), obtenidos de este modo, en el ámbito de la definición de los substituyentes, otras transformaciones según métodos usuales.

Si se emplean, por ejemplo, la 1-[1-(2,5-diflúor-fenil)-etil]-biguanida y clorodiflúoracetato de metilo como productos de partida, podrá esquematizarse el

desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:

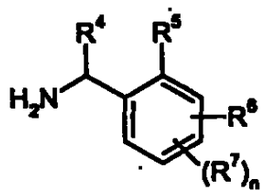


Las biguanidas, a ser empleadas como productos de partida en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

Los aductos de ácido adecuados de los compuestos de la fórmula (II) son sus productos de adición con ácidos protónicos, tal como, por ejemplo, con ácido clorhídrico (cloruro de hidrógeno), ácido bromhídrico (bromuro de hidrógeno), ácido sulfónico, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico y ácido p-toluenosulfónico.

Los productos de partida de la fórmula general (II) no son todavía conocidos por la literatura; éstos constituyen, a modo de productos nuevos, también un objeto de la presente solicitud.

Se obtienen las nuevas biguanidas de la fórmula general (II), si se hacen reaccionar arilalquilaminas de la fórmula general (IV),



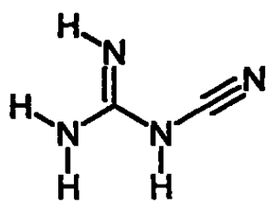
(IV)

en la que

n, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado anteriormente indicado,

-y/o aductos de ácido de los compuestos de la fórmula general (IV), tales como por ejemplo los hidrocloruros-

con cianoguanidinas ("dicianodiamida") de la fórmula (V).



(V)

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción, tal como por ejemplo cloruro de hidrógeno, en caso dado en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo n-decano o 1,2-dicloro-benceno, a temperaturas comprendidas entre 100°C y 200°C (véanse los ejemplos de obtención).

Las biguanidas de la fórmula general (II) pueden emplearse en el procedimiento según la invención tras su obtención incluso sin aislamiento intermedio, directamente para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I).

Las arilalquilaminas, necesarias como productos de partida, de la fórmula general (IV) son conocidas y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las DE-A-3819438, DE-A-19650081, EP-A-551821, EP-A-

736509, EP-A-778260, US-A-5739401).

Los compuestos de alcoxicarbonilo, a ser empleados, además como productos de partida, en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general, por medio de la fórmula (III). En la fórmula general (III), R^3 tiene preferentemente o bien especialmente aquel significado que ya ha sido indicado anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R^3 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I); preferentemente R' significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente significa metilo o etilo.

Los productos de partida de la fórmula general (III) son productos químicos para síntesis conocidos.

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo preferentemente con empleo de un diluyente. Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención entran en consideración, además de agua, ante todo disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; aminas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo,

sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido, alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o agua pura.

Como productos auxiliares de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración en general las bases o aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A éstos pertenecen, preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como por ejemplo acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio; además también compuestos nitrogenados orgánicos básicos, tales como por ejemplo trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, diciclohexilamina, etil-diciclohexilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabiciclo-[2.2.2]-octano (DABCO), 1,5-diazabiciclo[4.3.0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabiciclo[5.4.0]-undec-7-eno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

El procedimiento según la invención se lleva a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida –en general comprendido entre 0,1 bar y 10 bares-.

Para la realización del procedimiento según la invención se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las substancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

Malas hierbas dicotiledóneas de las clases: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala,

Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

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

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-anuales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocoti-ledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, o

ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenadas de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixiviaciones sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrociánico y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y

nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden encontrar aplicación como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo: Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop-(etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid,

Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrsulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen, Haloxyfop(-etoxietilo), Haloxyfop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyrithiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbuthylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron

(-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin y Triflusulfuron.

También es posible una mezcla con otras substancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas, substancias protectoras contra la ingestión por pájaros, substancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

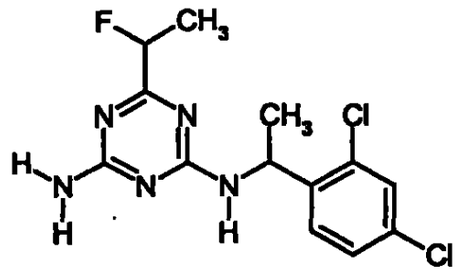
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

La obtención y el empleo de las substancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

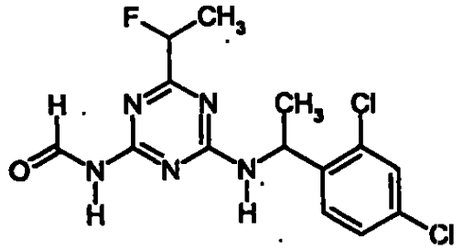
Ejemplo 1:



Se añade una solución de 3,6 g (66 mmoles) de metilato de sodio en 60 ml de metanol, a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C) bajo agitación, a una mezcla constituida por 19,0 g (60 mmoles) de hidrocloruro de 1-[1(2,4-dicloro-fenil)-etil]-biguanida (racémico), 9,0 g (60 mmoles) de 2-flúor-propanoato de metilo y 85 ml de metanol. La mezcla de la reacción se agita durante 15 horas a temperatura ambiente y a continuación se diluye hasta aproximadamente un volumen tres veces mayor mediante adición lenta de agua. El producto cristalino que precipita en este caso se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 5,7 g (29 % de la teoría) de la 6-(1-flúor-etil)-N^2-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina (racemato) con un punto de fusión de 122°C.

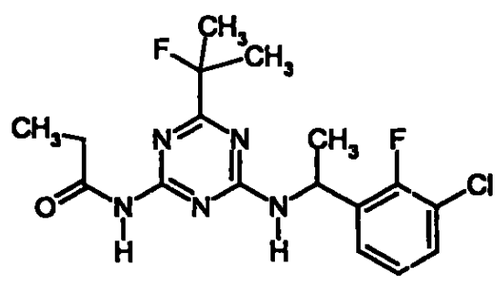
Ejemplo 2.



Se agita durante 15 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C) una mezcla constituida por 3,0 g (9 mmoles) de la 6-(1-flúor-etil)-N^2-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina (racémica), 1,5 g (9 mmoles) de dimetilacetal de la N,N-dimetil-formamida y 40 ml de 1,4-dioxano. Tras adición de 80 ml de agua y 3 ml de ácido clorhídrico concentrado, se agita la mezcla durante otros 30 minutos a la temperatura ambiente. A continuación se aísla el producto cristalino formado mediante filtración por succión.

Se obtienen 1,4 g (43 % de la teoría) de la N-{4-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil-amino]-6-(1-flúor-etil)-1,3,5-triazin-2-il}-formamida (racemato) con un punto de fusión de 172°C.

<u>Ejemplo 3.</u>



Se agita durante 30 minutos a 130°C una mezcla constituida por 3,0 g (9 mmoles) de la 6-(1-flúor-1-metil-etil)-N^2-[1-(3-cloro-2-flúor-fenil)-etil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina y 15 ml de anhidrido del ácido propiónico. A continuación se eliminan cuidadosamente por destilación las partes volátiles bajo presión reducida. El residuo se digiere con 20 ml de etanol y el producto cristalino formado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 3,1 g (89 % de la teoría) de la amida del ácido N-{4-[1-(3-cloro-2-flúor-fenil)-etilamino]-6-(1-flúor-1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2-il}-propiónico

(racemato) con un punto de fusión de 130°C.

De manera análoga a la de los ejemplos 1 a 3 así como de acuerdo con la descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla siguiente.

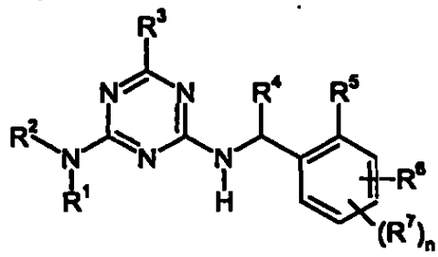
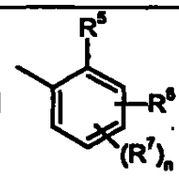
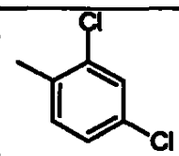
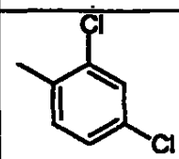
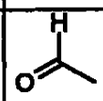
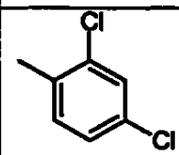
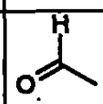
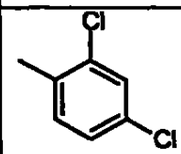
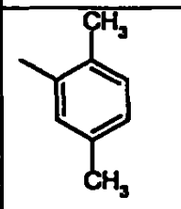
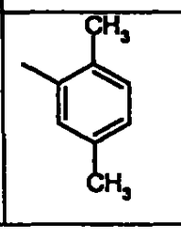
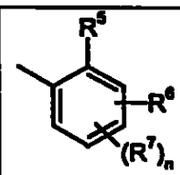
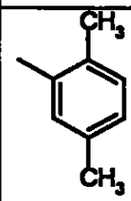
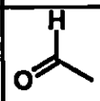
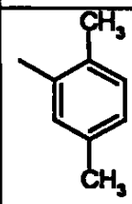
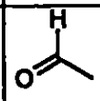
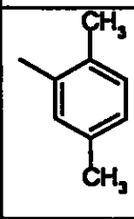
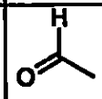
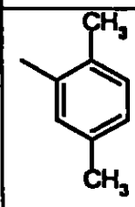
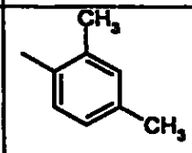
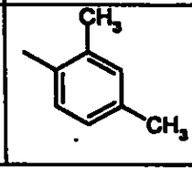
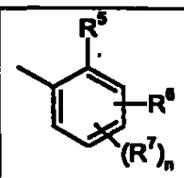
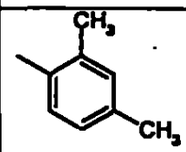
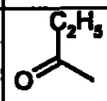
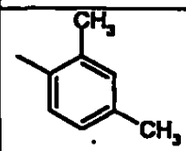
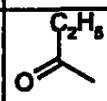
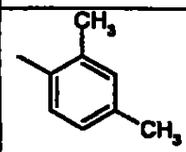
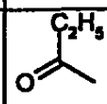
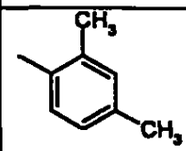
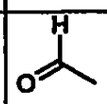
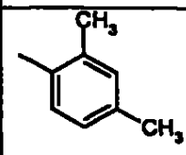
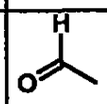
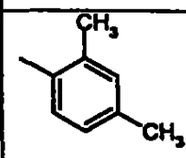
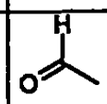
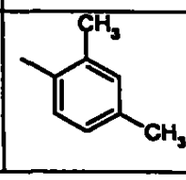
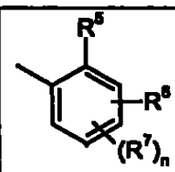
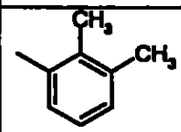
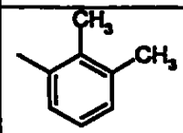
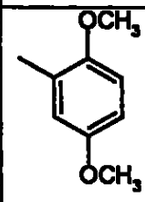
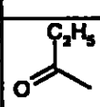
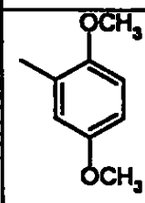
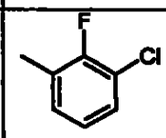
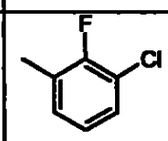
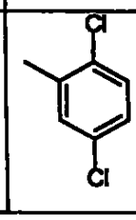


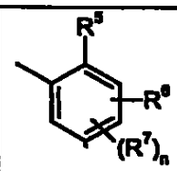
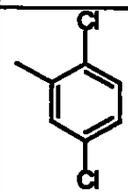
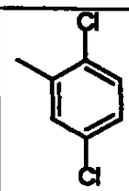
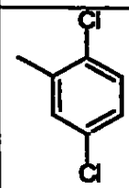
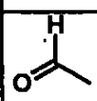
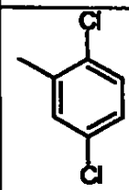
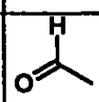
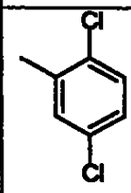
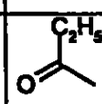
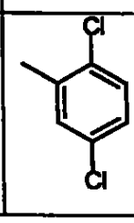
Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I).

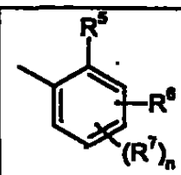
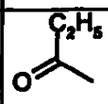
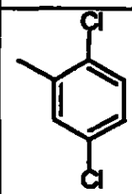
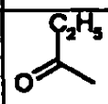
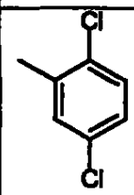
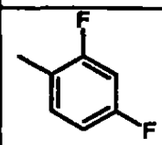
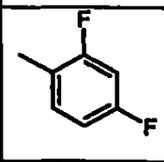
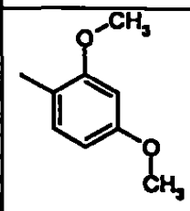
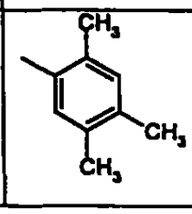
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
4	H	H	CF_2Cl	CH_3		Fp.: 75°C (Racemato)
5	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 154°C (Racemato)
6	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 148°C (Racemato)
7	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 201°C (Racemato)
8	H	H	CF_2Cl	CH_3		logP = 3,28 [a)] (Racemato)
9	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,89 [a)] (Racemato)

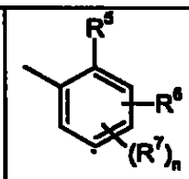
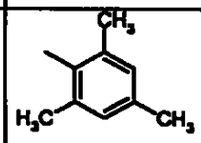
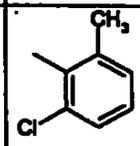
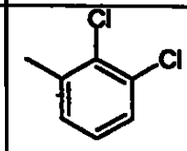
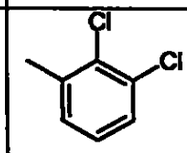
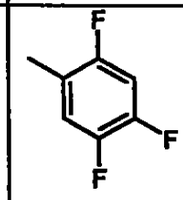
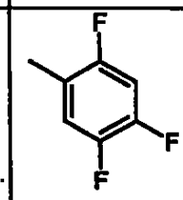
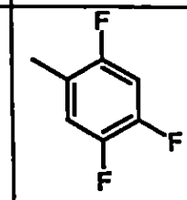
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
10	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,95 [a)] (Racemato)
11	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 212°C (Racemato)
12	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 202°C (Racemato)
13	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 177°C (Racemato)
14	H	H	CF_2Cl	CH_3		logP = 3,30 [a)] (Racemato)
15	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 88°C (Racemato)

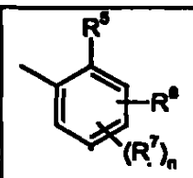
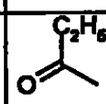
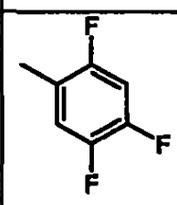
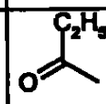
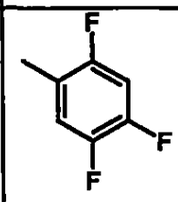
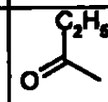
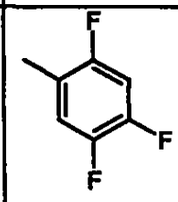
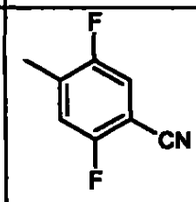
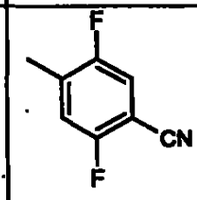
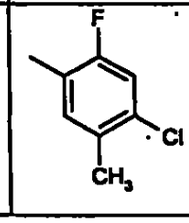
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
16	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 109°C (Racemato)
17	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 147°C (Racemato)
18	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 132°C (Racemato)
19	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 163°C (Racemato)
20	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 193°C (Racemato)
21	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 197°C (Racemato)
22	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 224°C (Racemato)

