

01 2813

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 01002813 00000000
Fecha (AMB) : 2001-01-16 17:03:05
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRADO/ 411 PRESENTA
E Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
ION **NO 0153275**
TRAMITE 02 EVENTO 01 ACTUACION 411
40185 10/08/01 327 10/08/01 327

Folios: 510

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT y
NIHON BAYER AGROCHEM K.K.** ✓
Constituidas bajo las leyes de Alemania y Japón

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

Alemania y Japón ✓

Departamento o Estado

Dirección

10-8, Takanawa 4-chome, Minato-ku ✓

Ciudad

D 51368 Leverkusen y Tokio 108,
respectivamente

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

EMILIO FERRERO

Dirección y Domicilio

Carrera 4 No. 72-35

Ciudad

Bogotá, Colombia.

Teléfono

3-47-36-11

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor(es)

1- Dr. Otto SCHALLNER
3- Dr. Hans-Georg SCHWARZ
5- Dr. Dorothee HOISCHEN
7- Dr. Peter DAHMEN
9- Dr. Rolf PONTZEN
11- Dr. Shinichi NARABU

2- Dr. Stefan LEHR
4- Dr. Klaus-Helmut MÜLLER
6- Dr. Mark-Wilhelm DREWES
8- Dr. Dieter FEUCHT
10- Dr. Akihiko YANAGI
12- Dr. Toshio GOTO ✓

Identificación

1- Noldeweg 22, 40789 Monheim, Alemania
2- Ricarda-Huch-Str. 38, 40764 Langenfeld, Alemania
3- Heinenbusch 19a, 40764 Langenfeld, Alemania
4- Solfstr. 19, 40593 Düsseldorf, Alemania
5- Hortensienstr. 31, 40474 Düsseldorf, Alemania
6- Goethestr. 38, 40764 Langenfeld, Alemania

Dirección

Ciudad

Continuación hoja anexa.....

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

ARILCETONAS SUBSTITUIDAS

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País

DE.

DE.

Convención de París

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(32) Fecha

17 de Enero de 2000 ✓

14 de Agosto de 2000 ✓

(31) No. Solicitud

10001588.3 ✓

10089723.9

Colo: 12513-801-001-7 JJC/mrh-ID-1

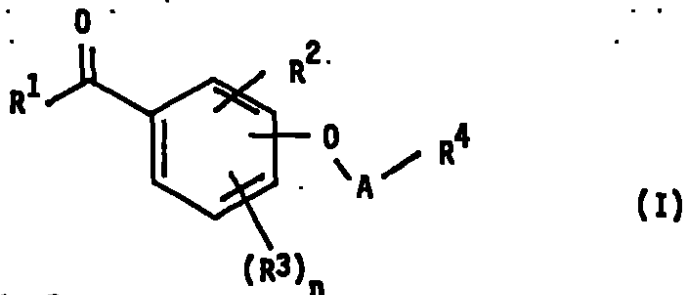
(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

A 01 N-36/04 2.2.5

10.01.2001

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I)

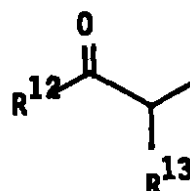
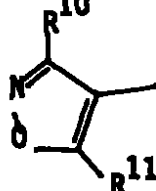
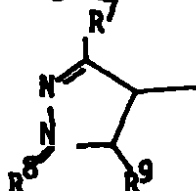
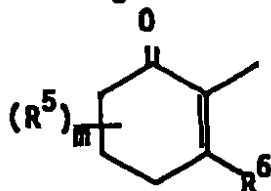


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileno)

R1 significa uno de los agrupamientos siguientes



donde m, R5, R6, R7, R8, R9, R10, R11, R12 y R13 tienen uno de los significados indicados en la descripción, Continúa.....

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica (2) ☒

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC (2) ☒

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 N/A: 10001588-3 y ☒

Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior N/A: 10039723-9

Traducción simple (2) ☒

Capítulo descriptivo ☒

Dibujos, planos necesarios ☐

Capítulo reivindicatorio ☒

Tarjeta archivo propietario 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

Emilio Ferrero

NOMBRE EMILIO FERRERO

CC. 438.019 de Usaquén

T.P.No 31.929

Continuación Resumen.....

- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquisulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo, substituidos respectivamente en caso dado, y
- R⁴** significa un agrupamiento heterocíclico con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, substituido en caso dado,
- así como a procedimientos para su obtención, a productos intermedios y al empleo de estos compuestos como herbicidas.

Continuación Dirección Inventores.....

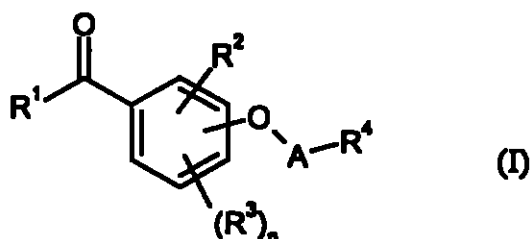
- 7- Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss, Alemania**
- 8- Ackerweg 9, 40789 Monheim, Alemania**
- 9- Am Kloster 69, 42799 Leichlingen, Alemania**
- 10- 2-40-11, Higashijonnan, Oyama-shi, Tochigi, 323-0829, Japón**
- 11- 13850, Ohashi-machi, Ibaraki, 307-001 Yuki-shi, Japón**
- 12- 214-18, Koganei, Shimotsuga-gun, Kokubunji-machi, Tochigi 329-0414, Japón**

ARILCETONAS SUBSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas arilcetonas substituidas, a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se sabe ya que determinadas arilcetonas substituidas tienen propiedades herbicidas (véanse las EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, EP-A-352543, EP-A-418175, EP-A-487357, EP-A-527036, EP-A-527037, EP-A-560483, EP-A-609797, EP-A-609798, EP-A-625505, EP-A-625508, EP-A-636622, US-A-5804532, US-A-5834402, US-A-5846906, US-A-5863865, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328). El efecto de estos compuestos sin embargo no es satisfactorio desde todos los puntos de vista.

Se han encontrado ahora las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I)

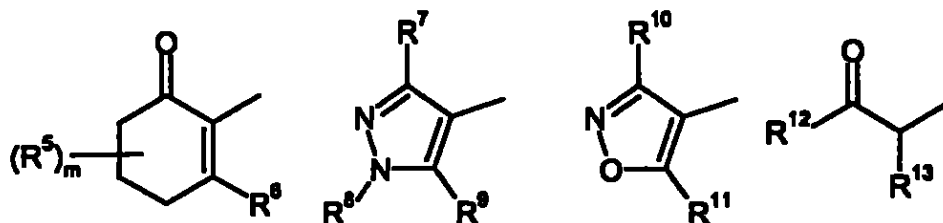


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileno),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m significa los números 0 hasta 6,

R⁵ significa halógeno o significa alquilo, alquiltio o arilo substituidos respectivamente en caso dado, o -en el caso en que m signifique 2- significa en caso dado también junto con un segundo resto R⁵ alcanodiilo (alquileo),

R⁶ significa hidroxí, formiloxi, halógeno, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcóxicarbonilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁸ significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi,

alquiniilo, arilalcoxi, arilcarbonilo, arilcarbonilalcoxi o arilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

- R¹⁰** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfonilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹¹** significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹²** significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R¹³** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfonilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R⁴** significa un agrupamiento heterocíclico, monocíclico o bicíclico, saturado o insaturado, con 4 a 12 miembros, en caso dado substituido, que contiene de 1 a 4 heteroátomos (hasta 4 átomos de nitrógeno y en caso dado –alternativa o adicionalmente- 1 o 2 átomos de oxígeno y 1 o 2 átomos de azufre, o uno o dos agrupamientos SO- o uno o dos agrupamientos SO₂-), y que contiene

además de uno hasta tres grupos oxo ($C=O$) y/o grupos tioxo ($C=S$) como componentes del heterociclo,

-con inclusión de todas las formas tautómeras posibles de los compuestos de la fórmula general (I) y de las sales o bien aductos con ácido o con bases posibles de los compuestos de la fórmula general (I)-.

En las definiciones las cadenas hidrocarbonadas, tales como alquilo o alcanodiilo –incluso en combinación con heteroátomos, como en el alcoxi- son respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los compuestos según la invención de la fórmula general (I) contienen en caso dado uno o varios átomos de carbono substituidos de manera asimétrica y por lo tanto pueden presentarse en diversas formas enantiómeras (formas con la configuración R y S) o bien diastereómeras. La invención se refiere tanto a las diversas formas posibles enantiómeras o bien estereoisómeras individuales de los compuestos de la fórmula general (I) así como también a las mezclas de estos compuestos estereoisómeros.

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

Preferentemente,

n significa los números 0 o 1.

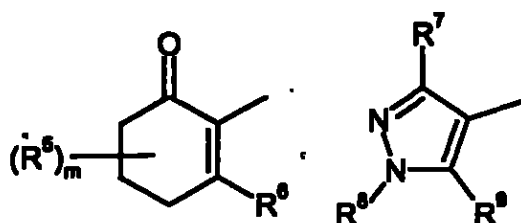
Preferentemente,

m significa los números 0, 1, 2, 3 o 4.