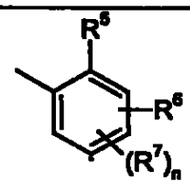
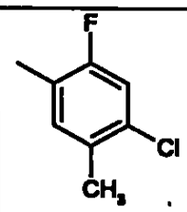
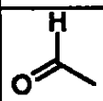
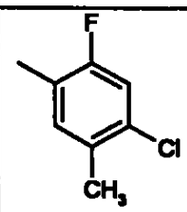
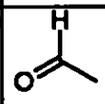
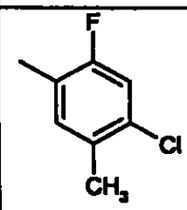
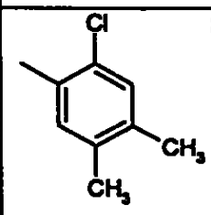
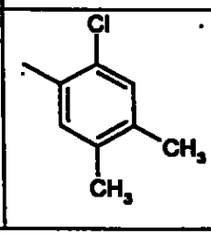
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
23	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,84 [a)] (Racemato)
24	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,97 [a)] (Racemato)
25	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,55 [a)] (Racemato)
26	H		$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,49 [a)] (Racemato)
27	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,94 [a)] (Racemato)
28	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,00 [a)] (Racemato)
29	H	H	CF_2Cl	CH_3		Fp.: 64°C (Racemato)

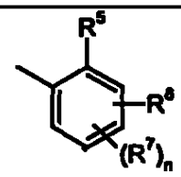
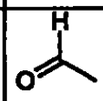
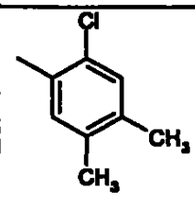
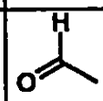
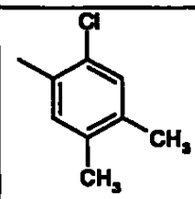
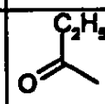
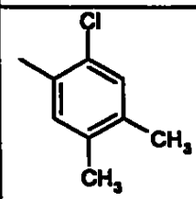
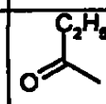
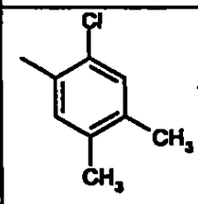
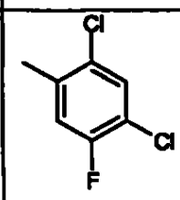
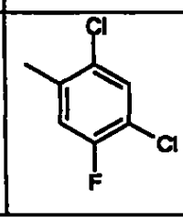
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos.y estereo-químicos
30	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,14 [a)] (Racemato)
31	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,20 [a)] (Racemato)
32	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 202°C (Racemato)
33	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 208°C (Racemato)
34	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 195°C (Racemato)
35	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 159°C (Racemato)

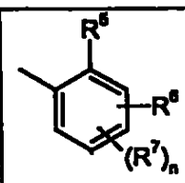
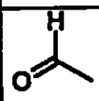
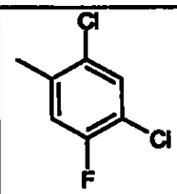
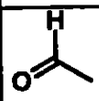
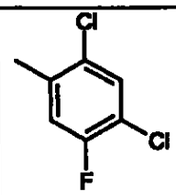
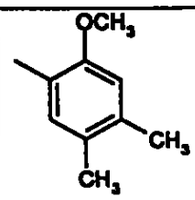
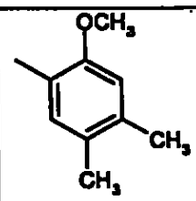
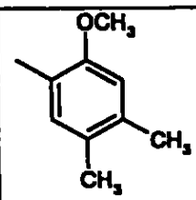
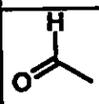
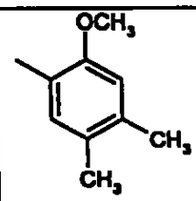
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
36	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 158°C (Racemato)
37	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 199°C (Racemato)
38	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
39	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
40	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
41	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)

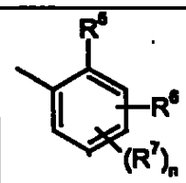
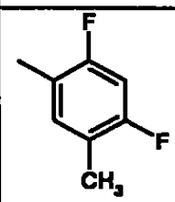
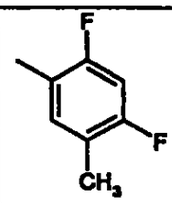
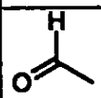
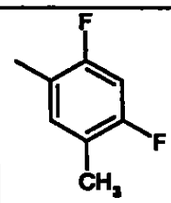
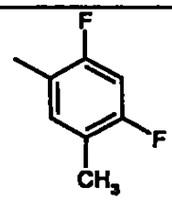
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
42	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
43	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
44	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,14 [a)] (Racemato)
45	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 173°C (Racemato)
46	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,84 [a)] (Racemato)
47	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,92 [a)] (Racemato)
48	H	H	$CHClCH_3$	CH_3		logP = 2,33 [a)] (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
49	H		$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,76 [a)] (Racemato)
50	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 3,05 [a)] (Racemato)
51	H		$CHClCH_3$	CH_3		logP = 3,22 [a)] (Racemato)
52	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,67 [a)] (Racemato)
53	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,75 [a)] (Racemato)
54	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
55	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,25 [a)] (Racemato)
56	H		$CHFCH_3$	CH_3		logP = 3,08 [a)] (Racemato)
57	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 3,43 [a)] (Racemato)
58	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(Racemato)
59	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,29 [a)] (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
60	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 204°C (Racemato)
61	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 184°C (Racemato)
62	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 157°C (Racemato)
63	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 137°C (Racemato)
64	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		
65	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
66	H		$CHFCH_3$	CH_3		
67	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		
68	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		
69	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		
70	H		$CHFCH_3$	CH_3		
71	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
72	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		
73	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		
74	H		$CHFCH_3$	CH_3		
75	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		

La determinación de los valores logP, indicados en la tabla 1, se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18) temperatura: 43°C.

(a) Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido: ácido fosfórico acuoso al 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo

hasta 90 % de acetonitrilo –los resultados de medida correspondientes se han marcado en la tabla 1 con [a].

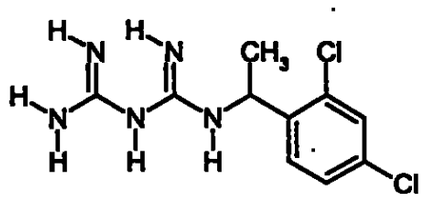
(b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución acuosa de tampón de fosfato 0,01 molar, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo –los resultados de medida correspondientes se han marcado en la tabla 1 con [b].

El calibrado se llevó a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre 2 alcanonas sucesivas).

Los valores lambda-máximos se determinaron por medio de los espectros UV con 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Productos de partida de la fórmula (II):

Ejemplo II-1.



x HCl

Se elimina de una mezcla constituida por 57 g (0,30 moles) de 1-(2,4-dicloro-fenil)-etilamina, 36 g de ácido clorhídrico al 30%, 350 ml de tolueno y 200 ml de decano, el agua y una cantidad de tolueno tal que la temperatura interna suba hasta 140°C. A continuación se añaden 25,2 g (0,30 moles) de cianoguanidina y la mezcla de la reacción se calienta durante 3 horas a 140°C hasta 145°C. Tras refrigeración se añade acetona a la mezcla y el producto cristalino formado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 88,5 g (95 % de la teoría) del hidrocloruro de la 1-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil]-biguanida en forma de producto sólido.

De manera análoga a la del ejemplo II-1 pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 2 siguiente.

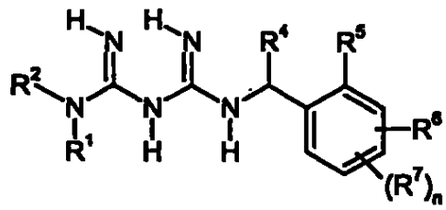
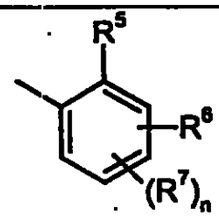
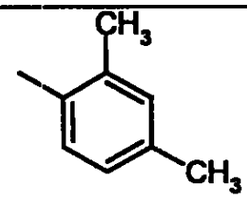
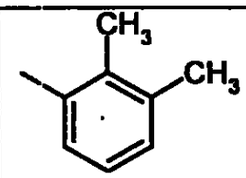
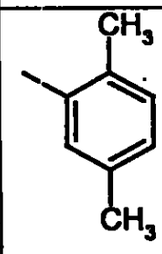
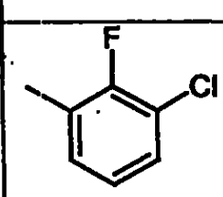
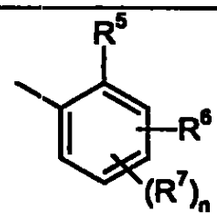
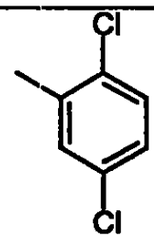
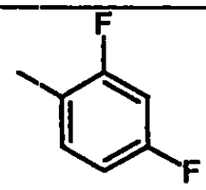
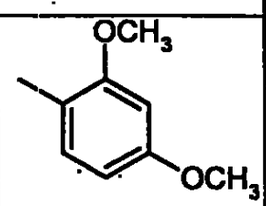
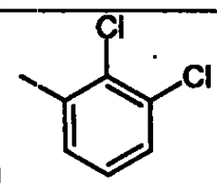


Tabla 2:

Ejemplos de compuestos de la fórmula (II).

En este caso se trata respectivamente de los correspondientes hidrocloruros.

Ej. nº	R^1	R^2	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
II-2	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-3	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-4	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-5	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)

Ej. - nº	R^1	R^2	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
II-6	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-7	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-8	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-9	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)

Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 15, 18, 27 y 38, con una compatibilidad parcialmente buena para con las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

Tabla 1: Ensayo de pre-brote/invernadero.

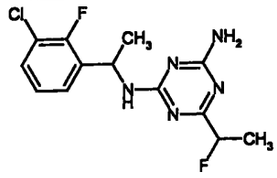
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Maíz	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Xanthium
						
(27)	500	0	90	80	100	80

Tabla A2: Ensayo de pre-brote/invernadero.

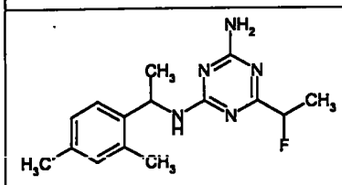
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Maíz	Alopecurus	Amaranthus	Galium
					
(15)	500	20	80	100	100

Tabla A3: Ensayo de pre-brote/invernadero.

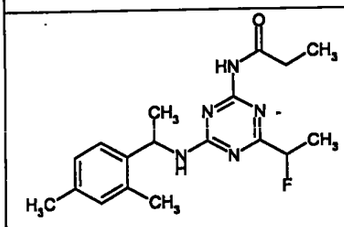
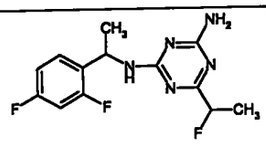
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Maíz	Alopecurus	Abutilon	Amaranthus
					
(18)	500	0	70	80	100

Tabla A4: Ensayo de pre-brote/invernadero.

Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Maíz	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Sinapis	Xanthium
							
(38)	500	0	90	90	100	100	100

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Las plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, se pulverizan con la preparación del producto activo de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 3, 5, 14, 15, 16, 18, 27, 28, 37, 38 y 39, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, algodón, cebada y trigo, un potente efecto contra las malas hierbas.

Tabla B1: **Ensayo de post-brote/invernadero.**

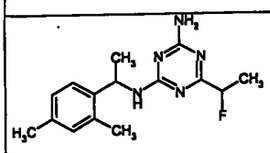
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Galium	Sinapis	Xanthium
							
(15)	500	100	90	100	90	100	100

Tabla B2: **Ensayo de post-brote/invernadero.**

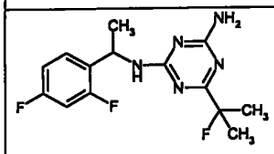
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Xanthium
					
(39)	500	90	90	100	100

Tabla B3: Ensayo de post-brote/invernadero.

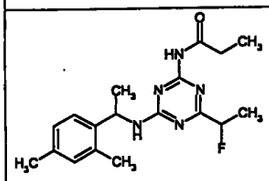
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Alopecurus	Amaranthus	Galium	Sinapis	Xanthium
						
(18)	500	80	100	95	-	100

Tabla B4: Ensayo de post-brote/invernadero.

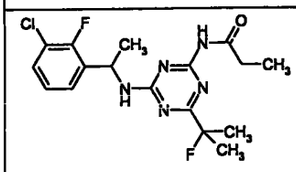
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Amaranthus	Galium	Sinapis	Xanthium
						
(3)	500	100	100	80	100	95

Tabla B5: **Ensayo de post-brote/invernadero.**

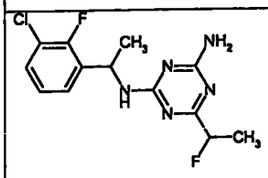
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Amaranthus	Galium	Sinapis	Xanthium
						
(27)	500	100	100	95	-	95

Tabla B6: Ensayo post-brote/invernadero

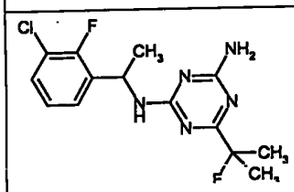
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Amaranthus	Sinapis
				
(28)	500	100	100	100

Tabla B7: Ensayo post-brote/invernadero

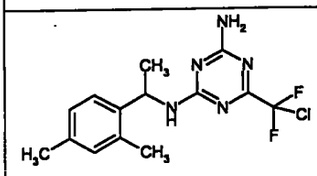
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Amaranthus	Sinapis
				
(14)	500	100	100	100

Tabla B8: Ensayo de post-brote/invernadero.

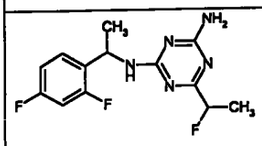
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Avena fatua	Abutilon	Amaranthus	Galium	Xanthium
						
(38)	500	95	100	100	100	100

Tabla B9: Ensayo post-brote/invernadero

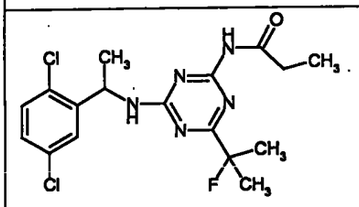
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Maíz	Amaranthus	Sinapis
				
(37)	500	0	95	95

Tabla B10: Ensayo de post-brote/invernadero.

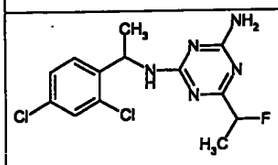
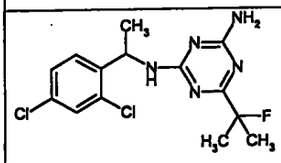
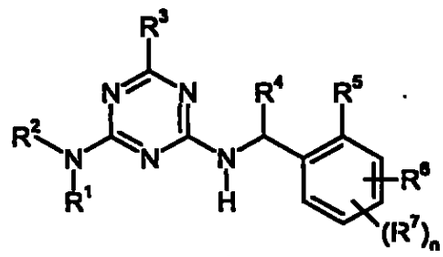
Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Trigo	Soja	Amaranthus	Datura	Polygonum	Solanum
							
(1)	60	0	0	100	90	100	100

Tabla B11: Ensayo de post-brote/invernadero.

Producto activo según el ejemplo de obtención nº	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Cebada	Algodón	Amaranthus	Chenopodium	Veronica	Viola
							
(5)	250	0	0	100	100	100	100

REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de la fórmula general (I)



(I)

en la que

n significa los números 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R^2 significa hidrógeno, significa formilo, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi-carbonilo o alquilaminocarbonilo con, respectivamente, 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa dialquilaminoalquilidenamino con 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo o bien en los grupos alquilideno,

R^3 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituido en caso dado por hidroxi, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-sulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^4 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano,

por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^5 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino o dialquilamino respectivamente con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y –en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, o dialquil-amino con respectivamente 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, y

R^7 significa halógeno o significa alquilo o alcoxi con, respectivamente, 1 a 3 átomos de carbono.

2.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R^2 significa hidrógeno, formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$, significa dimetilaminometilenamino o dietilamino-

metilenamino,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por hidroxi, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butiroilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y -en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo,

metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

3.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0, 1 o 2,

R^1 significa hidrógeno, metilo o etilo,

R^2 significa hidrógeno, formilo, metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa dimetilaminometilenamino,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por acetilo, por propionilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro o por metilo,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, o significa ciclopropilo, substituido respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, o por metilo,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa

también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, o etoxi.

4.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0 o 1,

R^1 significa hidrógeno,

R^2 significa hidrógeno, formilo, acetilo o propionilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa, también dimetilamino-metilenamino,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,

R^4 significa metilo o etilo,

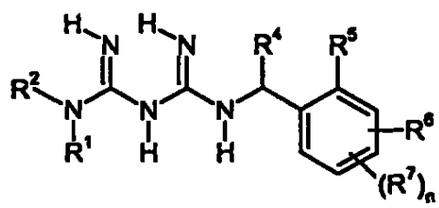
R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propo-

xicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino y

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

5.- Procedimiento para la obtención de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque se hacen reaccionar biguanidas de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4

-y/o aductos de ácido de los compuestos de la fórmula general (II)-

con compuestos de alcoxicarbonilo de la fórmula general (III)

$$R^3\text{-CO-OR'} \qquad \text{(III)}$$

en la que

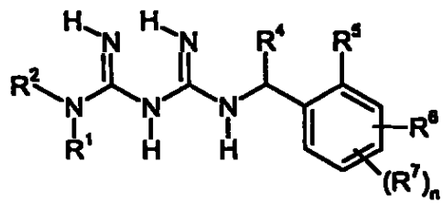
R^3 tiene el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4

R' significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y, en caso dado, se llevan a cabo en los compuestos de la fórmula general (I), obtenidos de este modo, en el ámbito de la definición de los substituyentes, otras transformaciones según métodos usuales.

6.- Compuestos de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4.

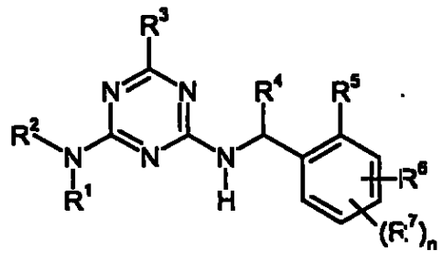
7.- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se tratan las plantas indeseables y/o su medio ambiente con al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

8.- Empleo de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, para la lucha contra las plantas indeseables.

9.- Agentes herbicidas caracterizados porque tienen un contenido en un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



(I)

en la que n, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en la descripción.

a un procedimiento y a productos intermedios para su obtención y a su empleo como herbicidas.

83

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen:	199 36 633.0
Anmeldetag:	04. August 1999
Anmelder/Inhaber:	Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen/DE
Bezeichnung:	Substituierte Arylalkylamino-1,3,5-triazine
IPC:	C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Anmeldung.

München, den 08. Juni 2000
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

Wehner

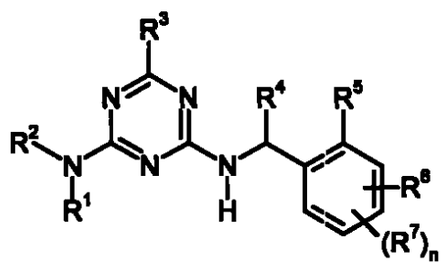
A 9161 pat
03/00
EDV-L

Substituierte Arylalkylamino-1,3,5-triazine

Die Erfindung betrifft neue substituierte Arylalkylamino-1,3,5-triazine, ein Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Eine Reihe von substituierten Arylalkylamino-1,3,5-triazinen ist bereits aus der (Patent-)Literatur bekannt (vgl. US-A-3816419, US-A-3932167, EP-A-191496, EP-A-273328, EP-A-411153 / WO-A-90/09378, WO-A-98/15536, WO-A-98/42684, JP-A-62294669 - zitiert in Chem. Abstracts 109:129062v, JP-A-63051379 - zitiert in Chem. Abstracts 109:231079). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt.

Es wurden nun die neuen substituierten Arylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I)



(I)

in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

R^1 für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

R^2 für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl

oder Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ auch für Dialkylaminoalkylidenamino mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen bzw. in der Alkyliden-Gruppierung steht,

R^3 für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Halogen, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkyl-carbonyl, C_1-C_4-Alkoxy-carbonyl, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Alkylsulfinyl oder C_1-C_4-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R^4 für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R^5 für Cyano, Nitro, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, und - für den Fall, daß n für die Zahlen 2 oder 3 steht - auch für Wasserstoff steht,

R^6 für Cyano, Nitro, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, und

R^7 für Halogen oder für Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht,

gefunden.

Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im Folgenden beschrieben.

n steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3.

R^1 steht bevorzugt für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

R^2 steht bevorzugt für Wasserstoff, Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ steht bevorzugt auch für Dimethylaminomethylenamino oder Diethylaminomethylenamino.

R^3 steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R^4 steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R^5 steht bevorzugt für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, und - für den Fall, daß n für die Zahlen 2 oder 3 steht - auch für Wasserstoff.

R^6 steht bevorzugt für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.

R^7 steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.

n steht besonders bevorzugt für die Zahlen 0, 1 oder 2.

R^1 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

R^2 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Formyl, Methyl, Ethyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ steht bevorzugt auch für Dimethylaminomethylenamino.

R^3 steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Methyl substituiertes Cyclopropyl.

R^4 steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Methyl substituiertes Cyclopropyl.

R^5 steht besonders bevorzugt für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino oder Dimethylamino, und - für den Fall, daß n für die Zahl 2 steht - auch für Wasserstoff.

R^6 steht besonders bevorzugt für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.

R^7 steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.

n steht ganz besonders bevorzugt für die Zahlen 0 oder 1.

R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

R^2 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Formyl, Acetyl oder Propionyl,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ steht bevorzugt auch für Dimethylaminomethylenamino.

R^3 steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

R^4 steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Ethyl.

R^5 steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy,

Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino oder Dimethylamino, und - für den Fall, daß n für die Zahl 2 steht - auch für Wasserstoff.

R^6 steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, oder für Dimethylamino.

R^7 steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.

Eine besonders bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der allgemeinen Formel (I), bei welchen die Substituenten an dem Kohlenstoffatom, an welches R^4 gebunden ist, in R-Konfiguration angeordnet sind.

Eine weitere besonders bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der allgemeinen Formel (I), bei welchen die Substituenten an dem Kohlenstoffatom, an welches R^4 gebunden ist, in S-Konfiguration angeordnet sind.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

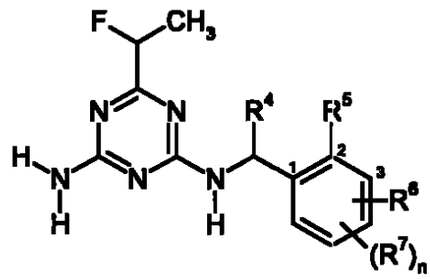
Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste, wie Alkyl, sind - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - soweit möglich jeweils geradkettig oder verzweigt.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitution die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

Die Alkylgruppen in der Definition von R^3 können gegebenenfalls auch asymmetrisch substituierte Kohlenstoffatome enthalten. In diesen Fällen werden erfindungsgemäß sowohl die jeweils möglichen R- und S-Formen als auch die Mischungen hiervon beansprucht.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

Gruppe1



R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	F	(3) F	-
C_2H_5	F	(3) F	-
CH_3	F	(3) Cl	-
C_2H_5	F	(3) Cl	-
CH_3	F	(3) Br	-
C_2H_5	F	(3) Br	-
CH_3	F	(3) CH_3	-
C_2H_5	F	(3) CH_3	-
CH_3	F	(3) OCH_3	-
C_2H_5	F	(3) OCH_3	-
CH_3	F	(3) SCH_3	-
C_2H_5	F	(3) SCH_3	-
CH_3	F	(3) $SOCH_3$	-
C_2H_5	F	(3) $SOCH_3$	-
CH_3	F	(3) SO_2CH_3	-
C_2H_5	F	(3) SO_2CH_3	-
CH_3	F	(3) CF_3	-
C_2H_5	F	(3) CF_3	-

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	F	(3) OCF_3	-
C_2H_5	F	(3) OCF_3	-
CH_3	F	(3) SCF_3	-
C_2H_5	F	(3) SCF_3	-
CH_3	Cl	(3) F	-
C_2H_5	Cl	(3) F	-
CH_3	Cl	(3) Cl	-
C_2H_5	Cl	(3) Cl	-
CH_3	Cl	(3) Br	-
C_2H_5	Cl	(3) Br	-
CH_3	Cl	(3) CH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	-
CH_3	Cl	(3) OCH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	-
CH_3	Cl	(3) SCH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SCH_3	-
CH_3	Cl	(3) $SOCH_3$	-
C_2H_5	Cl	(3) $SOCH_3$	-
CH_3	Cl	(3) SO_2CH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SO_2CH_3	-
CH_3	Cl	(3) CF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) CF_3	-
CH_3	Cl	(3) OCF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) OCF_3	-
CH_3	Cl	(3) SCF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SCF_3	-
CH_3	CH_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	-

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	CH_3	(3) F	-
C_2H_5	CH_3	(3) F	-
CH_3	CH_3	(3) Cl	-
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	-
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	-
CH_3	CH_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) CF_3	-
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	-
CH_3	OCH_3	(3) F	-
C_2H_5	OCH_3	(3) F	-
CH_3	OCH_3	(3) Cl	-
C_2H_5	OCH_3	(3) Cl	-
CH_3	OCH_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) OCH_3	-
CH_3	OCH_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) CF_3	-
CH_3	CF_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) CF_3	-
CH_3	CF_3	(3) F	-
C_2H_5	CF_3	(3) F	-
CH_3	CF_3	(3) Cl	-
C_2H_5	CF_3	(3) Cl	-
CH_3	CF_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) CH_3	-
CH_3	CF_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) OCH_3	-

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	F	(4) F	-
C_2H_5	F	(4) F	-
CH_3	F	(4) Cl	-
C_2H_5	F	(4) Cl	-
CH_3	F	(4) Br	-
C_2H_5	F	(4) Br	-
CH_3	F	(4) CH_3	-
C_2H_5	F	(4) CH_3	-
CH_3	F	(4) OCH_3	-
C_2H_5	F	(4) OCH_3	-
CH_3	F	(4) SCH_3	-
C_2H_5	F	(4) SCH_3	-
CH_3	F	(4) $SOCH_3$	-
C_2H_5	F	(4) $SOCH_3$	-
CH_3	F	(4) SO_2CH_3	-
C_2H_5	F	(4) SO_2CH_3	-
CH_3	F	(4) CF_3	-
C_2H_5	F	(4) CF_3	-
CH_3	F	(4) OCF_3	-
C_2H_5	F	(4) OCF_3	-
CH_3	F	(4) SCF_3	-
C_2H_5	F	(4) SCF_3	-
CH_3	Cl	(4) F	-
C_2H_5	Cl	(4) F	-
CH_3	Cl	(4) Cl	-
C_2H_5	Cl	(4) Cl	-
CH_3	Cl	(4) Br	-
C_2H_5	Cl	(4) Br	-

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	Cl	(4) CH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) CH_3	-
CH_3	Cl	(4) OCH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) OCH_3	-
CH_3	Cl	(4) SCH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SCH_3	-
CH_3	Cl	(4) $SOCH_3$	-
C_2H_5	Cl	(4) $SOCH_3$	-
CH_3	Cl	(4) SO_2CH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SO_2CH_3	-
CH_3	Cl	(4) CF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) CF_3	-
CH_3	Cl	(4) OCF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) OCF_3	-
CH_3	Cl	(4) SCF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SCF_3	-
CH_3	CH_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	C_2H_5	(4) CH_3	-
CH_3	CH_3	(4) F	-
C_2H_5	CH_3	(4) F	-
CH_3	CH_3	(4) Cl	-
C_2H_5	CH_3	(4) Cl	-
CH_3	CH_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	CH_3	(4) OCH_3	-
CH_3	CH_3	(4) CF_3	-
C_2H_5	CH_3	(4) CF_3	-
CH_3	OCH_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) OCH_3	-

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	OCH_3	(4) F	-
C_2H_5	OCH_3	(4) F	-
CH_3	OCH_3	(4) Cl	-
C_2H_5	OCH_3	(4) Cl	-
CH_3	OCH_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) CH_3	-
CH_3	OCH_3	(4) CF_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) CF_3	-
CH_3	CF_3	(4) F	-
C_2H_5	CF_3	(4) F	-
CH_3	CF_3	(4) Cl	-
C_2H_5	CF_3	(4) Cl	-
CH_3	CF_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	CF_3	(4) CH_3	-
CH_3	CF_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	CF_3	(4) OCH_3	-
CH_3	F	(4) F	(5) F
C_2H_5	F	(4) F	(5) F
CH_3	H	(3) F	(4,5) F_2
C_2H_5	H	(3) F	(4,5) F_2
CH_3	F	(3) F	(5,6) F_2
C_2H_5	F	(3) F	(5,6) F_2
CH_3	F	(3) F	(4,5,6) F_3
C_2H_5	F	(3) F	(4,5,6) F_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) F
CH_3	F	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) F

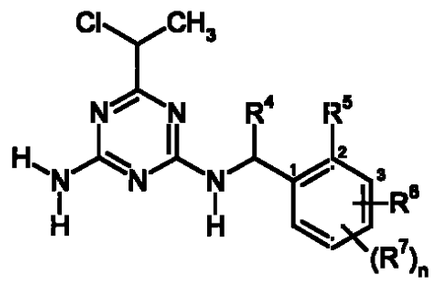
R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	F	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) F	(4) Cl
CH_3	F	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) F	(4) CH_3
CH_3	F	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	F	(3) Cl	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) CH_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	F	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	F	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) CH_3
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) Cl

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	Cl	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) F
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) F	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) F
CH_3	Cl	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) CH_3
CH_3	Cl	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) F
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) CH_3

R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	CH_3	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) F
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) F	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) F
CH_3	CH_3	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3

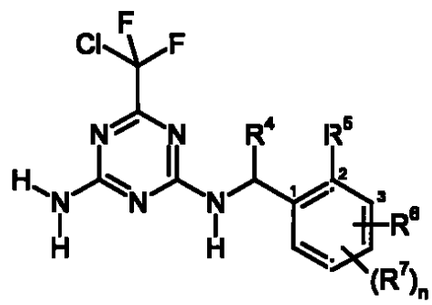
R^4	R^5	(Position) R^6	(Position) $(R^7)_n$
CH_3	OCH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) F
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) F
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) F
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) Cl
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) CH_3

Gruppe 2



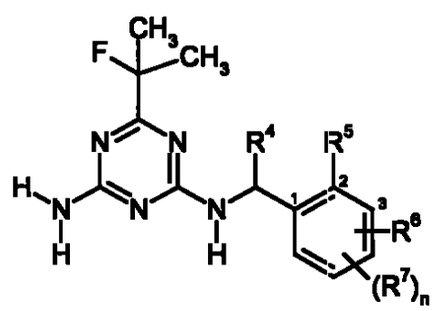
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 3



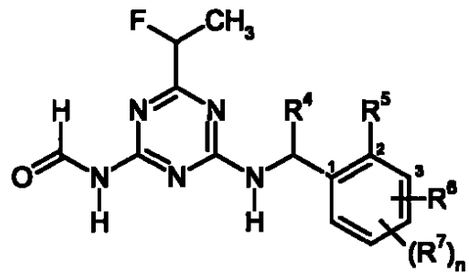
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 4



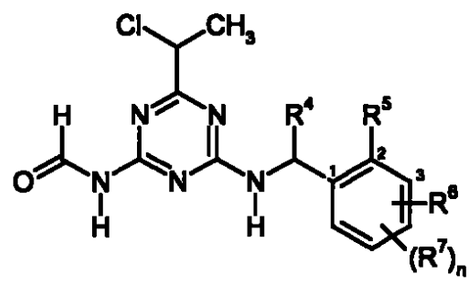
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 5



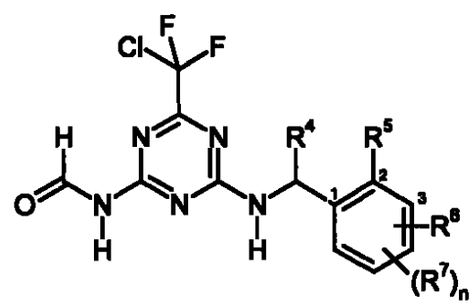
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 6