Preferentemente,

A significa alcanodiilo (alquilenos) con 1 a 6 átomos de carbono,

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



Preferentemente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

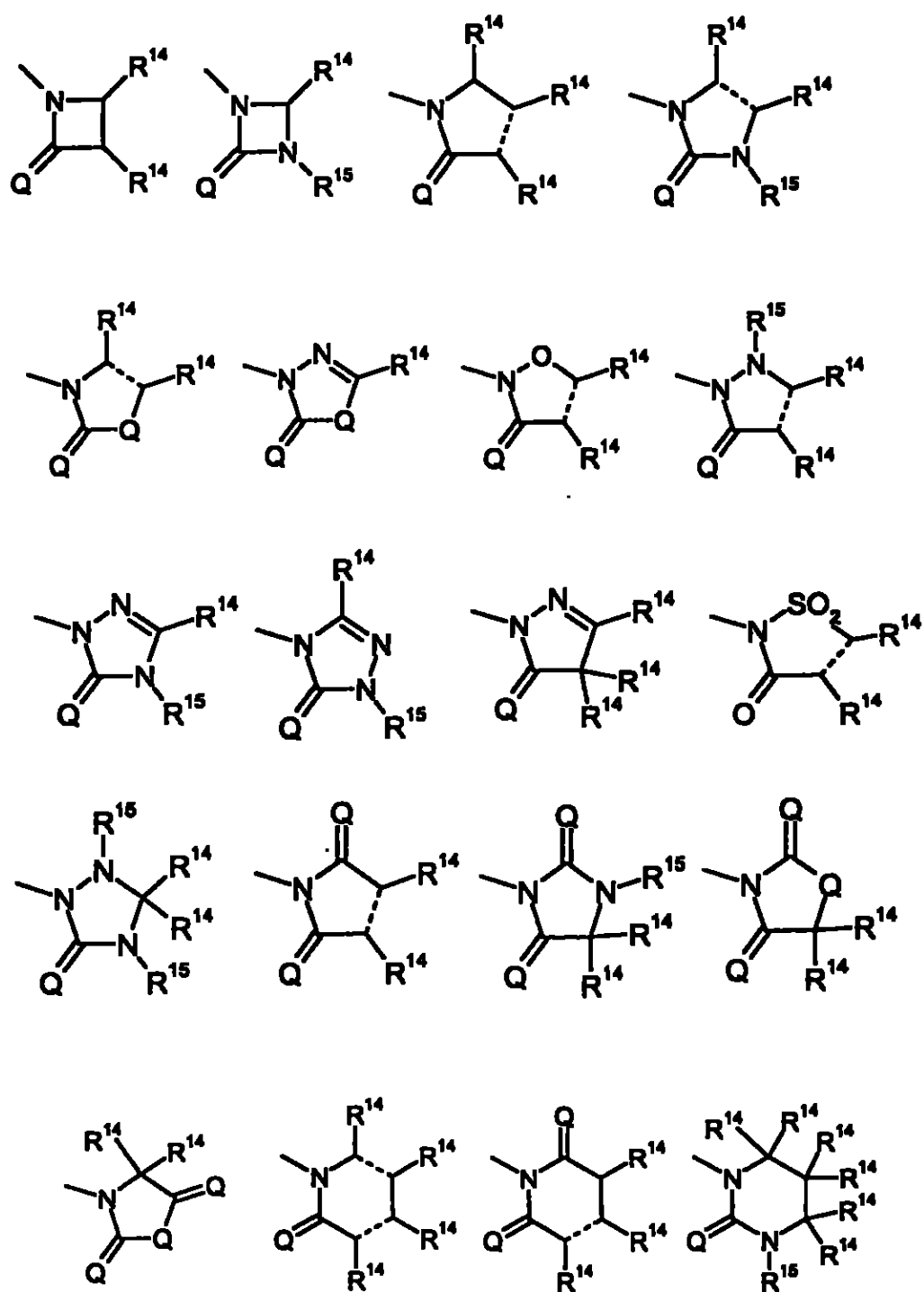
Preferentemente,

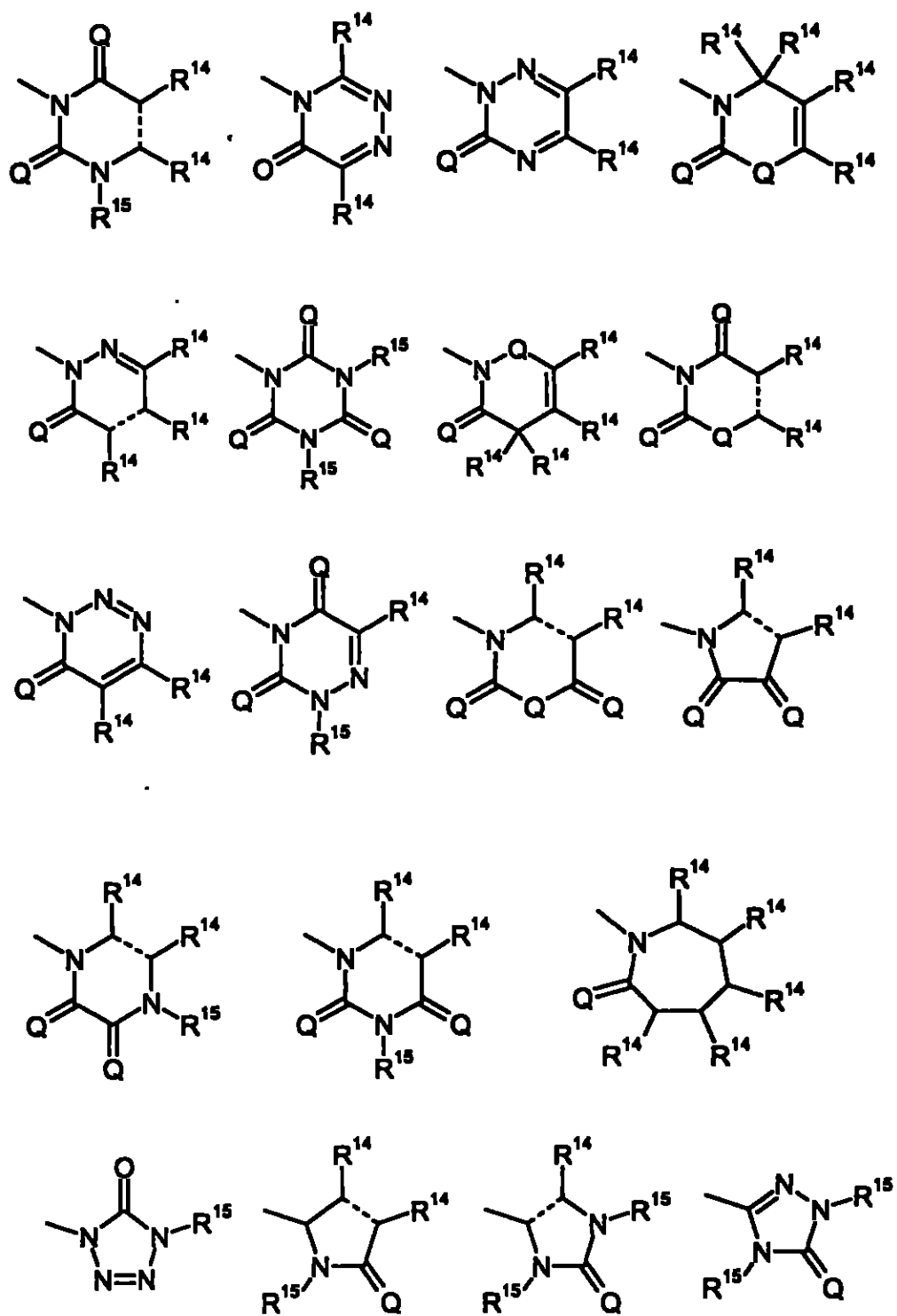
R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

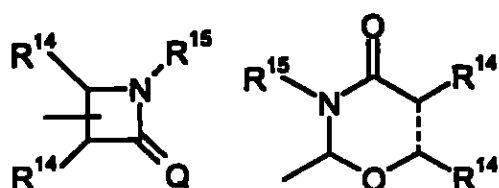
Preferentemente,

R⁴ significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes

-7-







siendo el enlace dibujado con trazos discontinuos respectivamente un enlace sencillo o un enlace doble,

Q significa oxígeno o azufre,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilamino o dialquilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino

substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa también junto con el resto R^{14} contiguo un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, alquilidenamino con hasta 4 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino o alcanoilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alquinilo o alqueniloxi respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa alcanodiilo con 3 hasta 5 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

Preferentemente,

R⁵ significa halógeno, significa alquilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto **R⁵** significa alcanodiilo (alquilenos) con 2 hasta 6 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁶ significa hidroxi, formiloxi, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa

alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcoxycarbonilo respectivamente con 1 hasta 6 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 significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamen-

te con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 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.

Preferentemente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹² significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono

substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 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.

De forma especialmente preferente,

m significa los números 0, 1, 2 o 3.

De forma especialmente preferente,

A significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), etano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma especialmente preferente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo,

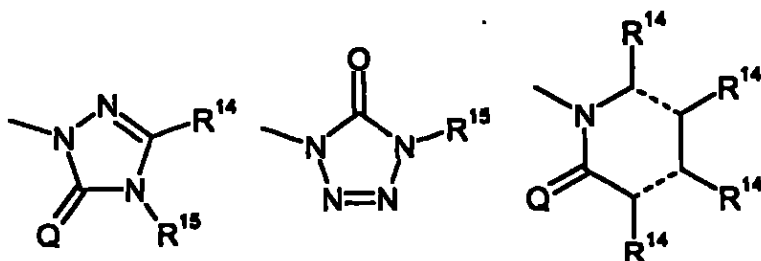
etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo.

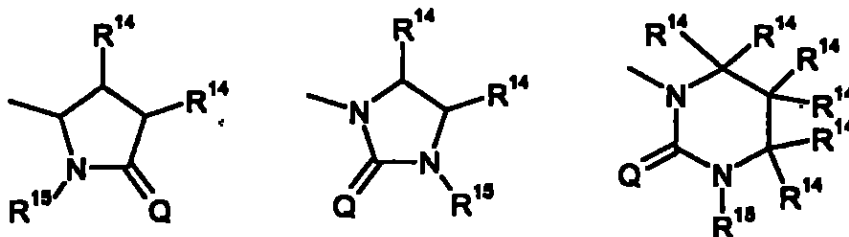
De forma especialmente preferente,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes





De forma especialmente preferente,

R³ significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo o por metoxi, o significa en caso dado también –en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R³ etano-1,2-diilo (dimetileno) propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma especialmente preferente,

R⁶ significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o

por bromo, o significa fenoxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benciloxi, bencilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma especialmente preferente,

- R⁷** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

- R⁸** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por

flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o t-butirolíoxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilamínocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma especialmente preferente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolílo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio,

etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma especialmente preferente,

- R¹¹** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, 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.

De forma especialmente preferente,

- R¹²** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, 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.

De forma especialmente preferente,

- R¹³** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino o di-i-propilamino, significa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro,

por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que los restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo.

De forma especialmente preferente,

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i- o s-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo o propeniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

A significa metileno o dimetileno.

De forma muy especialmente preferente,

m significa los números 0, 1 o 2.

De forma muy especialmente preferente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiométilo, metilsulfinilmétilo, metilsulfonilmétilo, metoxi, etoxi, difluórmetoxi, trifluórmetoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

R³ significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiométilo, metilsulfinilmétilo, metilsulfonilmétilo, metoxi, etoxi, difluórmetoxi, trifluórmetoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa fenilo, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto **R⁴** significa etano-1,2-diilo (dimetileno), propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma muy especialmente preferente,

R⁶ significa hidroxi, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi o

propinilo, o significa fenilo, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benzoilo, benzoilmetoxi, fenilsulfonilo, fenilmetoxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmtilo o por trifluórmtilo.

De forma muy especialmente preferente,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R⁸ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmtilo o por trifluórmtilo.

De forma muy especialmente preferente,

R⁹ significa hidroxilo, formilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi,

acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o

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

De forma muy especialmente preferente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o 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 substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxil, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, 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, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, propeniloxi, propeniltio o propenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclopropiloxi, ciclopropilamino, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi o ciclopropilmetiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado

por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo.

De forma muy especialmente preferente,

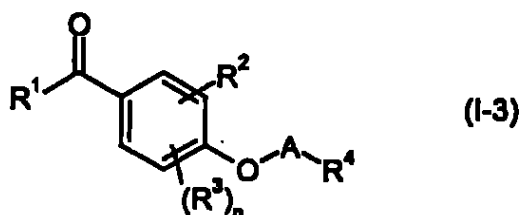
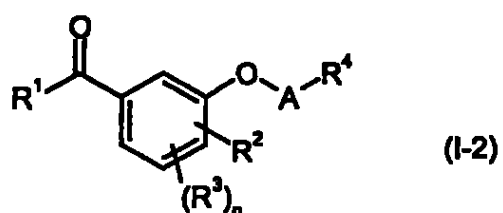
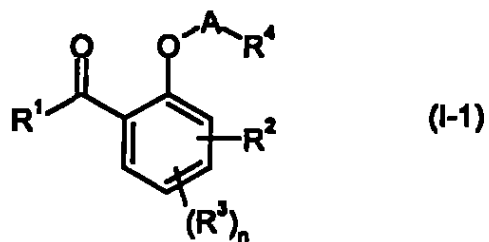
R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo, significa ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopropilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

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

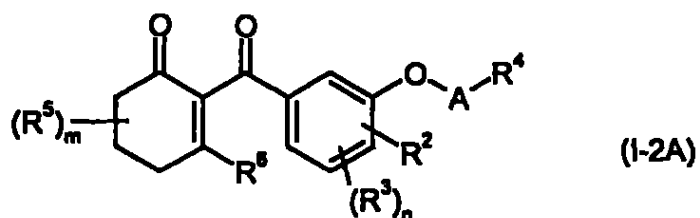
Según la invención son muy especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

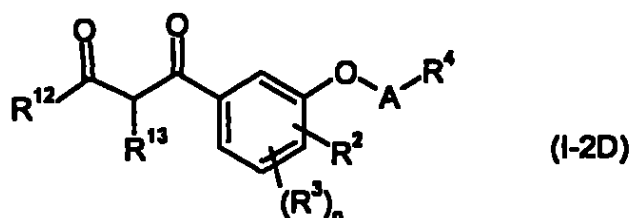
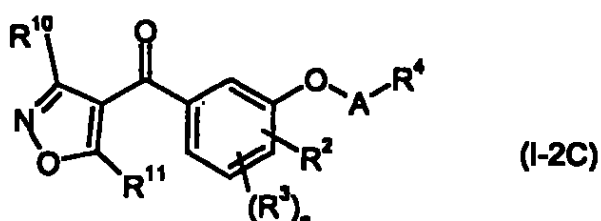
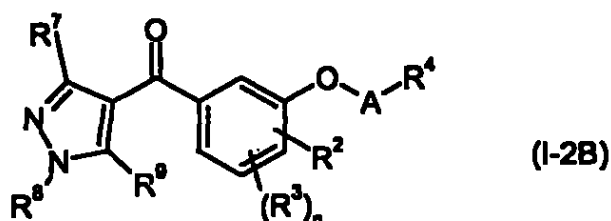
Se señalarán especialmente los compuestos de las fórmulas generales (I-1) hasta (I-3):



en este caso n, A, R¹, R², R³ y R⁴ tienen respectivamente los significados mas preferentes.

Se señalarán de forma muy especial los compuestos de las fórmulas generales (I-2A) hasta (I-2D):





en este caso m , n , A , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} tienen respectivamente el significado mas preferente.

El objeto de la invención son también las sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio de los compuestos de la fórmula (I), en la que preferentemente n , A , R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados indicados anteriormente como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes.

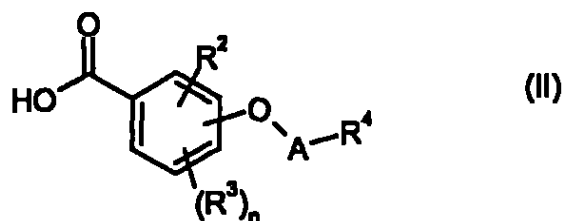
Las definiciones de los restos dadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los correspondientes productos de partida o productos intermedios necesarios para la obtención.

Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se caracterizan por una actividad herbicida potente y selectiva.

Se obtienen las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I), si

(a) Se hacen reaccionar ácidos benzoicos substituidos de la fórmula general (II)



en la que

n, A, R², R³ y R⁴ tienen el significado anteriormente indicado,

-o derivados reactivos de los mismos, tal como por ejemplo los correspondientes halogenuros de acilo, cianuros de acilo o ésteres-

con compuestos de la fórmula general (III)



en la que

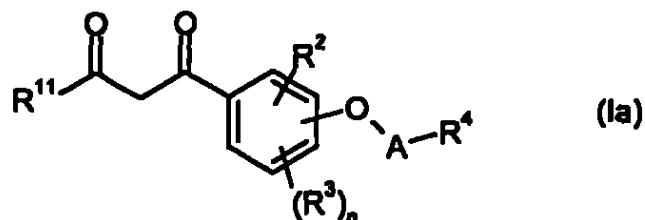
R¹ tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante, en caso dado en presencia de

uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o si .

(b) se hacen reaccionar benzoilcetonas substituidas de la fórmula general (Ia)



en la que

n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} tienen el significado anteriormente indicado,

con un éster del ácido ortofórmico o con un N,N -dimetil-formamida-acetal o con un éster del ácido cianofórmico o con disulfuro de carbono (carburo de azufre) y con un agente de alquilación, y a continuación con hidroxilamina o con un aducto con ácido de la misma,

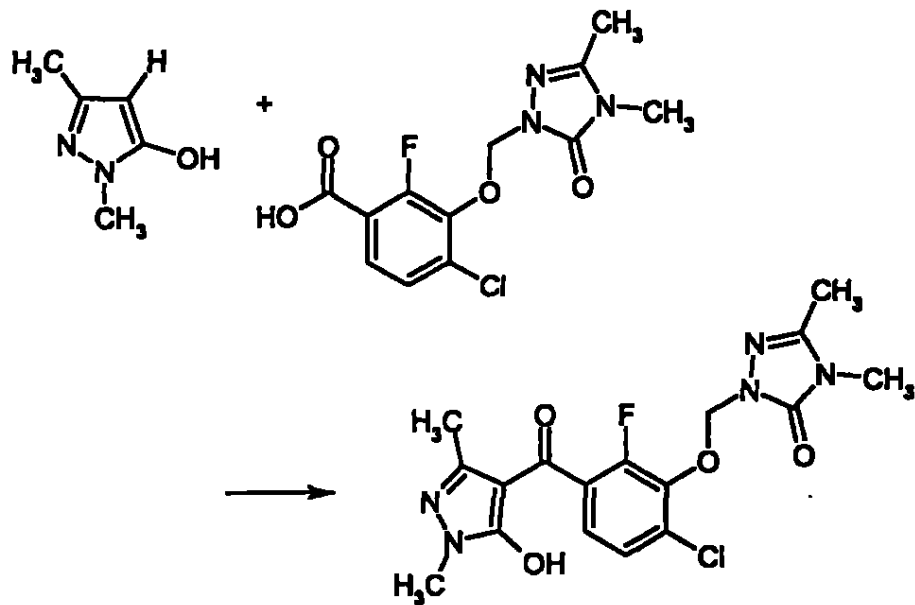
en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y en caso dado después de la realización de los procedimientos según la invención