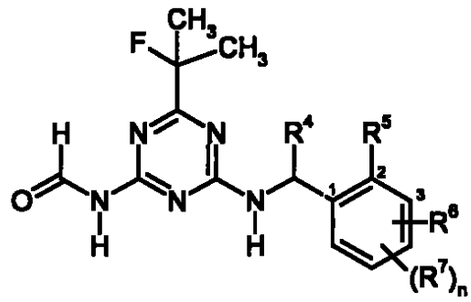
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 7



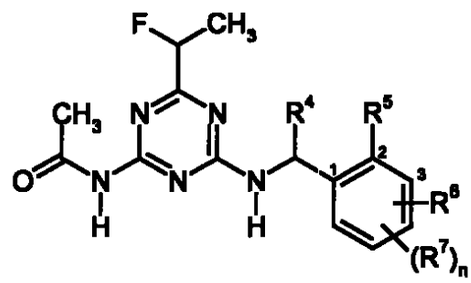
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 8



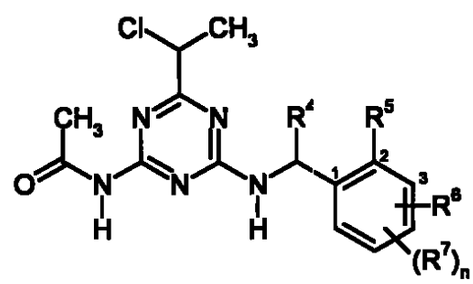
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 9



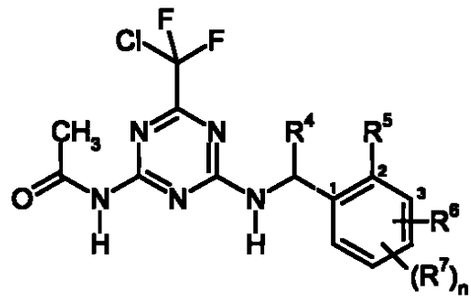
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 10



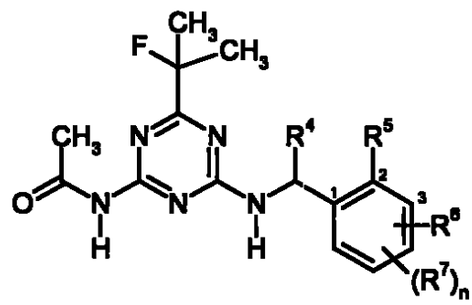
R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 11



R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

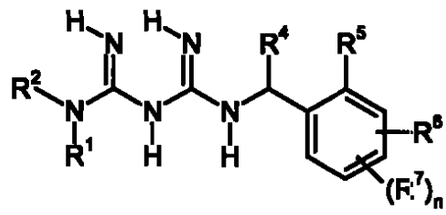
Gruppe 12



R^4, R^5, R^6 und $(R^7)_n$ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Die neuen substituierten Arylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I) weisen interessante biologische Eigenschaften auf. Sie zeichnen sich insbesondere durch starke herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Arylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I), wenn man Biguanide der allgemeinen Formel (II)



(II)

in welcher

n, R^1, R^2, R^4, R^5 R^6 und R^7 die oben angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)

$$R^3\text{-CO-OR}' \qquad \text{(III)}$$

in welcher

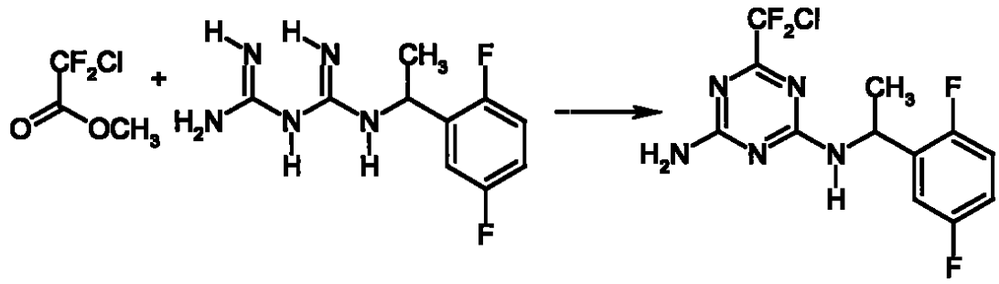
R^3 die oben angegebene Bedeutung hat und

R' für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

und gegebenenfalls an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchführt.

Verwendet man beispielsweise 1-[1-(2,5-Difluor-phenyl)-ethyl]-biguanid und Chlordifluoressigsäure-methylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:

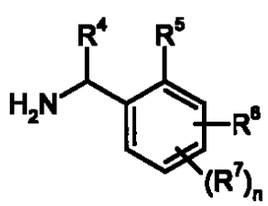


Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Biguanide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben n, R^1, R^2, R^4, R^5 R^6 und R^7 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für n, R^1, R^2, R^4, R^5 R^6 und R^7 angegeben worden sind.

Geeignete Säureaddukte von Verbindungen der Formel (II) sind deren Additionsprodukte mit Protonensäuren, wie z.B. mit Chlorwasserstoff (Hydrogenchlorid), Bromwasserstoff (Hydrogenbromid), Schwefelsäure, Methansulfonsäure, Benzolsulfonsäure und p-Toluolsulfonsäure.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen Biguanide der allgemeinen Formel (II), wenn man Arylalkylamine der allgemeinen Formel (IV)



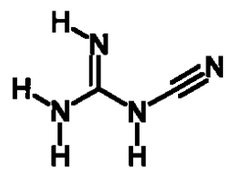
(IV)

in welcher

n, R^4, R^5 R^6 und R^7 die oben angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (IV), wie z.B. die Hydrochloride -

mit Cyanoguanidin („Dicyandiamid") der Formel (V)



(V)

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Hydrogenchlorid, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. n-Decan oder 1,2-Dichlor-benzol, bei Temperaturen zwischen 100°C und 200°C umsetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die Biguanide der allgemeinen Formel (II) können nach ihrer Herstellung auch ohne Zwischenisolierung direkt zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach dem erfindungsgemäßen Verfahren eingesetzt werden.

Die als Vorprodukte benötigten Arylalkylamine der allgemeinen Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE-A-3819438, DE-A-19650081, EP-A-551821, EP-A-736509, EP-A-778260, US-A-5739401).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkoxycarbonylverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat R^4 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutunge, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R^3 angegeben worden ist; R^4 steht vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannte Synthesechemikalien.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen neben Wasser vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Als Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall-, -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium-, -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiter-

hin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methylpyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8 Diazabicyclo-[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten auf-

wachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

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

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

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

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauflauf- als auch im Nachauflauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinidon(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop-(-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop-

(-methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Fluropacil, Flurpyrsulfuron(-methyl, -sodium), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr-(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop-(-ethoxyethyl), Haloxyfop(-P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac-(-methyl), Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbuthylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

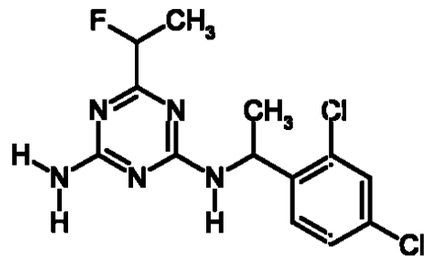
Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:

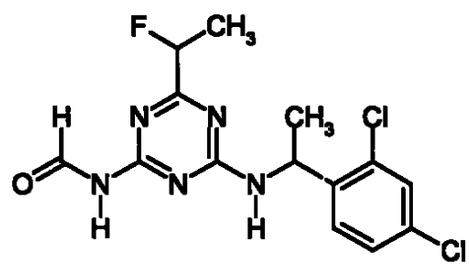
Beispiel 1



Eine Lösung von 3,6 g (66 mMol) Natriummethylat in 60 ml Methanol wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) unter Rühren zu einer Mischung aus 19,0 g (60 mMol) 1-[1-(2,4-Dichlor-phenyl)-ethyl]-biguanid-Hydrochlorid (racemisch), 8,0 g (60 mMol) 2-Fluor-propansäure-methylester und 85 ml Methanol gegeben. Die Reaktionsmischung wird 15 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und anschließend durch langsame Zugabe von Wasser auf etwa das dreifache Volumen verdünnt. Das hierbei kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert.

Man erhält 5,7 g (29% der Theorie) 6-(1-Fluor-ethyl)-N^2-[1-(2,4-dichlor-phenyl)-ethyl]-1,3,5-triazin-2,4-diamin (Racemat) vom Schmelzpunkt 122°C.

Beispiel 2

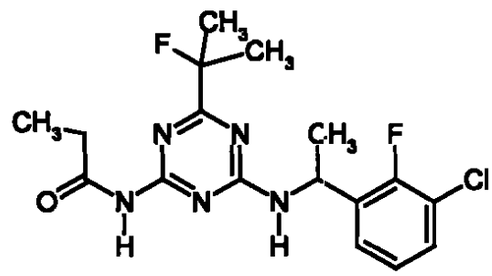


Eine Mischung aus 3,0 g (9 mMol) 6-(1-Fluor-ethyl)-N^2-[1-(2,4-dichlor-phenyl)-ethyl]-1,3,5-triazin-2,4-diamin (racemisch), 1,5 g (9 mMol) N,N-Dimethyl-formamid-dimethylacetal und 40 ml 1,4-Dioxan wird 15 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Nach Zugabe von 80 ml Wasser und 3 ml konz. Salzsäure wird

die Mischung weitere 60 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 1,4 g (43% der Theorie) N-{4-[1-(2,4-Dichlor-phenyl)-ethylamino]-6-(1-fluor-ethyl)-1,3,5-triazin-2-yl}-formamid (Racemat) vom Schmelzpunkt 172°C.

Beispiel 3



Eine Mischung aus 3,0 g (9 mMol) 6-(1-Fluor-1methyl-ethyl)-N^2-[1-(3-chlor-2-fluor-phenyl)-ethyl]-1,3,5-triazin-2,4-diamin und 15 ml Propionsäureanhydrid wird 30 Minuten bei 130°C gerührt. Dann werden die flüchtigen Anteile unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert. Der Rückstand wird mit 20 ml Ethanol digeriert und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 3,1 g (89% der Theorie) N-{4-[1-(3-Chlor-2-fluor-phenyl)-ethylamino]-6-(1-fluor-1-methyl-ethyl)-1,3,5-triazin-2-yl}-propionsäureamid (Racemat) vom Schmelzpunkt 130°C.

Analog zu den Beispielen 1 bis 3 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

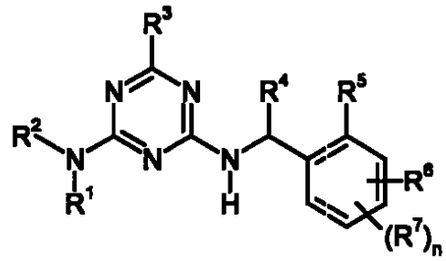
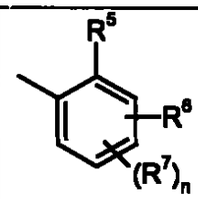
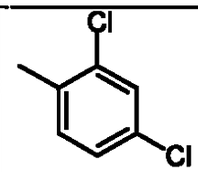
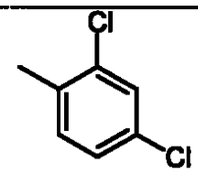
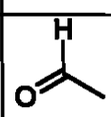
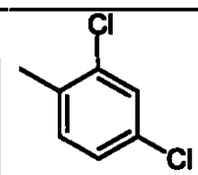
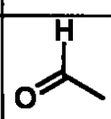
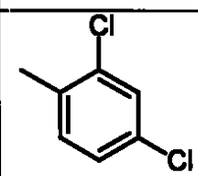
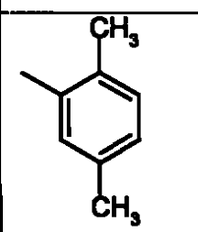
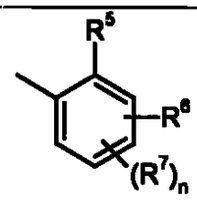
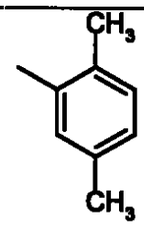
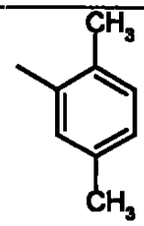
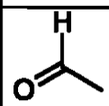
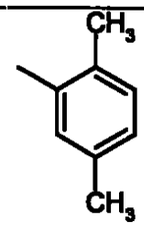
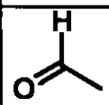
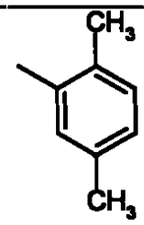
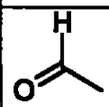
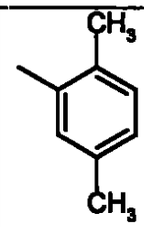
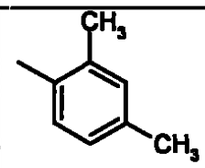
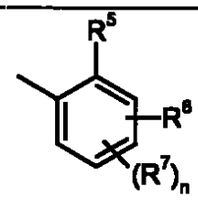
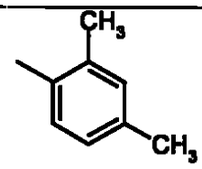
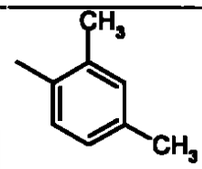
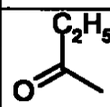
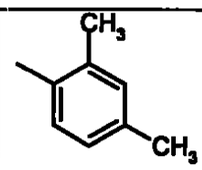
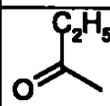
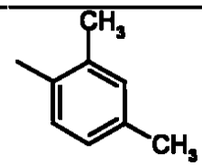
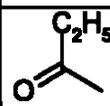
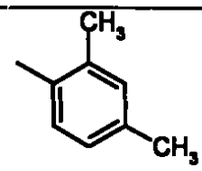
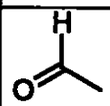
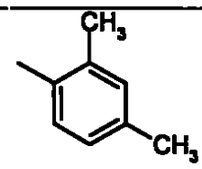
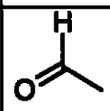
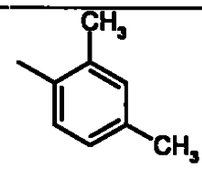
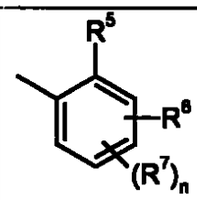
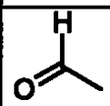
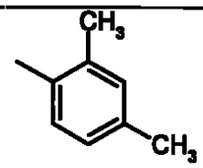
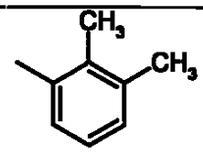
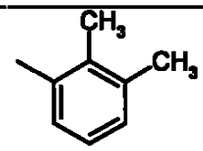
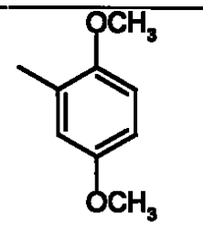
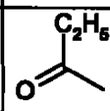
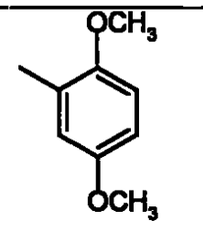
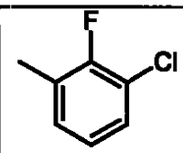
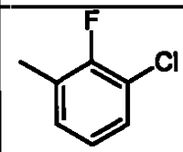


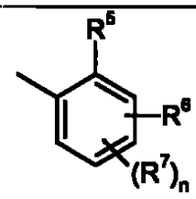
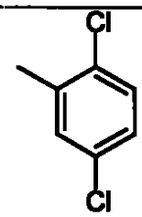
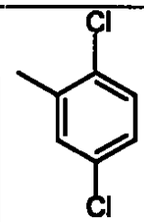
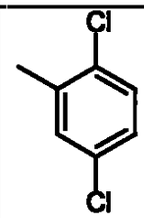
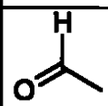
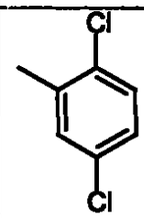
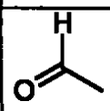
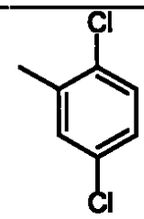
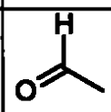
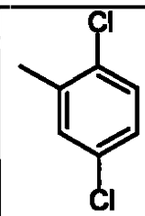
Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