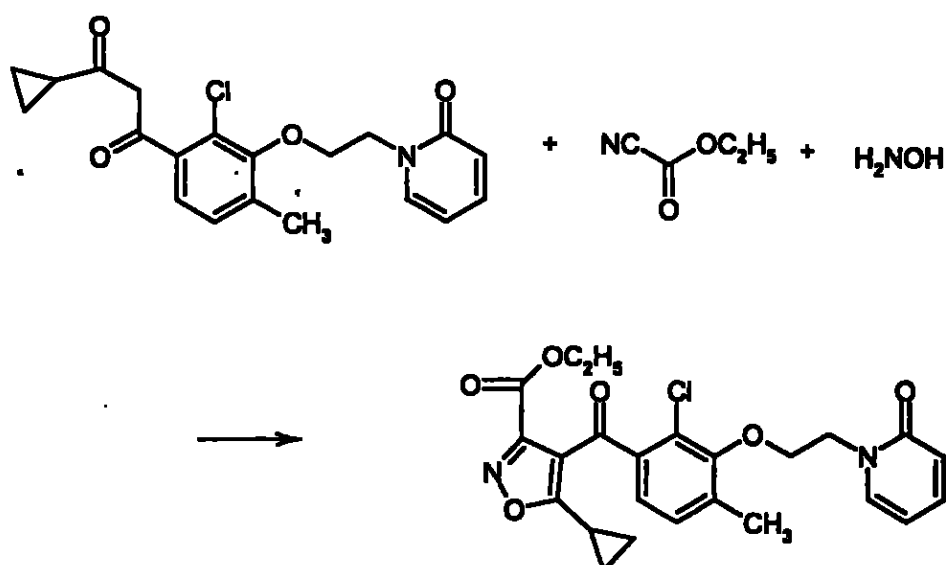
(a) o (b) se llevan a cabo en los compuestos, así obtenidos, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual, reacciones de substitución, de oxidación o de reducción y/o los compuestos de la fórmula general (I) se transforman de manera usual en los compuestos de tipo salino.

Si se emplean, por ejemplo, el ácido 4-cloro-3-[(3,4-dimetil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-metoxi]-2-flúor-benzoico y 1,3-dimetil-5-hidroxipirazol como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la

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



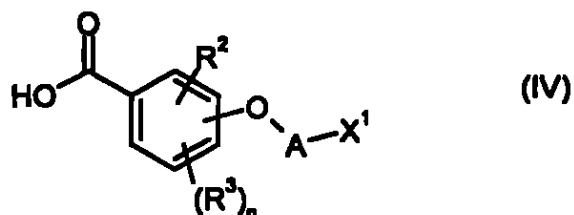
Si se emplean, por ejemplo, la 1-[2-cloro-4-metil-3-[2-(2-oxo-1(2H)-piridinil)-etoxi]-fenil]-3-ciclopropil-1,3-propanodiona, cianoformiato de etilo e hidroxilamina como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Los ácidos benzoicos substituidos a ser empleados como productos de partida en el procedimiento (a) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), n , A , R^2 , R^3 y R^4 tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para n , A , R^2 , R^3 y R^4 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

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 los nuevos ácidos benzoicos substituidos —o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo— si
(α) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (IV)



en la que

n , A , R^2 y R^3 tienen el significado anteriormente indicado y

X^1 significa halógeno (especialmente significa flúor, cloro o bromo) o significa alquilsulfoniloxi (especialmente metilsulfoniloxi o etilsulfoniloxi),

-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con compuestos heterocíclicos de la fórmula general (V)



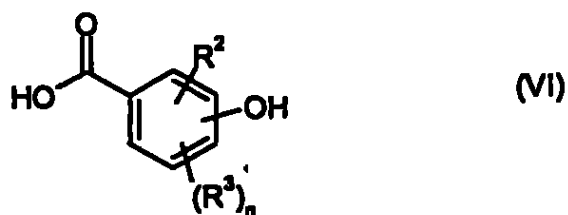
en la que

R^4 tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, tal como por ejemplo carbonato de potasio, y, en caso dado, en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo acetona, butanona, acetonitrilo, N,N-dimetil-formamida o dimetilsulfóxido, a temperaturas comprendidas entre 10°C y 150°C y, en caso dado, a continuación se llevan a cabo otras reacciones de transformación en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual (véanse los ejemplos de obtención),

o si

(β) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado anteriormente indicado,

o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con hidroxialquilheterociclos de la fórmula general (VII)



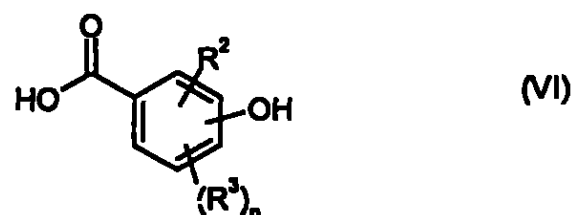
en la que

A y R^4 tienen el significado anteriormente indicado,

en presencia de agentes auxiliares de la condensación, tales como por ejemplo azodicarboxilato de dietilo y trifenilfosfina, en caso dado en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo tetrahidrofurano, a temperaturas comprendidas entre -20°C y $+50^\circ\text{C}$ y, en caso dado, a continuación se llevan a cabo, en el ámbito de la definición de los sustituyentes, de manera usual, otras reacciones de transformación (véanse los ejemplos de obtención),

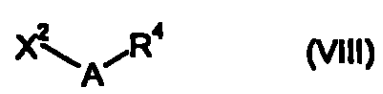
o si

(y) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado anteriormente indicado,
-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-
con halógenoalquilheterociclos de la fórmula general (VIII)



en la que

A y R^4 tienen el significado anteriormente indicado y
 X^2 significa halógeno (especialmente significa flúor, cloro o bromo), significa alquilsulfoniloxi (especialmente metilsulfoniloxi o etilsulfoniloxi), o significa arilsulfoniloxi (especialmente p-tolilsulfoniloxi),
en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, tal como por ejemplo carbonato de potasio o trietilamina y, en caso dado, en presencia de un diluyente tal como por ejemplo acetona, butanona, acetonitrilo, N,N-dimetil-formamida o dimetilsulfóxido, a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de transformación en el ámbito de la definición de los sustituyentes, de manera usual (véanse los ejemplos de obtención).

Los compuestos a ser empleados además como productos de partida en el

procedimiento (a) 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^1 tiene preferentemente aquel significado que ya ha sido citado anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para R^1 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula general (III) son compuestos orgánicos conocidos.

Las benzoilcetonas substituidas a ser empleadas como productos de partida en el procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por medio de la fórmula (Ia). En la fórmula general (Ia), n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula general (Ia) son compuestos nuevos, según la invención; éstos pueden prepararse según el procedimiento (a) de la invención.

El procedimiento (a) según la invención para la obtención de las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de un agente deshidratante. En este caso entran en consideración los productos químicos adecuados usuales para el enlazado del agua.

Como ejemplos a este respecto pueden citarse dicitohexilcarbodiimida y carbonil-bis-imidazol.

Se citará como agente deshidratante adecuado de forma especialmente buena la dicitclohexilcarbodiimida.

El procedimiento (a) según la invención para la obtención de las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de uno o varios agentes auxiliares de la reacción.

Como ejemplos a este respecto pueden citarse cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianhidrinacetona, 2-ciano-2-(trimetilsililoxi)-propano y cianuro de trimetilsililo.

Se citará como otro agente auxiliar de la reacción adecuado de una manera especialmente buena al cianuro de trimetilsililo.

El procedimiento (a) según la invención para la obtención de las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de otro agente auxiliar de la reacción. Como otro agente auxiliar de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración en general compuestos orgánicos nitrogenados básicos, tales como por ejemplo trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, 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-diazabicitclo[2,2,2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicitclo[4,3,0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabicitclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU).

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de ésteres del ácido ortofórmico o con N,N-dimetil-formamido-acetales. Estos compuestos

contienen preferentemente grupos alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, especialmente metilo o etilo. Como ejemplos se citarán ortoformiato de trimetilo, ortoformiato de trietilo, N,N-dimetil-formamido-dimetilacetal y N,N-dimetil-formamido-dietil-acetal.

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de ésteres del ácido cianofórmico. Estos compuestos contienen preferentemente grupos alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente metilo o etilo. Como ejemplos se citarán cianoformiato de metilo y cianoformiato de etilo.

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de (disulfuro de carbono) y (agentes de alquilación). Estos compuestos contienen preferentemente grupos alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono, especialmente metilo o etilo. Como ejemplos se citarán cloruro de metilo, bromuro de metilo, yoduro de metilo, sulfato de dimetilo, cloruro de etilo, bromuro de etilo, yoduro de etilo y sulfato de dietilo.

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo con empleo de hidroxilamina o de un aducto con ácido de la misma. Como aducto con ácido preferente se citará el hidrocloreto de la hidroxilamina.

Los procedimientos según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se llevan a cabo preferentemente con empleo de diluyentes. Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (b) según la invención entran en consideración 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; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido, alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter.

Las temperaturas de la reacción en las realización de los procedimientos (a) y (b) 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.

Los procedimientos (a) y (b) según la invención se llevan a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo los procedimientos 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 de los procedimientos (a) y (b) 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 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 compuestos de las fórmulas (IV), (V), (VI), (VII) y (VIII) a ser empleados como productos de partida en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II), son compuestos orgánicos conocidos.

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 sustancias, 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-anales.

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 mo-

nocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos según la invención pueden emplearse también en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación para la lucha contra las plagas animales y contra las enfermedades fúngicas o bacterianas de las plantas. Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el

caso de las semillas, además por recubrimientos con una o varias capas.