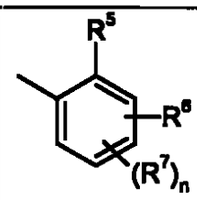
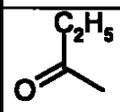
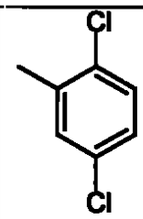
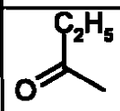
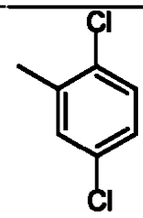
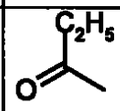
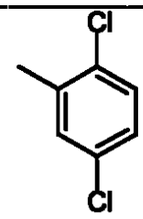
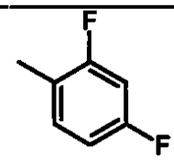
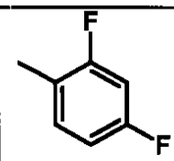
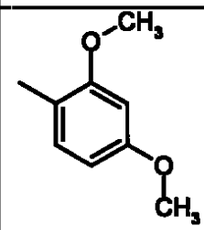
Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
4	H	H	CF_2Cl	CH_3		Fp.: 75°C (Racemat)
5	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 154°C (Racemat)
6	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 148°C (Racemat)
7	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 201°C (Racemat)
8	H	H	CF_2Cl	CH_3		logP = 3,28 [a] (Racemat)

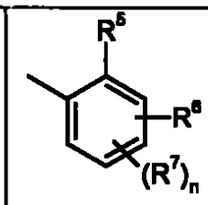
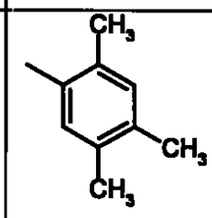
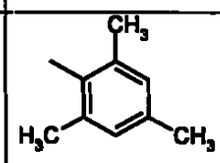
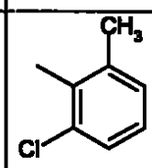
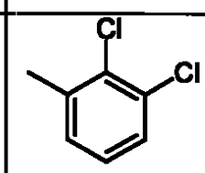
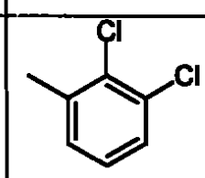
Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
9	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,89 [a)] (Racemat)
10	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,95 [a)] (Racemat)
11	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 212°C (Racemat)
12	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 202°C (Racemat)
13	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 177°C (Racemat)
14	H	H	CF_2Cl	CH_3		logP = 3,30 [a)] (Racemat)

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
15	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 88°C (Racemat)
16	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 109°C (Racemat)
17	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 147°C (Racemat)
18	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 132°C (Racemat)
19	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 163°C (Racemat)
20	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 193°C (Racemat)
21	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 197°C (Racemat)

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
22	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 224°C (Racemat)
23	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,84 [a)] (Racemat)
24	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,97 [a)] (Racemat)
25	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,55 [a)] (Racemat)
26	H		$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,49 [a)] (Racemat)
27	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,94 [a)] (Racemat)
28	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,00 [a)] (Racemat)

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
29	H	H	CF_2Cl	CH_3		Fp.: 64°C (Racemat)
30	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,14 [a)] (Racemat)
31	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,20 [a)] (Racemat)
32	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 202°C (Racemat)
33	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 208°C (Racemat)
34	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 195°C (Racemat)

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
35	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 159°C (Racemat)
36	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 158°C (Racemat)
37	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 199°C (Racemat)
38	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(amorph) (Racemat)
39	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorph) (Racemat)
40	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(amorph) (Racemat)

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
41	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorph) (Racemat)
42	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorph) (Racemat)
43	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorph) (Racemat)
44	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,14 [a)] (Racemat)
45	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 173°C (Racemat)

Die Bestimmung der in Tabelle 1 angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit [a)] markiert.

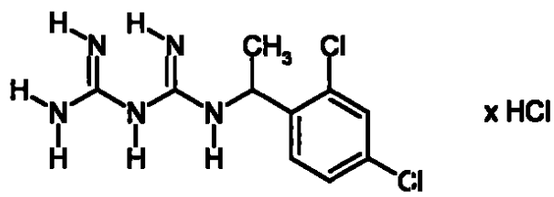
(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit [b)] markiert.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Ausgangsstoffe der Formel (II):

Beispiel II-1



Aus einer Mischung von 57 g (0,30 Mol) 1-(2,4-Dichlor-phenyl)-ethylamin, 36 g 30 %iger Salzsäure, 350 ml Toluol und 200 ml Decan wird das Wasser und soviel Toluol abdestilliert bis die Innentemperatur auf 140°C angestiegen ist. Dann werden 25,2 g (0,30 Mol) Cyanoguanidin dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird 3 Stunden auf 140°C bis 145°C erhitzt. Nach Abkühlen wird Aceton zur Mischung gegeben und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 88,5 g (95% der Theorie) 1-[1-(2,4-Dichlor-phenyl)-ethyl]-biguanid-Hydrochlorid als festes Produkt.

Analog zu Beispiel II-1 können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

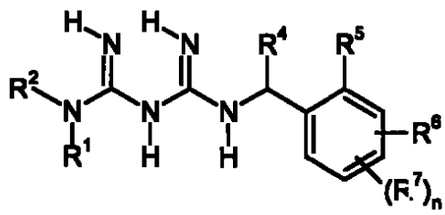
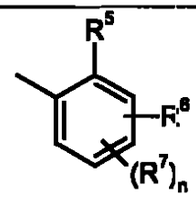
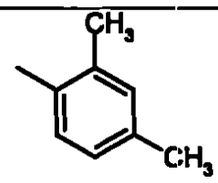
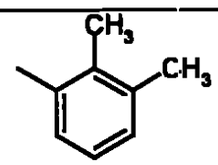
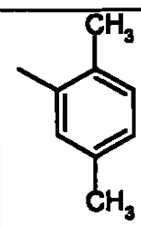
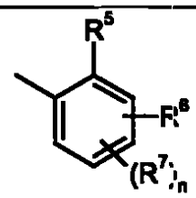
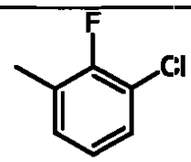
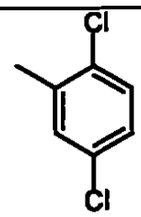
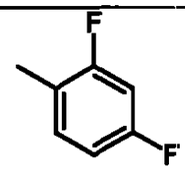
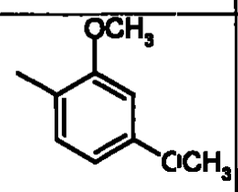
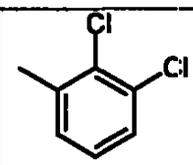


Tabelle 2:

Beispiele für die Verbindungen der Formel (II)

Es handelt sich hierbei jeweils um die entsprechenden Hydrochloride

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
II-2	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)
II-3	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)
II-4	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)

Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^4		Physikal. Daten und stereochem. Angaben
II-5	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)
II-6	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)
II-7	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)
II-8	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)
II-9	H	H	CH_3		(amorph) (Racemat)

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, daß die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 %	=	keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 %	=	totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 15, 18, 27 und 38 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Beispiel B

Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 bis 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

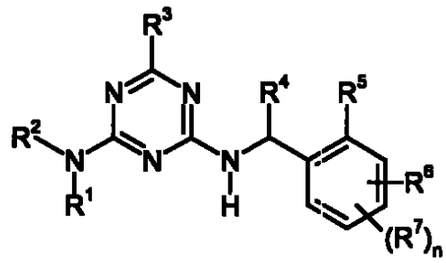
Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 3, 5, 14, 15, 16, 18, 27, 28, 37, 38 und 39 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Baumwolle, Gerste, Mais und Weizen, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



(I)

in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

R^1 für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

R^2 für Wasserstoff, für Formyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ für Dialkylaminoalkylidenamino mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen bzw. in der Alkyliden-Gruppierung steht,

R^3 für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Halogen, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkyl-carbonyl, C_1-C_4-Alkoxy-carbonyl, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Alkylsulfinyl oder C_1-C_4-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für ge-

gebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R^4 für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R^5 für Cyano, Nitro, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, und - für den Fall, daß n für die Zahlen 2 oder 3 steht - auch für Wasserstoff steht,

R^6 für Cyano, Nitro, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1-C_4-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, und

R^7 für Halogen oder für Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht.

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

R^1 für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R^2 für Wasserstoff, Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl steht,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ für Dimethylaminomethylenamino oder Diethylaminomethylenamino steht,

R^3 für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

R^4 für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

R^5 für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-

Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, und - für den Fall, daß n für die Zahlen 2 oder 3 steht - auch für Wasserstoff steht,

R^6 für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino steht, und

R^7 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

3. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

R^1 für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

R^2 für Wasserstoff, Formyl, Methyl, Ethyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ für Dimethylaminomethylenamino steht,

R^3 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Methyl substituiertes Cyclopropyl steht,

R^4 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Methyl substituiertes Cyclopropyl steht,

R^5 für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino oder Dimethylamino, und - für den Fall, daß n für die Zahl 2 steht - auch für Wasserstoff steht,

R^6 für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n-

oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino steht, und

R^7 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

4. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

n für die Zahlen 0 oder 1 steht,

R^1 für Wasserstoff steht,

R^2 für Wasserstoff, Formyl, Acetyl oder Propionyl steht,

oder die Gruppierung $N(R^1,R^2)$ für Dimethylaminomethylenamino steht,

R^3 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

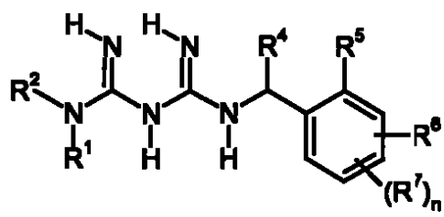
R^4 für Methyl oder Ethyl steht,

R^5 für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino oder Dimethylamino, und - für den Fall, daß n für die Zahl 2 steht - auch für Wasserstoff steht,

R^6 für Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, oder für Dimethylamino steht, und

R^7 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

5. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß Biguanide der allgemeinen Formel (II)



(II)

in welcher

n, R^1, R^2, R^4, R^5 R^6 und R^7 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)

$$R^3\text{-CO-OR}' \qquad \text{(III)}$$

in welcher

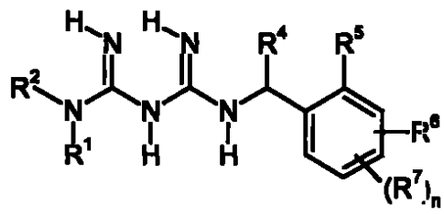
R^3 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung hat und

R' für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

und gegebenenfalls an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchgeführt werden.

6. Verbindungen der allgemeinen Formel (II)



(II)

in welcher

n, R^1, R^2, R^4, R^5 R^6 und R^7 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben.

7. Verfahren zum Bekämpfen von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man mindestens eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

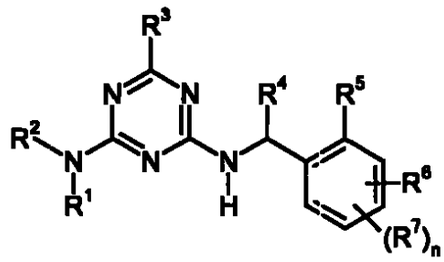
8. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen.

9. Herbizides Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 und üblichen Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln.

Substituierte Arylalkylamino-1,3,5-triazine

Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte Arylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I)



in welcher n, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 und R^7 die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben,

ein Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

TRADUCCION: Se traduce la carátula, la descripción y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Alemana No. 199 36 633.0 escrita en Alemán: para el invento denominado: **ARILALQUILANO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.**

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

(emblema)

CERTIFICACION

Expediente No.	:	199 36 633.0
Fecha	:	04 DE AGOSTO DE 1999
Nombre del Solicitante	:	**BAYER AKTIENGESELLSCHAFT**
		Leverkusen/Alemania
Título del Invento	:	**ARILALQUILANO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.**
Clasificación	:	C07D, A 01N

El documento que se acompaña es una copia fiel y exacta del original de esta solicitud de patente.

Munich, el día 08 de Junio de 2000.

EL PRESIDENTE DEL REGISTRO ALEMAN DE PATENTES

Por orden

((firma ilegibble))

Wehner

Cinta y Sello de

Oblea

PRIORIDAD

LeA 33909- Lu/vos/NT/V23.07.1999.

MEMORIA DESCRIPTIVA

S o b r e :

ARILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.

Solicitante.- BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana.

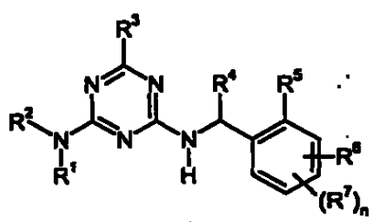
Residente.- D-51368, Leverkusen, República Federal de Alemania.

ARILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas arilalquilaminas-1,3,5-triazinas substituidas, a un procedimiento y a nuevos productos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se conoce ya una serie de arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas por la literatura (de patentes) (véanse las US-A-3816419, US-A3932167, EP-A-19146, EP-A-273328, EP-A-411153 / WO-A-90/09378, WO-A-98/15536, WO-A-98/42684 JP-A-62294669 – citado en Chem. Abstracts 109:129062v, JP-A-63051379 – citada en Chem. Abstracts 109:231079). Sin embargo estos compuestos no han adquirido hasta el presente ningún significado especial.

Se han encontrado ahora nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



(I)

en la que

n significa los números 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R^2 significa hidrógeno, significa formilo, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo o alquilaminocarbonilo con, respectivamente, 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa también dialquilaminoalquilidenamino con 1

hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo o bien en los grupos alquilideno,

R^3 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituido en caso dado por hidroxi, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-sulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^4 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^5 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxi-carbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino o dialquilamino respectivamente con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y –en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxi-carbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, o dialquil-amino con respectivamente 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, y

R^7 significa halógeno o significa alquilo o alcoxi con, respectivamente, 1 a 3 átomos de carbono.

Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas indicadas anteriormente o que se indicarán a continuación, se describen seguidamente.

Preferentemente,

n significa los números 0, 1, 2 o 3.

Preferentemente,

R^1 significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R^2 significa hidrógeno, formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$, significa, preferentemente, también dimetilaminometilenamino o dietilaminometilenamino.

Preferentemente,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por hidroxi, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butiroilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

Preferentemente,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo.

Preferentemente,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y -en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno.

Preferentemente,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

De forma especialmente preferente,

n significa los números 0, 1 o 2.

De forma especialmente preferente,

R^1 significa hidrógeno, metilo o etilo.

De forma especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, formilo, metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa, preferentemente también, dimetilamino-metilenamino.

De forma especialmente preferente,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por acetilo, por propionilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro o por metilo.

De forma especialmente preferente,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, o significa ciclopropilo, substituido respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, o por metilo.

De forma especialmente preferente,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa

también hidrógeno.

De forma especialmente preferente,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, o etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

n significa los números 0 o 1.

De forma muy especialmente preferente,

R^1 significa hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, formilo, acetilo o propionilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa, preferentemente, también dimetilamino-metilenamino.

De forma muy especialmente preferente,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R^4 significa metilo o etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromc, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa también hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino.

De forma muy especialmente preferente,

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

Un grupo especialmente preferente son los compuestos de la fórmula general (I), en los cuales los substituyentes en el átomo de carbono, con el que está enlazado R^4, estén dispuestos en la configuración R.

Otro grupo especialmente preferente son los compuestos de la fórmula general (I) en los cuales los substituyentes en el átomo de carbono, con el que está enlazado R^4, estén dispuestos en la configuración S.

Las definiciones de los restos, dadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los productos de partida o los productos intermedios necesarios respectivamente para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir

incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Según la invención son preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera especialmente preferente.

Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

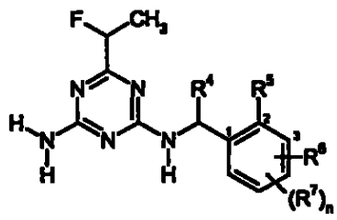
Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados tales como alquilo, son – incluso en combinación con heteroátomos, como en alcoxi- en tanto en cuanto sea posible, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los restos substituidos en caso dado pueden estar mono o polisubstituidos, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en el caso de una polisubstitución.