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 clorobenzenos, 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 polioxietilenados 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 arábica, 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 ferrocianico 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 y/o con productos que

mejoren la compatibilidad para con las plantas de cultivo ("protectores") conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque. También son posibles con agentes para combatir las malas hierbas, que contengan uno o varios herbicidas conocidos y un protector.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid(-sodio), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, BAS-622H, Bflubutamid, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil(alilo), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinnemethylin, 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, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclorprop(-P), 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, -metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone (-sodio), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn,

Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam,
 Flupropacil, Flupyrasulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone,
 Fluroxypyr(-butoxipropilo, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo),
 Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate(-amonio), Glyphosate
 (-isopropilamonio), Halosafen, Haloxypop(-etoxietilo, -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, Mecoprop., Mefenacet,
 Mesosulfuron, 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, Picolinafen,
 Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Profluazol, Prometryn, Propachlor,
 Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Procarbazon(-sodio), Propyzamide,
 Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-etilo), Pyrazogyl, Pyrazolate,
 Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol,
 Pyriftalid, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac,
 Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo, -P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine,
 Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate,
 Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn,
 Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-metilo),
 Thiobencarb, Tiocarbamil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo),

Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin , Trifloxysulfuron, Triflusulfuron(-metilo), Tritosulfuron.

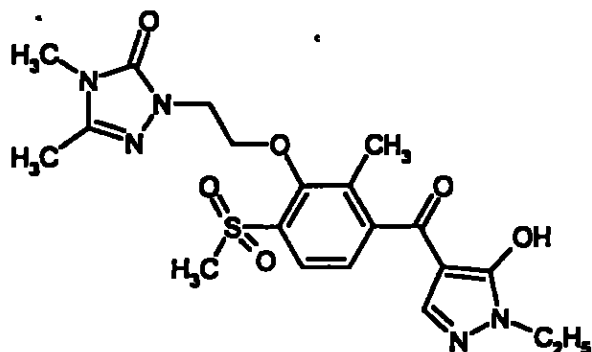
También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

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. Fundamentalmente dependen 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 sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

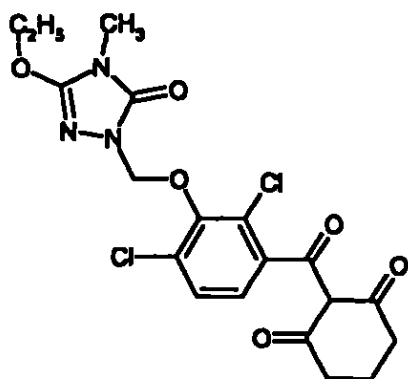
Ejemplos de obtención:**Ejemplo 1.****(Procedimiento (a)).**

Se añaden a una solución de 1,1 g (2,7 mmoles) de cloruro de 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoilo en 20 ml de diclorometano, sucesivamente, 0,30 g (2,7 mmoles) de 1-etil-5-hidroxipirazol, 0,8 g (8,0 mmoles) de trietilamina y una gota de N,N-dimetil-formamida. Se agita la mezcla aproximadamente durante 24 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C), la solución de la reacción se lava sucesivamente con ácido clorhídrico 1N y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 30 ml de acetonitrilo y se combina, sucesivamente, bajo ligera refrigeración, con 0,28 g (3,3 mmoles) de 2-hidroxi-2-metil-propionitrilo y 1,4 g (14 mmoles) de trietilamina. Se agita durante otras 24 horas a temperatura ambiente, se elimina la parte principal del disolvente al vacío de la trompa de agua y el residuo se disuelve en diclorometano y ácido clorhídrico 1N. La fase orgánica se separa, se lava con agua y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 1,1 g (88 % de la teoría) del 4-{3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etiloxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoil}-1-etil-5-hidroxi-1H-pirazol en forma de residuo oleaginoso.

Log P: 1,23.

Ejemplo 2.



(Procedimiento (a)).

Se disuelven 1,95 g (5,4 mmoles) del ácido 3-(3'-etoxy-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoico en 75 ml de acetonitrilo y se combinan con 0,61 g de 1,3-ciclohexanodiona (5,4 mmoles) así como con 1,33 g de diciclohexilcarbodiimida (DCC, 1,2 equivalentes). Al cabo de 15 minutos de agitación a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) se añaden 1,5 ml de trietilamina (2 equivalentes) y 0,29 ml de cianuro de trimetilsililo (0,4 equivalentes). Al cabo de 2 horas a temperatura ambiente se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua, el residuo se agita con solución acuosa al 10 % de carbonato de sodio y se separa por filtración. El filtrado se sacude con dietiléter y la fase acuosa se acidifica con ácido clorhídrico 2N. El producto precipitado se extrae varias veces con diclorometano, las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y se concentran por evaporación.

Se obtienen 1,3 g (53 % de la teoría) de la 2-[3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona en forma de resina viscosa.

Log P = 2.52.

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2 así como de acuerdo con la descripción general de los procedimientos de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

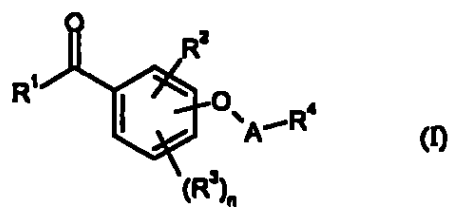
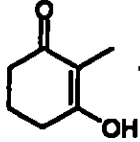
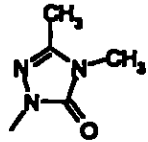
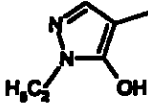
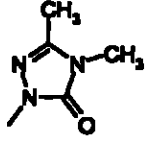
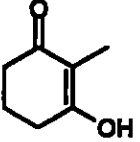
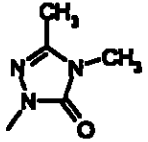
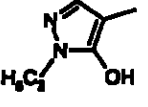
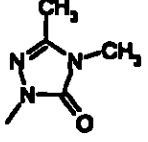
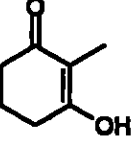
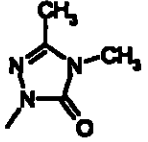
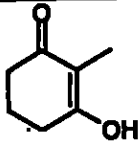
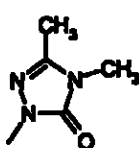
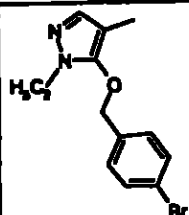
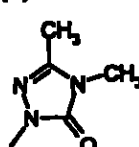
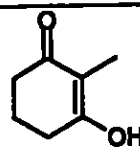
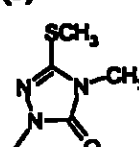
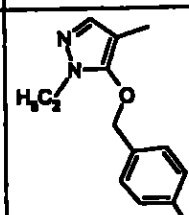
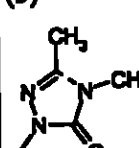
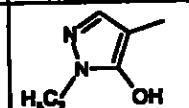
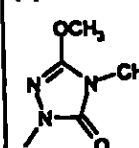
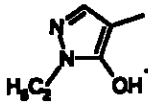
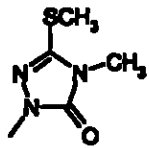
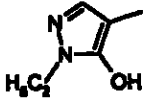
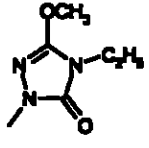
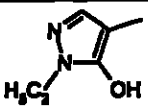
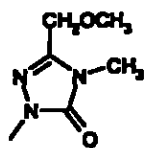
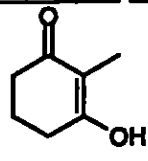
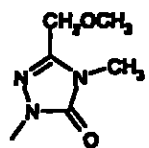
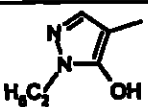
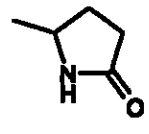
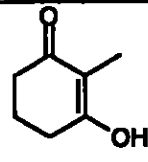
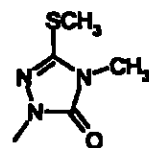


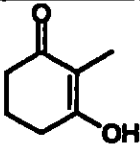
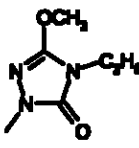
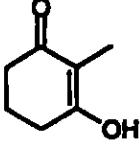
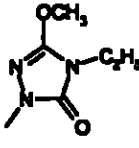
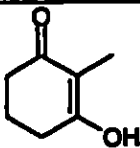
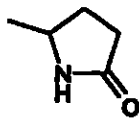
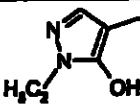
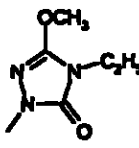
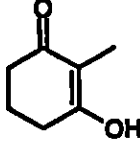
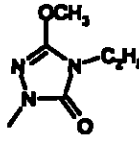
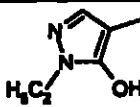
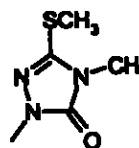
Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I)

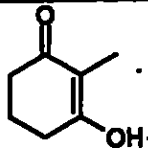
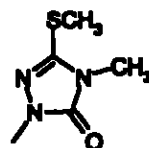
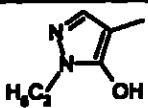
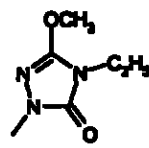
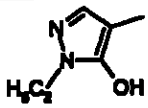
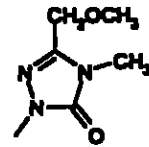
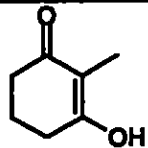
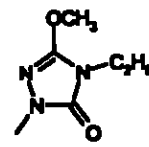
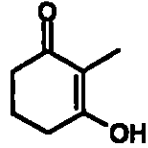
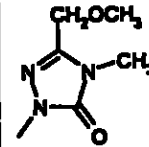
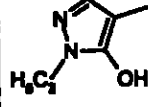
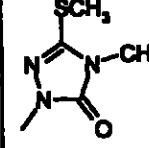
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
3	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
4	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
5	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,52 ^{a)}