Los grupos alquilo en la definición de R^3 pueden contener en caso dado también átomos de carbono substituidos de manera asimétrica. En estos casos se reivindicarán según la invención tanto las formas respectivamente posibles R y S así como también las mezclas de las mismas.

Ejemplos de compuestos según la invención de la fórmula (I) se han indicado en los grupos siguientes.

Grupo 1.



En este caso R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$, tienen, de manera ejemplificativa, los significados indicados en la tabla siguiente:

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
CH_3	F	(3) F	-
C_2H_5	F	(3) F	-
CH_3	F	(3) Cl	-
C_2H_5	F	(3) Cl	-
CH_3	F	(3) Br	-
C_2H_5	F	(3) Br	-
CH_3	F	(3) CH_3	-
C_2H_5	F	(3) CH_3	-
CH_3	F	(3) OCH_3	-
C_2H_5	F	(3) OCH_3	-
CH_3	F	(3) SCH_3	-
C_2H_5	F	(3) SCH_3	-
CH_3	F	(3) $SOCH_3$	-
C_2H_5	F	(3) $SOCH_3$	-
CH_3	F	(3) SO_2CH_3	-
C_2H_5	F	(3) SO_2CH_3	-
CH_3	F	(3) CF_3	-
C_2H_5	F	(3) CF_3	-
CH_3	F	(3) OCF_3	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	F	(3) OCF_3	-
CH_3	F	(3) SCF_3	-
C_2H_5	F	(3) SCF_3	-
CH_3	Cl	(3) F	-
C_2H_5	Cl	(3) F	-
CH_3	Cl	(3) Cl	-
C_2H_5	Cl	(3) Cl	-
CH_3	Cl	(3) Br	-
C_2H_5	Cl	(3) Br	-
CH_3	Cl	(3) CH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	-
CH_3	Cl	(3) OCH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	-
CH_3	Cl	(3) SCH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SCH_3	-
CH_3	Cl	(3) $SOCH_3$	-
C_2H_5	Cl	(3) $SOCH_3$	-
CH_3	Cl	(3) SO_2CH_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SO_2CH_3	-
CH_3	Cl	(3) CF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) CF_3	-
CH_3	Cl	(3) OCF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) OCF_3	-
CH_3	Cl	(3) SCF_3	-
C_2H_5	Cl	(3) SCF_3	-
CH_3	CH_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	-
CH_3	CH_3	(3) F	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	CH_3	(3) F	-
CH_3	CH_3	(3) Cl	-
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	-
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	-
CH_3	CH_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	CH_3	(3) CF_3	-
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	-
CH_3	OCH_3	(3) F	-
C_2H_5	OCH_3	(3) F	-
CH_3	OCH_3	(3) Cl	-
C_2H_5	OCH_3	(3) Cl	-
CH_3	OCH_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) OCH_3	-
CH_3	OCH_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	OCH_3	(3) CF_3	-
CH_3	CF_3	(3) CF_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) CF_3	-
CH_3	CF_3	(3) F	-
C_2H_5	CF_3	(3) F	-
CH_3	CF_3	(3) Cl	-
C_2H_5	CF_3	(3) Cl	-
CH_3	CF_3	(3) CH_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) CH_3	-
CH_3	CF_3	(3) OCH_3	-
C_2H_5	CF_3	(3) OCH_3	-
CH_3	F	(4) F	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	F	(4) F	-
CH_3	F	(4) Cl	-
C_2H_5	F	(4) Cl	-
CH_3	F	(4) Br	-
C_2H_5	F	(4) Br	-
CH_3	F	(4) CH_3	-
C_2H_5	F	(4) CH_3	-
CH_3	F	(4) OCH_3	-
C_2H_5	F	(4) OCH_3	-
CH_3	F	(4) SCH_3	-
C_2H_5	F	(4) SCH_3	-
CH_3	F	(4) $SOCH_3$	-
C_2H_5	F	(4) $SOCH_3$	-
CH_3	F	(4) SO_2CH_3	-
C_2H_5	F	(4) SO_2CH_3	-
CH_3	F	(4) CF_3	-
C_2H_5	F	(4) CF_3	-
CH_3	F	(4) OCF_3	-
C_2H_5	F	(4) OCF_3	-
CH_3	F	(4) SCF_3	-
C_2H_5	F	(4) SCF_3	-
CH_3	Cl	(4) F	-
C_2H_5	Cl	(4) F	-
CH_3	Cl	(4) Cl	-
C_2H_5	Cl	(4) Cl	-
CH_3	Cl	(4) Br	-
C_2H_5	Cl	(4) Br	-
CH_3	Cl	(4) CH_3	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	Cl	(4) CH_3	-
CH_3	Cl	(4) OCH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) OCH_3	-
CH_3	Cl	(4) SCH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SCH_3	-
CH_3	Cl	(4) $SOCH_3$	-
C_2H_5	Cl	(4) $SOCH_3$	-
CH_3	Cl	(4) SO_2CH_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SO_2CH_3	-
CH_3	Cl	(4) CF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) CF_3	-
CH_3	Cl	(4) OCF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) OCF_3	-
CH_3	Cl	(4) SCF_3	-
C_2H_5	Cl	(4) SCF_3	-
CH_3	CH_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	C_2H_5	(4) CH_3	-
CH_3	CH_3	(4) F	-
C_2H_5	CH_3	(4) F	-
CH_3	CH_3	(4) Cl	-
C_2H_5	CH_3	(4) Cl	-
CH_3	CH_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	CH_3	(4) OCH_3	-
CH_3	CH_3	(4) CF_3	-
C_2H_5	CH_3	(4) CF_3	-
CH_3	OCH_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) OCH_3	-
CH_3	OCH_3	(4) F	-

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	OCH_3	(4) F	-
CH_3	OCH_3	(4) Cl	-
C_2H_5	OCH_3	(4) Cl	-
CH_3	OCH_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) CH_3	-
CH_3	OCH_3	(4) CF_3	-
C_2H_5	OCH_3	(4) CF_3	-
CH_3	CF_3	(4) F	-
C_2H_5	CF_3	(4) F	-
CH_3	CF_3	(4) Cl	-
C_2H_5	CF_3	(4) Cl	-
CH_3	CF_3	(4) CH_3	-
C_2H_5	CF_3	(4) CH_3	-
CH_3	CF_3	(4) OCH_3	-
C_2H_5	CF_3	(4) OCH_3	-
CH_3	F	(4) F	(5) F
C_2H_5	F	(4) F	(5) F
CH_3	H	(3) F	(4,5) F_2
C_2H_5	H	(3) F	(4,5) F_2
CH_3	F	(3) F	(5,6) F_2
C_2H_5	F	(3) F	(5,6) F_2
CH_3	F	(3) F	(4,5,6) F_3
C_2H_5	F	(3) F	(4,5,6) F_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) F
CH_3	F	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) F
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) F

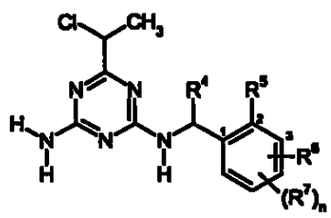
R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	F	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) F	(4) Cl
CH_3	F	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) F	(4) CH_3
CH_3	F	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	F	(3) Cl	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) CH_3
CH_3	F	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	F	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	F	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) CH_3
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) CH_3
CH_3	F	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	F	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) F	(4) Cl

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) F
CH_3	Cl	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) F	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) F
CH_3	Cl	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) CH_3
CH_3	Cl	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) F
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	Cl	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	Cl	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	Cl	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	Cl	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) F	(4) CH_3

R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) CH_3
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) CH_3
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) F
CH_3	CH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) F	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) F
CH_3	CH_3	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) Cl
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) Cl
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) F
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) F
CH_3	CH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	CH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3

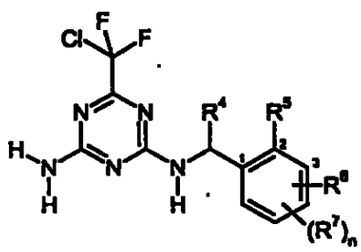
R^4	R^5	(Posición) R^6	(Posición) $(R^7)_n$
C_2H_5	OCH_3	(3) OCH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) Cl	(4) OCH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) CH_3
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) F
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) F
CH_3	OCH_3	(3) CH_3	(4) Cl
C_2H_5	OCH_3	(3) CH_3	(4) Cl
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) F
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) F
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) Cl
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) Cl
CH_3	OCH_3	(3) F	(4) CH_3
C_2H_5	OCH_3	(3) F	(4) CH_3

Grupo 2.



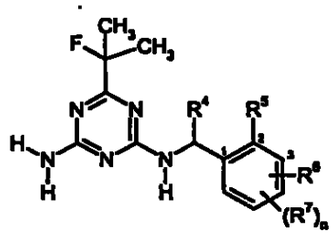
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 3.



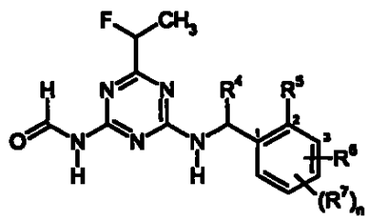
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 4.



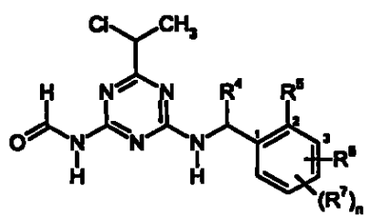
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 5.



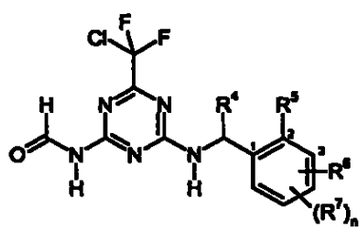
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_r$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 6.



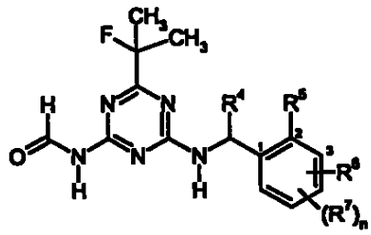
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 7.



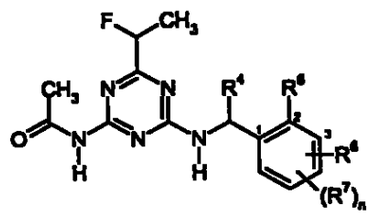
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 8.



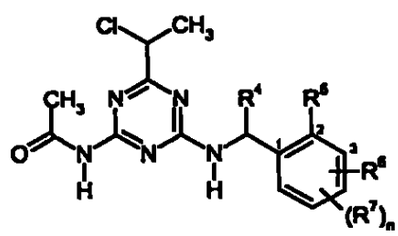
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 9.



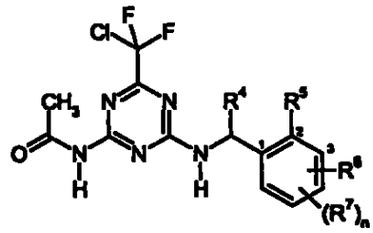
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 10.



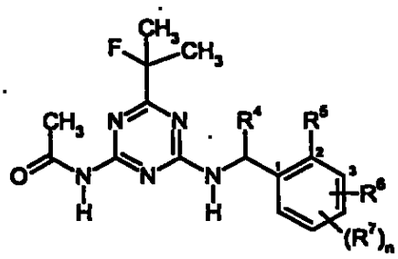
En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Grupo 11.



En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

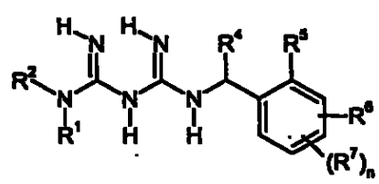
Grupo 12.



En este caso tienen R^4, R^5, R^6 y $(R^7)_n$ los significados indicados anteriormente de manera ejemplificativa en el grupo 1.

Las nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I) presentan interesantes propiedades biológicas. Se caracterizan especialmente por una potente actividad herbicida.

Se obtienen las nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I), si se hacen reaccionar biguanidas de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significadc anteriormente indicado,

-y/o aductos de ácido de los compuestos de la fórmula general (II)-

con compuestos de alcoxicarbonilo de la fórmula general (III)

$$R^3\text{-CO-OR'} \qquad \text{(III)}$$

en la que

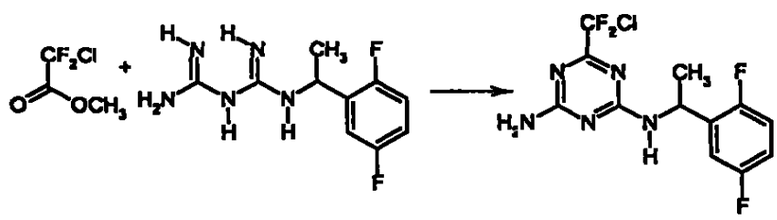
R^3 tiene el significado anteriormente indicado y

R' significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y, en caso dado, se llevan a cabo en los compuestos de la fórmula general (I), obtenidos de este modo, en el ámbito de la definición de los substituyentes, otras transformaciones según métodos usuales.

Si se emplean, por ejemplo, la 1-[1-(2,5-diflúor-fenil)-etil]-biguanida y clorodiflúoracetato de metilo como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



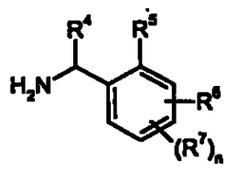
Las biguanidas, a ser empleadas como productos de partida en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

Los aductos de ácido adecuados de los compuestos de la fórmula (II) son sus

productos de adición con ácidos protónicos, tal como, por ejemplo, con ácido clorhídrico (cloruro de hidrógeno), ácido bromhídrico (bromuro de hidrógeno), ácido sulfónico, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico y ácido p-toluenosulfónico.

Los productos de partida de la fórmula general (II) no son todavía conocidos por la literatura; éstos constituyen, a modo de productos nuevos, también un objeto de la presente solicitud.

Se obtienen las nuevas biguanidas de la fórmula general (II), si se hacen reaccionar arilalquilaminas de la fórmula general (IV),



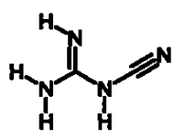
(IV)

en la que

n, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado anteriormente indicado,

-y/o aductos de ácido de los compuestos de la fórmula general (IV), tales como por ejemplo los hidrocloruros-

con cianoguanidinas ("dicianodiamida") de la fórmula (V).



(V)

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción, tal como por ejemplo cloruro de hidrógeno, en caso dado en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo n-decano o 1,2-dicloro-benceno, a temperaturas comprendidas entre 100°C y 200°C (véanse los ejemplos de obtención).

Las biguanidas de la fórmula general (II) pueden emplearse en el procedi-

miento según la invención tras su obtención incluso sin aislamiento intermedio, directamente para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I).

Las arilalquilaminas, necesarias como productos de partida, de la fórmula general (IV) son conocidas y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las DE-A-3819438, DE-A-19650081, EP-A-551821, EP-A-736509, EP-A-778260, US-A-5739401).

Los compuestos de alcoxicarbonilo, a ser empleados, además como productos de partida, en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general, por medio de la fórmula (III). En la fórmula general (III), R^3 tiene preferentemente o bien especialmente aquel significado que ya ha sido indicado anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R^3 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I); preferentemente R' significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente significa metilo o etilo.

Los productos de partida de la fórmula general (III) son productos químicos para síntesis conocidos.

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo preferentemente con empleo de un diluyente. Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención entran en consideración, además de agua, ante todo disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o –dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo,

propionitrilo o butironitrilo; aminas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido, alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmo-nometiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o agua pura.

Como productos auxiliares de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración en general las bases o aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A éstos pertenecen, preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como por ejemplo acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio; además también compuestos nitrogenados orgánicos básicos, tales como por ejemplo trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, diciclohexilamina, etil-diciclo-hexilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabiciclo-[2.2.2]-octano (DABCO), 1,5-diazabiciclo[4.3.0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabi-ciclo[5.4.0]-undec-7-eno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a

temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

El procedimiento según la invención se lleva a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida –en general comprendido entre 0,1 bar y 10 bares-.

Para la realización del procedimiento según la invención se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las substancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

<u>Malas hierbas dicotiledóneas de las clases:</u> Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus,

Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

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

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-anuales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como microencapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los cloroben-cenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emul-sionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenadas de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixiviaciones sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetil-celulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrociánico y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden encontrar aplicación como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo: Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop-(etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrsulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol,

Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen, Haloxyfop(-etoxietilo), Haloxyfop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyrithiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbuthylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin y Triflusulfuron.

También es posible una mezcla con otras substancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas, substancias protectoras contra la ingestión por pájaros, substancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

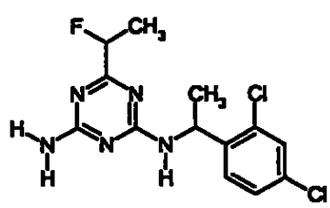
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

La obtención y el empleo de las substancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1:

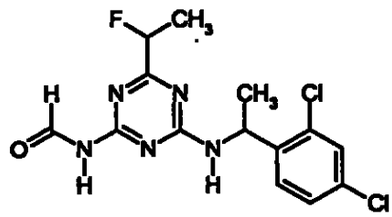


Se añade una solución de 3,6 g (66 mmoles) de metilato de sodio en 60 ml de metanol, a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C) bajo agitación, a una mezcla constituida por 19,0 g (60 mmoles) de hidrocloruro de 1-[1(2,4-dicloro-fenil)-etil]-biguanida (racémico), 9,0 g (60 mmoles) de 2-flúor-propanoato de metilo y 85 ml de metanol. La mezcla de la reacción se agita durante 15 horas a temperatura ambiente y a continuación se diluye hasta aproximadamente un volumen tres veces

mayor mediante adición lenta de agua. El producto cristalino que precipita en este caso se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 5,7 g (29 % de la teoría) de la 6-(1-flúor-etil)-N^2-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina (racemato) con un punto de fusión de 122°C.

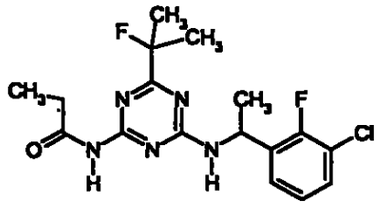
Ejemplo 2.



Se agita durante 15 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C) una mezcla constituida por 3,0 g (9 mmoles) de la 6-(1-flúor-etil)-N^2-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina (racémica), 1,5 g (9 mmoles) de dimetilacetal de la N,N-dimetil-formamida y 40 ml de 1,4-dioxano. Tras adición de 80 ml de agua y 3 ml de ácido clorhídrico concentrado, se agita la mezcla durante otros 30 minutos a la temperatura ambiente. A continuación se aísla el producto cristalino formado mediante filtración por succión.

Se obtienen 1,4 g (43 % de la teoría) de la N-{4-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil-amino]-6-(1-flúor-etil)-1,3,5-triazin-2-il}-formamida (racemato) con un punto de fusión de 172°C.

Ejemplo 3.



Se agita durante 30 minutos a 130°C una mezcla constituida por 3,0 g (9

mmoles) de la 6-(1-flúor-1-metil-etil)-N^2-[1-(3-cloro-2-flúor-fenil)-etil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina y 15 ml de anhidrido del ácido propiónico. A continuación se eliminan cuidadosamente por destilación las partes volátiles bajo presión reducida. El residuo se digiere con 20 ml de etanol y el producto cristalino formado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 3,1 g (89 % de la teoría) de la amida del ácido N-{4-[1-(3-cloro-2-flúor-fenil)-etilamino]-6-(1-flúor-1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2-il}-propiónico (racemato) con un punto de fusión de 130°C.

De manera análoga a la de los ejemplos 1 a 3 así como de acuerdo con la descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla siguiente.

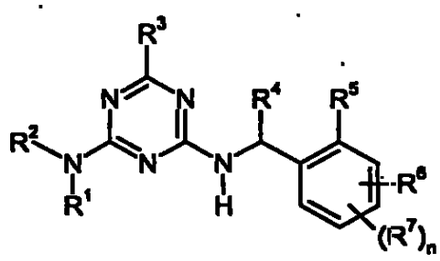
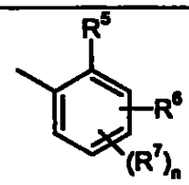
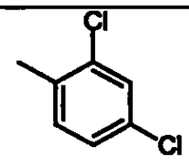
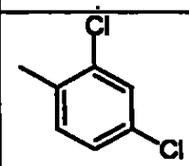
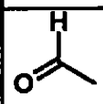
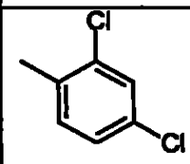
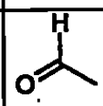
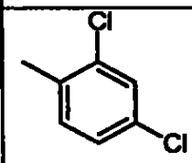
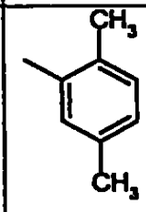
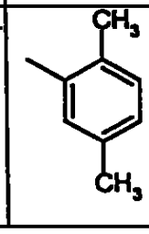
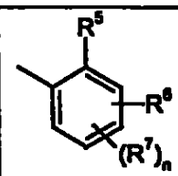
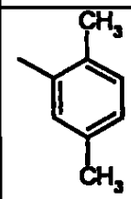
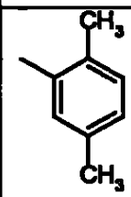
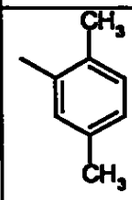
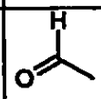
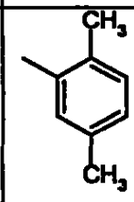
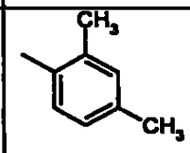
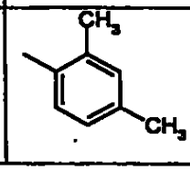
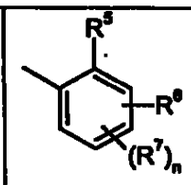
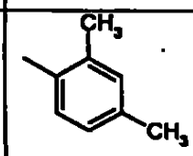
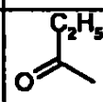
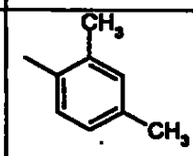
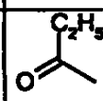
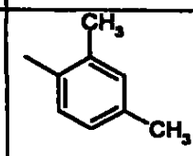
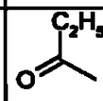
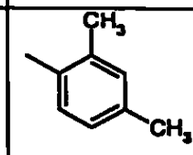
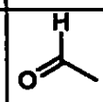
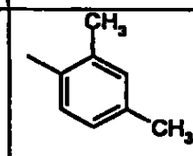
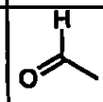
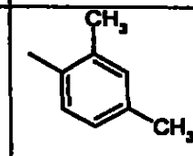
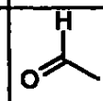
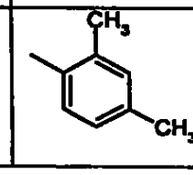
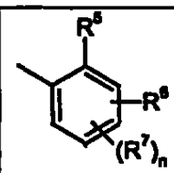
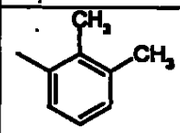
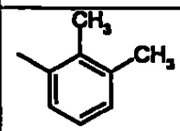
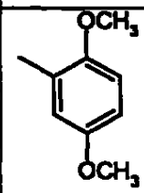
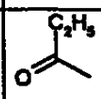
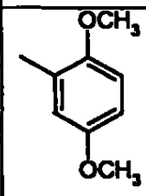
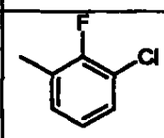
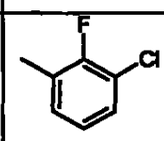
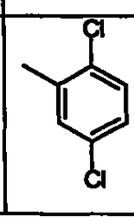


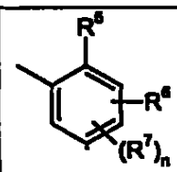
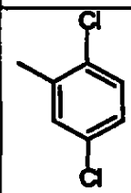
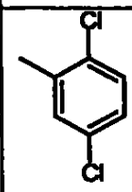
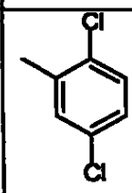
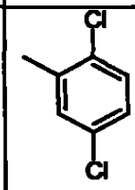
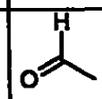
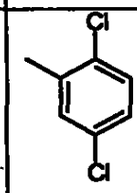
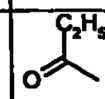
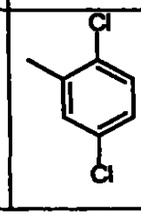
Tabla 1: **Ejemplos de compuestos de la fórmula (I).**

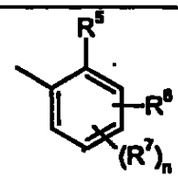
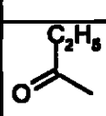
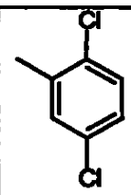
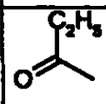
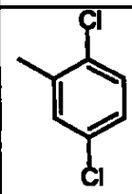
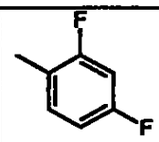
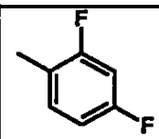
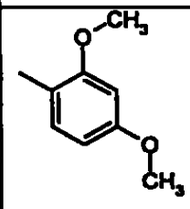
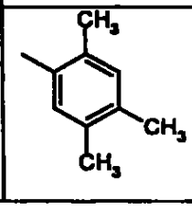
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
4	H	H	CF_2Cl	CH_3		Fp.: 75°C (Racemato)
5	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 154°C (Racemato)
6	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 148°C (Racemato)
7	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 201°C (Racemato)
8	H	H	CF_2Cl	CH_3		logP = 3,28 [a)] (Racemato)
9	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,89 [a)] (Racemato)

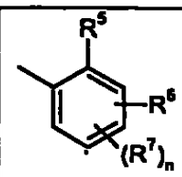
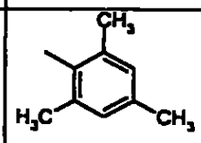
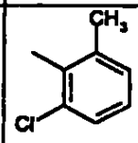
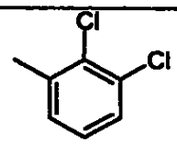
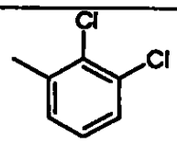
Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
10	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,95 [a)] (Racemato)
11	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 212°C (Racemato)
12	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 202°C (Racemato)
13	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 177°C (Racemato)
14	H	H	CF_2Cl	CH_3		logP = 3,30 [a)] (Racemato)
15	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 88°C (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
16	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 109°C (Racemato)
17	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 147°C (Racemato)
18	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 132°C (Racemato)
19	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 163°C (Racemato)
20	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 193°C (Racemato)
21	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 197°C (Racemato)
22	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 224°C (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
23	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,84 [a)] (Racemato)
24	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 1,97 [a)] (Racemato)
25	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,55 [a)] (Racemato)
26	H		$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,49 [a)] (Racemato)
27	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 1,94 [a)] (Racemato)
28	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,00 [a)] (Racemato)
29	H	H	CF_2Cl	CH_3		Fp.: 64°C (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos.y estereo-químicos
30	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,14 [a)] (Racemato)
31	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		logP = 2,20 [a)] (Racemato)
32	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 202°C (Racemato)
33	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 208°C (Racemato)
34	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 195°C (Racemato)
35	H		CF_2Cl	CH_3		Fp.: 159°C (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
36	H		$CHFCH_3$	CH_3		Fp.: 158°C (Racemato)
37	H		$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 199°C (Racemato)
38	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
39	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
40	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
41	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)

Ej. nº	R^1	R^2	R^3	R^4		Datos físicos y estereoquímicos
42	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
43	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		(amorfo) (Racemato)
44	H	H	$CHFCH_3$	CH_3		logP = 2,14 [a)] (Racemato)
45	H	H	$CF(CH_3)_2$	CH_3		Fp.: 173°C (Racemato)

La determinación de los valores logP, indicados en la tabla 1, se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18) temperatura: 43°C.

(a) Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido: ácido fosfórico acuoso al 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo –los resultados de medida correspondientes se han marcado en la tabla 1 con [a)].

(b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución acuosa de tampón de fosfato 0,01 molar, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo –los resultados de medida

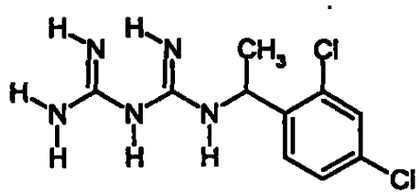
correspondientes se han marcado en la tabla 1 con [b)].

El calibrado se llevó a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre 2 alcanonas sucesivas).

Los valores lambda-máximos se determinaron por medio de los espectros UV con 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Productos de partida de la fórmula (II):

Ejemplo II-1.



x HCl

Se elimina de una mezcla constituida por 57 g (0,30 moles) de 1-(2,4-dicloro-fenil)-etilamina, 36 g de ácido clorhídrico al 30%, 350 ml de tolueno y 200 ml de decano, el agua y una cantidad de tolueno tal que la temperatura interna suba hasta 140°C. A continuación se añaden 25,2 g (0,30 moles) de cianoguanidina y la mezcla de la reacción se calienta durante 3 horas a 140°C hasta 145°C. Tras refrigeración se añade acetona a la mezcla y el producto cristalino formado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 88,5 g (95 % de la teoría) del hidrocloruro de la 1-[1-(2,4-dicloro-fenil)-etil]-biguanida en forma de producto sólido.

De manera análoga a la del ejemplo II-1 pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 2 siguiente.

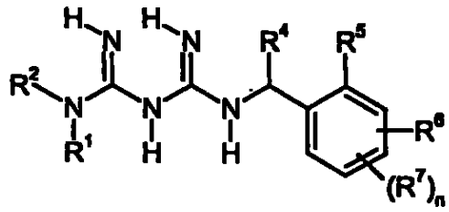
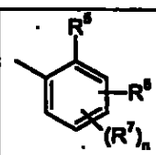
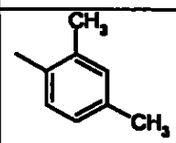
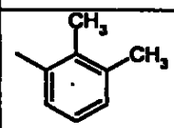
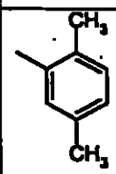
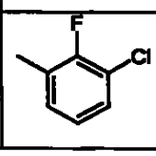
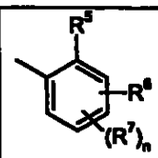
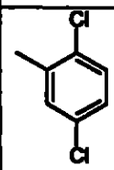
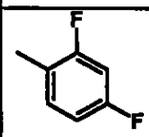
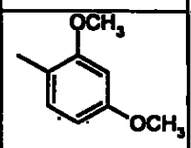
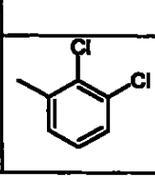


Tabla 2:

Ejemplos de compuestos de la fórmula (II).

En este caso se trata respectivamente de los correspondientes hidrocloruros.

Ej. nº	R^1	R^2	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
II-2	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-3	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-4	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-5	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)

Ej. - nº	R^1	R^2	R^4		Datos físicos y estereo-químicos
II-6	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-7	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-8	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)
II-9	H	H	CH_3		(amorfo) (Racemato)

Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de

tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 15, 18, 27 y 38, con una compatibilidad parcialmente buena para con las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Las plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, se pulverizan con la preparación del producto activo de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

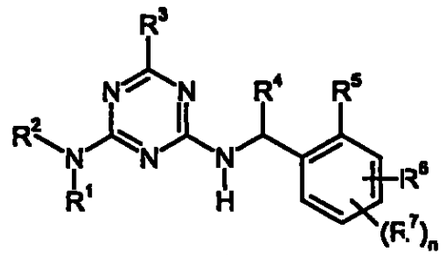
0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 3, 5, 14, 15, 16, 18, 27, 28, 37, 38 y 39, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, algodón, cebada y trigo, un potente efecto contra las malas hierbas.

REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de la fórmula general (I)



(I)

en la que

n significa los números 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R^2 significa hidrógeno, significa formilo, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi-carbonilo o alquilaminocarbonilo con, respectivamente, 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa dialquilaminoalquilidenamino con 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo o bien en los grupos alquilideno,

R^3 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituido en caso dado por hidroxi, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-sulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^4 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano,

por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^5 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino o dialquilamino respectivamente con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y –en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, o dialquil-amino con respectivamente 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, y

R^7 significa halógeno o significa alquilo o alcoxi con, respectivamente, 1 a 3 átomos de carbono.