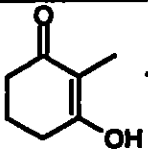
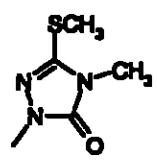
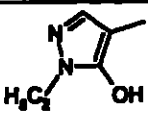
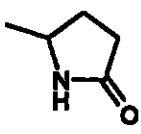
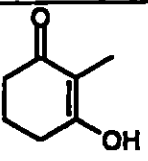
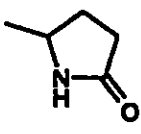
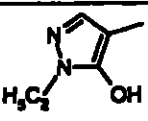
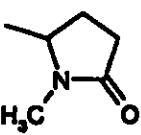
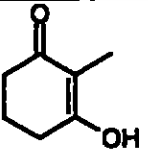
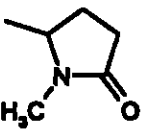
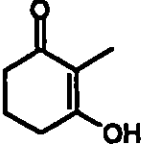
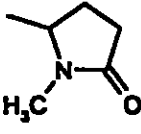
Ej. nº	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
6	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
7	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,68 ^{a)}
8	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,94 ^{a)}
9	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,58 ^{a)}
10	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,91 ^{a)}

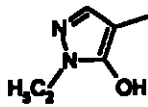
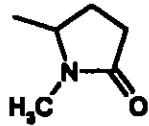
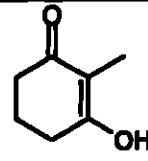
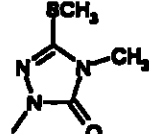
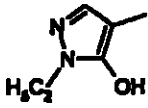
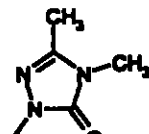
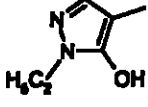
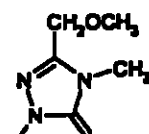
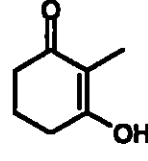
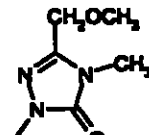
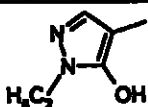
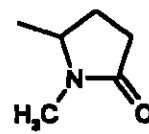
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
11	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	logP = 1,65 ^{a)}
12	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,07 ^{a)}
13	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,44 ^{a)}
14	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}
15	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,69 ^{a)}

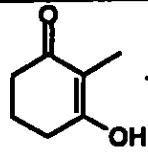
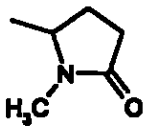
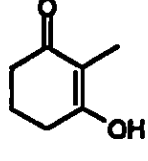
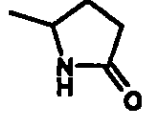
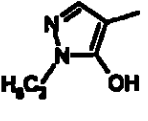
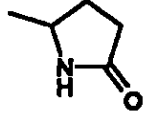
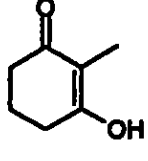
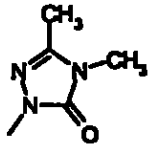
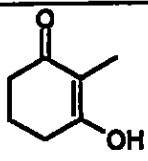
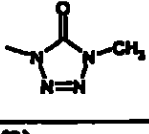
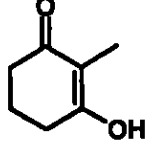
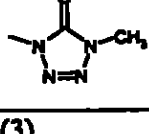
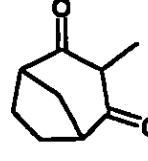
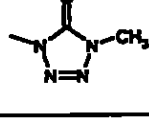
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
16	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
17	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
18	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,62 ^{a)}
19	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,06 ^{a)}
20	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,60 ^{a)}
21	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,39 ^{a)}

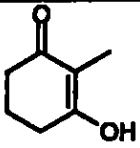
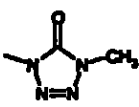
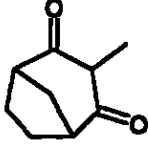
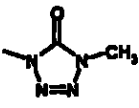
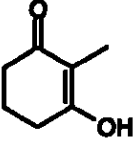
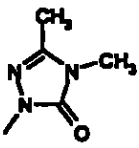
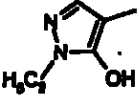
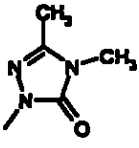
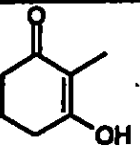
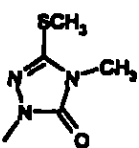
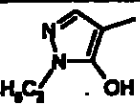
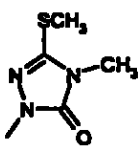
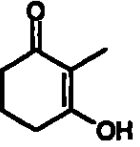
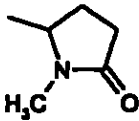
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
22	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,16 ^{a)}
23	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,40 ^{a)}
24	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,98 ^{a)}
25	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,88 ^{a)}
26	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,15 ^{a)}
27	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,11 ^{a)}

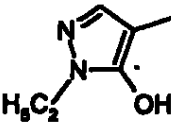
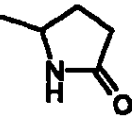
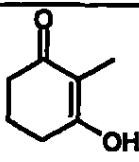
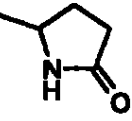
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
28	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}
29	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,12 ^{a)}
30	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,78 ^{a)}
31	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}
32	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
33	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,97 ^{a)}

Ej. nº	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
34	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,36 ^{a)}
35	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) [α] _D ²⁰ = +2,3 logP = 1,67 ^{a)}
36	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,94 ^{a)}
37	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,85 ^{a)}
38	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,10 ^{a)}
39	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,12 ^{a)}

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
40	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,67 ^{a)}
41	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 2,42 ^{a)}
42	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1,65 ^{a)}
43	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	
44	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}
45	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,68 ^{a)}

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
46	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,13 ^{u)}
47	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,95 ^{u)}
48	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,51 ^{u)}
49	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1,92 ^{u)}
50	CH ₂ CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	²⁰ n _D = 1,5970
51	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	²⁰ n _D = 1,5825
52	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	²⁰ n _D = 1,5790

Ej. nº	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
53	CH ₂ CH ₃		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	Fp.: 69°C
54	CH ₂ CH ₃		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	Fp.: 62°C
55	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
56	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
57	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
58	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
59	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(Enantióme- ro S)

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³)n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
60	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,56 ^{a)}
61	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,02 ^{a)}

La determinación de los valores logP indicados en la tabla 1 se lleva 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 valores de medición correspondientes se han marcado en la tabla 1 con ^{a)}.
- (b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución acuosa 0,01 molar de tampón de fosfato, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo –los valores de medición correspondientes se han marcado en la tabla 1 con ^{b)}.

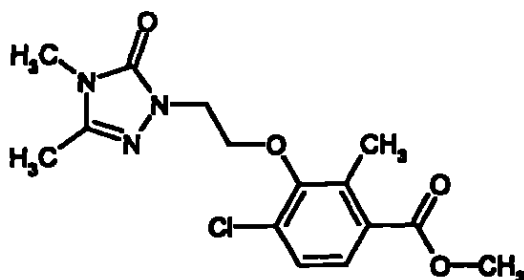
El calibrado se llevó a cabo con alcano-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores log P por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre

dos alcanonas sucesivas).

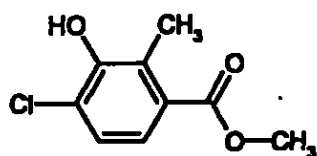
Los valores λ máximos se determinaron por medio de los espectros UV desde 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

Productos de partida de la fórmula (II):

Ejemplo (II-1).



Primera etapa.



Se hace pasar a través de una solución a ebullición de 100 g (0,6 moles) de 3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo y 0,4 ml de diisopropilamina, en 800 ml de 1,2-dicloro-etano, en el transcurso de 4 hasta 6 horas, 43 g (0,606 moles) de cloro gaseoso. Tras la refrigeración se lava la solución sucesivamente con, respectivamente, 200 ml de solución al 5 % de bisulfito de sodio y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca la fase orgánica sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente al vacío de la trompa de agua. El aceite de color pardo obscuro, obtenido como residuo, se combina con 30 ml de dietiléter y se refrigera a 0° hasta 4°C para la cristalización. Los cristales precipitados se aíslan mediante filtración por succión, se lavan con un poco de dietiléter frío y se secan en vacío a

30°C.

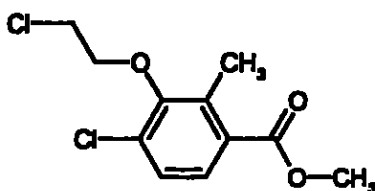
Se obtienen 46,6 g (39 % de la teoría) del 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo.

Log P: 2,14.

Si en lugar del 3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo se emplea el correspondiente éster de etilo, se obtendrá, según el mismo procedimiento, el 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de etilo.

Punto de fusión: 51°C.

Segunda etapa.

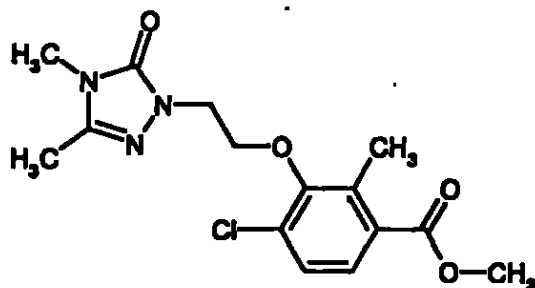


Se añaden a una solución de 25 g (0,125 moles) de 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo, en 400 ml de acetonitrilo, sucesivamente, 34,2 g (0,248 moles) de carbonato de potasio anhidro en forma de polvo y 29,3 g (0,125 moles) de p-toluenosulfonato de 2-cloro-etanol. Se calienta aproximadamente durante 7 horas a 70°C, se deja refrigerar la mezcla de la reacción y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 200 ml de diclorometano y 300 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 32,5 g (99 % de la teoría) del 4-cloro-3-(2-cloro-etoxi)-2-metil-benzoato de metilo en forma de aceite oscuro.