2.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R^2 significa hidrógeno, formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$, significa dimetilaminometilenamino o dietilamino-

metilenamino,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por hidroxi, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butiroilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, o s-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y -en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo,

metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

3.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0, 1 o 2,

R^1 significa hidrógeno, metilo o etilo,

R^2 significa hidrógeno, formilo, metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa dimetilaminometilenamino,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por acetilo, por propionilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro o por metilo,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, o significa ciclopropilo, substituido respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, o por metilo,

R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa

también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, o etoxi.

4.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0 o 1,

R^1 significa hidrógeno,

R^2 significa hidrógeno, formilo, acetilo o propionilo,

o el agrupamiento $N(R^1,R^2)$ significa, también dimetilamino-metilenamino,

R^3 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,

R^4 significa metilo o etilo,

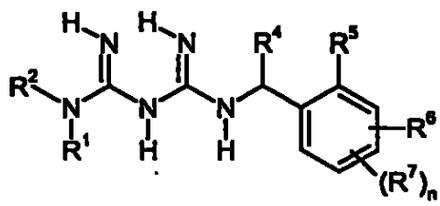
R^5 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi y –en el caso en que n signifique el número 2- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propo-

xicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino y

R^7 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi o etoxi.

5.- Procedimiento para la obtención de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque se hacen reaccionar biguanidas de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4

-y/o aductos de ácido de los compuestos de la fórmula general (II)-

con compuestos de alcoxicarbonilo de la fórmula general (III)

$$R^3\text{-CO-OR'} \qquad \text{(III)}$$

en la que

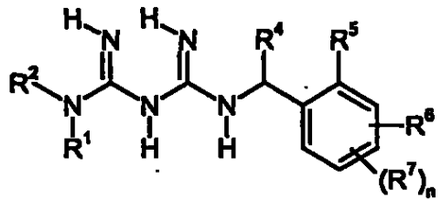
R^3 tiene el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4

R' significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y, en caso dado, se llevan a cabo en los compuestos de la fórmula general (I), obtenidos de este modo, en el ámbito de la definición de los substituyentes, otras transformaciones según métodos usuales.

6.- Compuestos de la fórmula general (II)



(II)

en la que

n, R^1, R^2, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4.

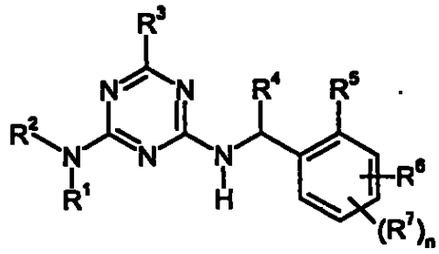
7.- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se tratan las plantas indeseables y/o su medio ambiente con al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

8.- Empleo de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, para la lucha contra las plantas indeseables.

9.- Agentes herbicidas caracterizados porque tienen un contenido en un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas arilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



(I)

en la que n, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 tienen el significado indicado en la descripción.

a un procedimiento y a productos intermedios para su obtención y a su empleo como herbicidas.

197
0698
6028

CONSULADO DE COLOMBIA

C E R T I F I C A C I O N

No. 145

Bonn, 8 de agosto de 1996

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares de Colombia en Bonn, vistos los documentos presentados por los interesados, CERTIFICA: Que el señor Dirk Heiderhoff quien como Notario en Leverkusen autenticó la firma de los signatarios DR. ROLF BRAUN y DR. JOACHIM GREMM del documento precedente, ejercían en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la empresa BAYER AKTIENGESELLSCHAFT está constituida de acuerdo con las leyes de la República Federal de Alemania y cumple su objeto conforme a las mismas según el Registro Comercial HRB 1122 del Tribunal de Primera Instancia de Leverkusen; que los señores BRAUN y GREMM, quienes firmaron el documento precedente, son los representantes legales de la empresa arriba mencionada.

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

Pagado el impuesto de timbre
y derechos consulares.
Valor US$106,oo = DM$169,60

JUAN PABLO GONZALEZ
Segundo Secretario
Encargado de las Funciones Consulares

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
1996 AGO 23 A 11:58
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.
CUYA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DESEMPEÑA LAS FUNCIONES INDICADAS
EXTERIORES

N, L, K

198

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª Nº 72-35
BOGOTÁ, D.E. - COLOMBIA

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned/Yo (nosotros), abajo firmado (s)
BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

of/domiciliado (s) en D-51368 Leverkusen, GERMANY,

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZAL PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª Nº 72-35, Bogotá, Colombia, en obedecimiento a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

In due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª Nº 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matt[illegible] Power of Attorney, compromise, c[illegible] case, desist, cancel, receive, [illegible] by representatives without a [illegible] Attorney.

Given and signed this/Dado y firmado hoy 31st July 1996

in/en Leverkusen

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Signature / Firma

06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

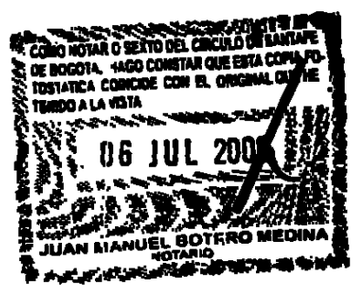
CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-1 (MINUTA Nº 12.1.1.2.5)

LEGALIZACION

El Señor Cónsul de Colombia debe expedir un *certificado consular* sobre (1) la existencia legal de la compañía que otorga el poder, (2) que ésta ejerce su objeto social, y (3) que las personas que otorgan el poder están autorizadas para darlo. A este efecto les solicitamos que muestren al Señor Cónsul las pruebas que acreditan esos hechos (1), (2) y (3).

LEGALIZATION

The Colombia Consul must issue a *consular certi*[illegible] the legal existence of the company whi[illegible] Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exerci[illegible] company purposes, and (3) that the persons who ex[illegible] Power of Attorney is autorized to do so. To this effec[illegible] show the Consul the evidence to prove the above facts [illegible] and (3).



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL DE COLOMBIA: Según los artículos 65 del C. de P.C. y 480 del C. de Co., l poderdante es una sociedad, el Señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su tencia, que ejerce su objeto social y que quien confiere el poder es su representante.

issue a consular certific
company which
is in actual exerci
the persons who exe
do so. To this effect
rove the above facts

URNr. 1799/1996

Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften der Herren

1. Dr. Rolf Braun, geschäftsansässig in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,

2. Dr. Joachim Gremm , geschäftsansässig in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht vom heutigen Tage in das Handelsregister des Amtsgerichts Leverkusen - HRB 1122 -, daß die genannten Herren berechtigt sind, die Bayer Aktiengesellschaft in Leverkusen als Prokuristen gemeinschaftlich zu vertreten.

Leverkusen, den 31. Juli 1996

Notar

Die Echtheit der vorstehenden Unterschrift des Notars Durch Präsidentenverfügung sowie die Echtheit des beigedrückten Dienstsiegels - siegels werden hiermit bestätigt. Zugleich wird bescheinigt, daß der Notar zur Vornahme der Amtshandlung befugt war.

Köln, den 02. Aug. 1996

Der Präsident des Landgerichts

(Dr. Wohlrich)

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE
TENIDO A LA VISTA
06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

DER PRÄSIDENT DES AMTSGERICHTS KÖLN

CONSULADO GEN
BONN

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA CONCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

06 JUL 200

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

TRADUCCION OFICIAL No. 5424

de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

---

(A continuación de la representación y poder conferido a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO tpa, 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia, el 31 de julio de 1996 por los señores Dr. Rolf Braun y Dr. Joachim Gremm, apoderados de la Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, RFA:)

Protocolo notarial 1799/1996

Certifico la autenticidad de las firmas puestas ante mí por los señores

1. Dr. Rolf Braun, domiciliado en D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,

2. Dr. Joachim Gremm, domiciliado en D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,

- a quienes conozco en persona-.

06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA

Certifico por haber tenido a la vista el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Leverkusen - HRB 1122 - que los señores mencionados están facultados, en su calidad de apoderados, para representar conjuntamente a la Bayer Aktiengesellschaft, domiciliada en Leverkusen.

Leverkusen, 31 de julio de 1996

Fdo.: firma ilegible

Notario

(Hilo y oblea notarial en relieve:)

Dirke Heiderhoff - Notario de Leverkusen

(dorso:)

Se certifica la autenticidad de la firma antecedente del notario de Leverkusen, Dirke Heiderhoff, y la del sello oficial que la acompaña. Igualmente se certifica que el mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

Colonia, 02 de agosto de 1996

El Presidente del Juzgado Municipal

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Wohlmich)

(sello redondo en tinata:)

El Presidente del Juzgado Municipal de Colonia

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

06 JUL 2000

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas antecedentes por el Consulado de Colombia en Bonn bajo el No. 145 del 08 de agosto de 1996 y por el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia bajo el No. 198692 del 23 de agosto de 1996.

Pagados Impuesto de timbre y derechos consulares US$ 106,--

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Santafé de Bogotá, 2 de septiembre de 1996

COMO NOTARIO SEXTO DE SANTAFE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE
C. C.
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLOS)
EN ESTA NOTARIA.
09 SET. 1996
SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

203

CAVELIER
ABOGADOS

TELEFAX: (57) (1) 2358880
CABLES CAVELEYES
TELEX: 45479

EDIFICIO SISKI
CARRERA 41, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO: (57) (1) 2120100

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 31-07-96

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER
T.P.A. No. 832
C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

Acepto:

EMILIO FERRERO
T.P.A. Nº 31.929
C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-780-2

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Santafé de Bogotá D. C. 06 SET 1995
Ante MI JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA
Compareció(eron) personalmente,
[illegible]
[illegible]
quien(es) exhibió(eron) la(s) C. C. 4318019
y la(s) Libreta(s) militar(es). 2877924
77852 77 39929
domiciliado(s) en [illegible] y [illegible] la(s) firma(s) que aparece(n) [illegible] la(s) suya(s), y que el contenido [illegible]
En constancia [illegible]

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA FOTOSTATICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
06 JUL 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

[illegible]

[illegible]

REPUBLICA DE COLOMBIA
Juan Manuel Botero Medina
Notario Sexto
Santafé de Bogotá D. C.

Folios 204 a 206 corresponden a Tarjeta temática y de Propietario 202001

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 36 633.0

(32) FECHA DE PRESENTACIÓN: 04 - 08 - 1999

(33) PAÍS: DE.

(51) INT.CL.: A01N 043/066

(71) SOLICITANTE: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

(72) INVENTOR(ES): 1- Dr. Hans-Jochem RIEBEL
2- Dr. Stefan LEHR
3- Dr. Kristian KATHER
4- Dr. Stefan HERRMANN
(*)

(74) APODERADO: EMILIO FERRERO

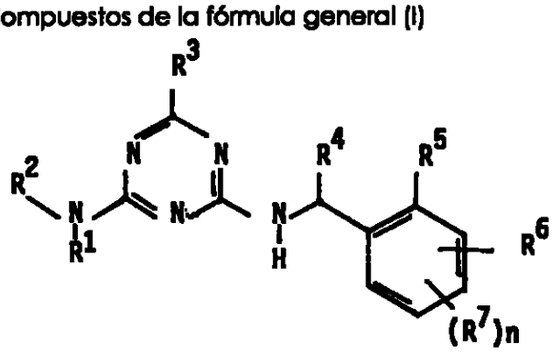
(54) TÍTULO: **ARILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS**

(*) 5- Dr.Mark-Wilhelm DREWES, 6- Dr.Peter DAHMEN, 7- Dr.Dieter FEUCHT, 8- Dr.Rolf PONTZEN, 9-Dr.Yukiyoshi WATANABE, 10- Toshio GOTO

(57) RESUMEN:

REIVINDICACIÓN:

1. Compuestos de la fórmula general (I)



(I)

en la que

n significa los números 0,1,2 o 3,

R^1 significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R^2 significa hidrógeno, significa formilo, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo alquilaminocarbonilo con respectivamente, 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,
o el agrupamiento $N(R^1, R^2)$ significa dialquilaminoalquilidenamino con 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo o bien en los grupos alquilideno,

R^3 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituido en caso dado por hidroxi, por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-sulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa cicloalquilo con3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con1 a 4 átomos de carbono,

R^4 significa alquilo con 1 a 5 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^5 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxi-carbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino o dialquilamino respectivamente con 1 a 5 átomos de carbono en los grupos de alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y en el caso en que n signifique los números 2 o 3- significa también hidrógeno,

R^6 significa ciano, nitro, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxi-carbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, o dialquil-amino con respectivamente 1 a 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, y

R^7 significa halógeno o significa alquilo o alcoxi con, respectivamente, 1 a 3 átomos de carbono.

NOTA. FAVOR NO PUBLICAR ANTES DE LOS 18 MESES A PARTIR DE LA FECHA DE PRESENTACIÓN DE LA SOLICITUD.

206

Industria y Comercio

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS

Royal Technologies S.A.

Item	Expediente No	200058183	No de Folio 206
		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA	1	
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones: Arte Final

~~210~~ 207

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176039-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 39,626
FECHA : JUNIO 23 DE 2000

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : [illegible] Folios: [illegible]
Fecha (AMD): [illegible] 17:24:19
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: [illegible] DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

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

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2766386	19,194,500.00

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

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

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cob 00698-801-119.0

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

ZTT
208

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCIÓN [X] **MODELO DE UTILIDAD [ ]**

- Nombre e identificación del Solicitante 1 [ ]
- Nombre e identificación del Inventor 1 [ ]
- Título o nombre de la Invención 1 [ ]
- Descripción 4 [ ]
- Reivindicaciones 189 [ ]
- Resumen 196 [ ]
- Comprobante de Pago 210 [ ]

COMPLETA [X] INCOMPLETA [ ]

DISEÑO INDUSTRIAL [ ]

- Nombre e identificación del peticionario [ ]
- 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:

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : [illegible] Folios: [illegible]
Fecha [illegible]: [illegible] 17:24:13
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: [illegible] DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 00-58183
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 [x]	NO [ ]	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 [x]	NO [ ]	NO APLICABLE [ ] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de Paris; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.).
SI [x]	NO [ ]	CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS

BSERVACIONES

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

SI [x]	NO [ ]	Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto,
SI [x]	NO [ ]	Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D.C., 3 de Agosto del 2000

EXAMINADOR JURIDICO.
202022

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

PRIMER EXAMEN DE FORMA

Radicación no 0-58183

Concepto Técnico no 770 . Clasificación Internacional de Patentes A01N43/66

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 [X] NO [ ]	Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a).
SI [X] NO [ ]	Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a).
SI [X] NO [ ]	Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e).
SI [ ] NO [X]	Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b).
SI [ ] NO [X]	Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c).
SI [X] 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 [X]	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 [X] NO [ ]	Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94.
SI [X] 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 [X] 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 [X] 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 [X]	**CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI [X] NO [ ] ver hoja(s) anexa(s)

Bogotá, D.C., 10 de noviembre de 2000

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

214
241

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
1er examen de forma

CONCEPTO TÉCNICO No. **1770**
EXPEDIENTE No. **0-58183** IPC: **A01N43/66**

Complementar el título indicando el proceso de obtenciòn de los compuestos y los herbicidas que los contienen.

Tanto en la descripción como en la reivindicación 5 es muy confuso cuando la reacción ocurre en caso dado, se llevan a cabo en los compuestos de la fórmula (I), obtenidos de este modo, en el ámbito de la definición de los sustituyentes otras transformaciones según métodos usuales; se debe modificar aclarando la materia que se quiere proteger en ese caso, debe redactarse claramente porque en realidad no tiene ningún sentido.

No se entiende cómo se lleva a cabo en los compuestos, ni que se desea expresar con en el ámbito de la definición de los sustituyentes, a cuáles sustituyentes se refiere, y cuáles son las otras transformaciones, es de anotar que las transformaciones posteriores a la obtención del compuesto objeto de la solicitud están por fuera del objeto ya que eso sería el procedimiento para obtener otro tipo de compuestos.

De acuerdo con las observaciones realizar las correcciones necesarias presentando NUEVO CAPÍTULO REIVINDICATORIO COMPLETO, de tal forma que sea claro y preciso.

Anexar nuevas tarjetas de archivo temático y de propietario y el extracto para la publicación.

202001
Examinador Técnico de Patentes

Bogotá, D.C. 10 de noviembre de 2000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

212

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

EXPEDIENTE 00-58183

AUTO 2859

LA JEFE DE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE:

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor EMILIO FERRERO como apoderado de la Sociedad 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 16 NOV. 2000

LA JEFE DE LA DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 20 NOV 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