Log P = 3,52.

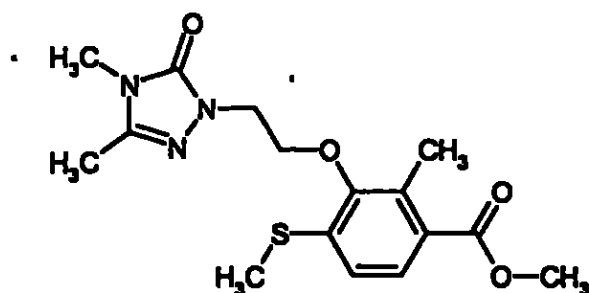
Tercera etapa.



Se añaden a una solución de 16,0 g (60,8 mmoles) de 4-cloro-3-(2-cloro-etoxi)-2-metil-benzoato de metilo en 70 ml de dimetilsulfóxido, sucesivamente, 18,4 g (0,133 moles) de carbonato de potasio anhidro en forma de polvo y 6,9 g (60,8 mmoles) de 3,4-dimetil-1,2,4-triazolin-5-ona. Se calienta aproximadamente durante 6 horas a 90°C, se deja refrigerar la mezcla de la reacción y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 140 ml de diclorometano y 60 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua. El residuo oleaginoso se agita con 25 ml de éter de petróleo. El producto cristalino precipitado en este caso se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 18,5 g (80 % de la teoría) del 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo.

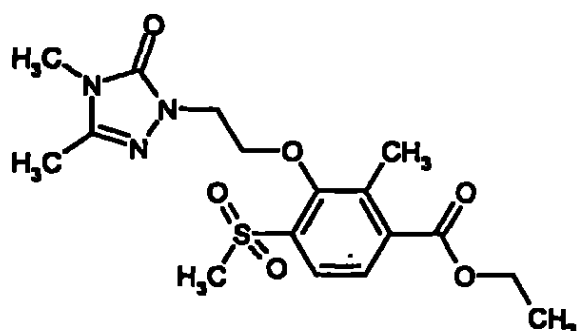
Log P: 1,94.

Ejemplo (II-2).

Se añaden a una solución de 12,4 g (36,5 mmoles) de 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo, en 100 ml de N,N-dimetil-formamida, bajo refrigeración con hielo, 3,3 g (44,5 mmoles) de metilmercáptido de sodio. Se agita durante aproximadamente 6 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 300 ml de acetato de etilo y 200 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 5,4 g (42 % de la teoría) del 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metiltio-benzoato de metilo.

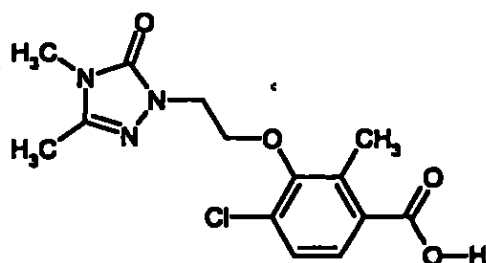
Log P = 1,89.

Ejemplo (II-3).

Se añaden a una solución de 12,3 g (33,7 mmoles) de 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metiltio-benzoato de etilo en 40 ml de ácido acético, 10 mg de tetrahidrato de molibdato de amonio y 17,3 g (178 mmoles) de solución acuosa al 35 % de peróxido de hidrógeno. La mezcla de la reacción se calienta durante aproximadamente 6 horas a 50°C hasta 60°C, se diluye con agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa, se lava sucesivamente con agua, con solución de bicarbonato de sodio, con solución de tiosulfato de sodio y nuevamente con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 12,3 g (92 % de la teoría) del 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoato de etilo.

Log P = 1,76.

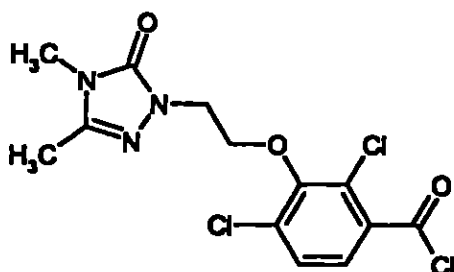
Ejemplo (II-4).

Se añaden a una solución de 6,5 g (19,0 mmoles) de 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazol-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo en 40 ml de etanol, 1,2 g (30 mmoles) de una solución de hidróxido de sodio en 20 ml de agua. La solución se agita durante aproximadamente 24 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C), y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en agua y se acidifica con ácido clorhídrico. La suspensión formada se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se separa, se lava con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra.

El disolvente se elimina cuidadosamente el filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 5,9 g (95 % de la teoría) del ácido 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoico.

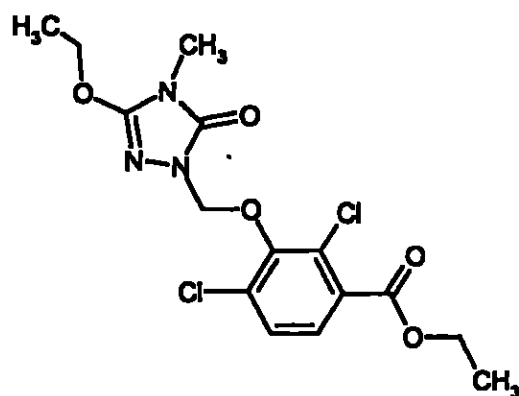
Log P = 1,37.

Ejemplo (II-5).

Se calientan 2,3 g (6,65 mmoles) del ácido 2,4-dicloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-benzoico, en 10 ml de cloruro de tionilo aproximadamente durante 1,5 horas a 70°C. Se deja refrigerar la solución de la reacción y se elimina el cloruro de tionilo en exceso bajo presión reducida.

Se obtienen 2,4 g (100 % de la teoría) del cloruro de 2,4-dicloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-benzoilo.

Log P = 1,24.

Ejemplo (II-6).

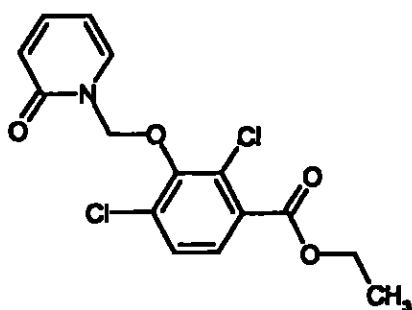
Se disuelven 5 g (21,3 mmoles) del 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo en 200 ml de tetrahidrofurano y se combinan con 3,68 g (21,3 mmoles) de 1-hidroximetil-3-etoxi-4-metil-1,2,4-triazolin-5-ona. Tras adición de 5,58 g (21,3

mmoles) de trifenilfosfina se añaden, gota a gota, a 0°C, 4,4 g de diazodicarboxilato de dietilo al 85 %. La solución resultante se agita durante la noche, se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y se filtra a través de gel de sílice (acetato de etilo/hexano). El filtrado se concentra por evaporación y se combina con dietiléter. El producto sólido que se separa se recoge por filtración y el disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 6,8 g (82 % de la teoría) del 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoato de etilo en forma de aceite viscoso.

Log P = 2.77.

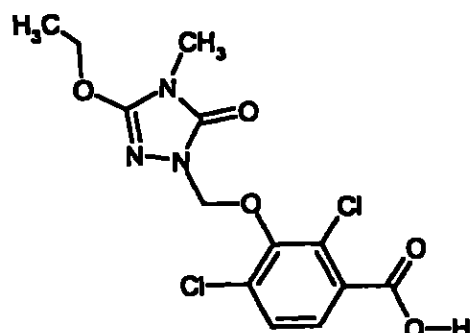
Ejemplo (II-7).



Se disuelven 2 g (8,5 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo en 30 ml de acetonitrilo y se combinan sucesivamente con 0,86 g (8,5 mmoles) de trietilamina y 1,2 g (8,5 mmoles) de N-clorometil-2-piridona. La mezcla resultante se agita durante 7 horas a 60°C, se combina con agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa, se lava con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina por destilación cuidadosamente bajo presión reducida.

Se obtienen 2,4 g (82 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-(1H-pirid-2-on-1-il)-metoxi-benzoato de etilo.

Ejemplo (II-8).

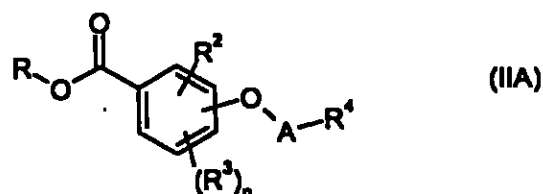


Se agitan 6,4 g (16,3 mmoles) del 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoato de etilo en una mezcla constituida por 250 ml de ciclohexano y 25 ml de etilenglicol-monometiléter en presencia de 0,91 g de hidróxido de potasio en polvo durante 15 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C). Se diluye con agua y se acidifica con ácido clorhídrico 2N. El producto sólido precipitado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 4,05 g (69 % de la teoría) del ácido 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoico.

log P: 1,74.

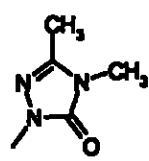
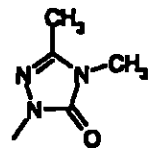
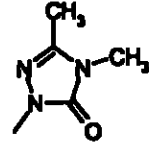
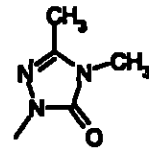
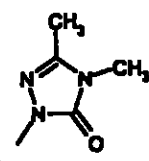
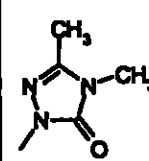
De manera análoga a la de los ejemplos (II-1) hasta (II-8) pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (II) o los derivados reactivos de los mismos —véase la fórmula (IIa)—, indicados en la tabla 2 siguiente,

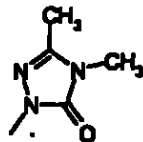
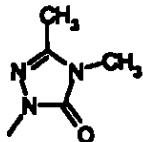
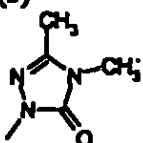
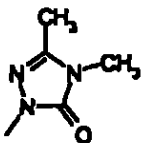
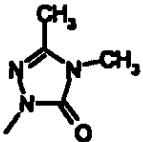
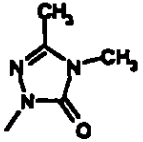


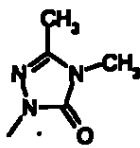
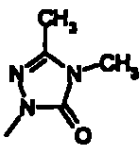
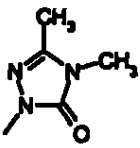
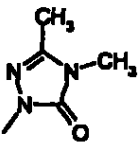
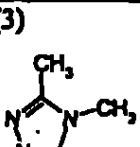
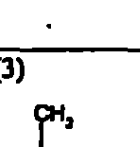
en la que

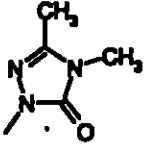
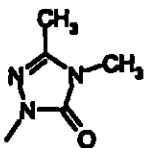
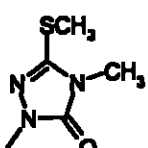
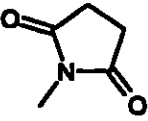
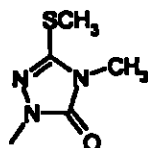
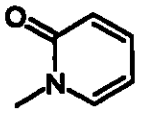
R tiene el significado indicado en la tabla siguiente.

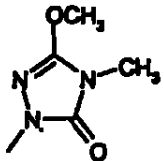
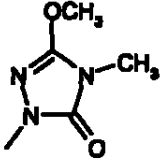
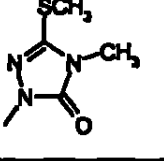
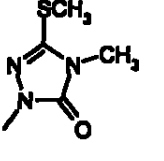
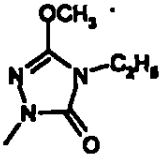
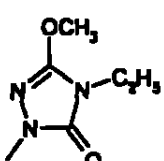
Tabla 2: Ejemplos de compuestos de la fórmula (II) o bien (IIA).

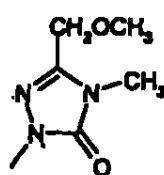
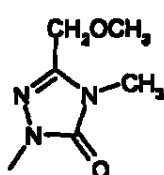
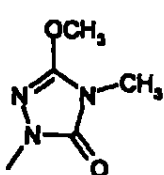
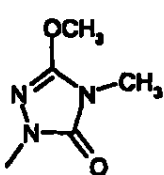
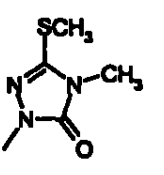
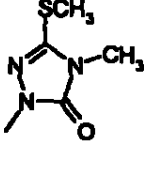
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-9	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,25 ^{a)}
II-10	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,16 ^{a)}
II-11	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	CH ₃	logP = 1,48 ^{a)}
II-12	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,33 ^{a)}
II-13	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,92 ^{a)}
II-14	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,08 ^{a)}

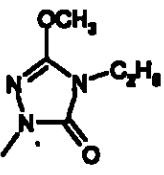
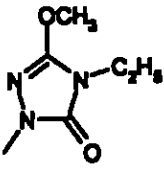
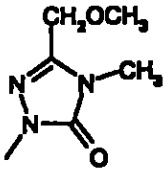
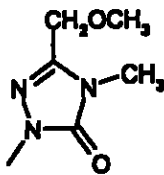
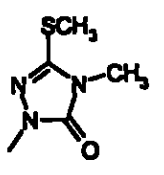
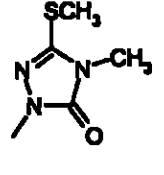
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-15	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,23 ^{a)}
II-16	CH ₂ CH ₂	(2) SCH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,13 ^{a)}
II-17	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,09 ^{a)}
II-18	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,27 ^{a)}
II-19	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	H	logP = 0,59 ^{a)}
II-20	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,72 ^{a)}

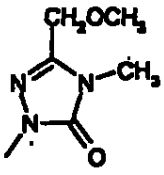
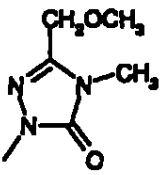
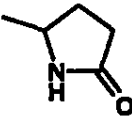
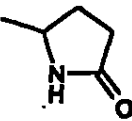
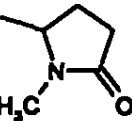
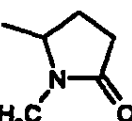
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-21	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,77 ^{a)}
II-22	CH ₂ CH ₂	(2) SO ₂ CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,46 ^{a)}
II-23	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,49 ^{a)}
II-24	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,95 ^{a)}
II-25	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,83 ^{a)}
II-26	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,34 ^{a)}

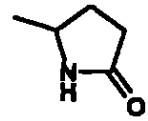
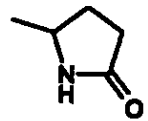
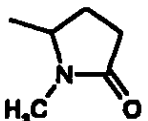
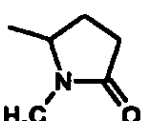
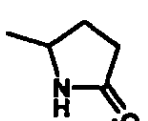
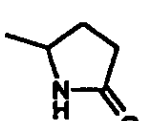
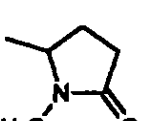
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ²) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-27	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,27 ^{a)}
II-28	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,37 ^{a)}
II-29	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,69 ^{a)}
II-30	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,13 ^{a)}
II-31	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,68 ^{a)}
II-32	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆), δ: 5,89 ppm (s, CH ₂)

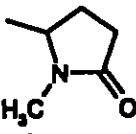
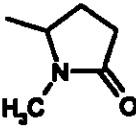
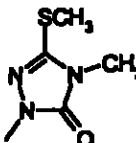
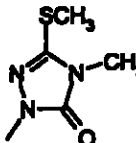
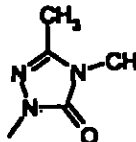
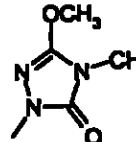
Ej. - nº	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-33	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,40 ^{a)}
II-34	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,52 ^{a)}
II-35	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,66 ^{a)}
II-36	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,72 ^{a)}
II-37	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,68 ^{a)}
II-38	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,73 ^{a)}

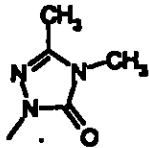
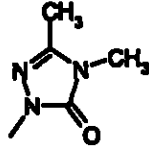
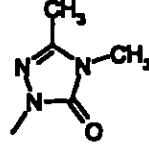
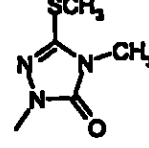
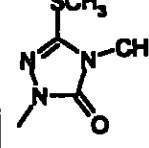
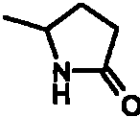
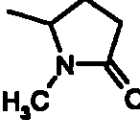
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ³) R ⁴	R	Datos físicos
II-39	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,28 ^{a)}
II-40	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,45 ^{a)}
II-41	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,17 ^{a)}
II-42	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,78 ^{a)}
II-43	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,44 ^{a)}
II-44	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,75 ^{a)}

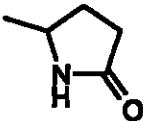
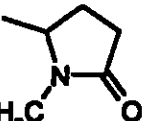
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-45	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,46 ^{a)}
II-46	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,79 ^{a)}
II-47	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,06 ^{a)}
II-48	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,49 ^{a)}
II-49	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,59 ^{a)}
II-50	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,64 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-51	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,22 ^{a)}
II-52	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,37 ^{a)}
II-53	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,17 ^{a)}
II-54	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,31 ^{a)}
II-55	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,35 ^{a)}
II-56	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,44 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-57	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 1,95 ^{a)}
II-58	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3). 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,39 ^{a)}
II-59	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,18 ^{a)}
II-60	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,55 ^{a)}
II-61	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,15 ^{a)}
II-62	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,28 ^{a)}
II-63	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S)

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-64	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	CH ₃	(Enantióme- ro S) $n_D^{20} = -20,4$ $\log P = 2,01$ ^{a)}
II-65	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) $\log P = 1,42$ ^{a)}
II-66	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	$\log P = 2,33$ ^{a)}
II-67	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	$\log P = 1,81$ ^{a)}
II-68	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	$\log P = 2,23$ ^{a)}
II-69	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	$\log P = 2,07$ ^{a)}

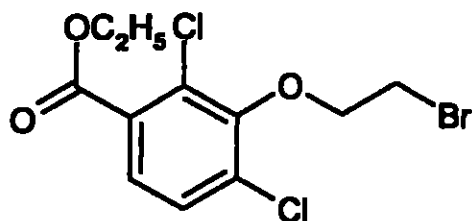
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ¹) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-70	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	logP = 1,36 ^{a)}
II-71	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-72	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	
II-73	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-74	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	
II-75	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,20 ^{a)}
II-76	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,46 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR*) R ⁴	R	Datos físicos
II-77	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,34 ^{a)}
II-78	CH ₂	(2) Br	(4) Br	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,49 ^{a)}

El compuesto indicado en la tabla 2 como ejemplo (II-35) puede prepararse, por ejemplo, de manera siguiente:

Ejemplo (II-35).

Primera etapa.

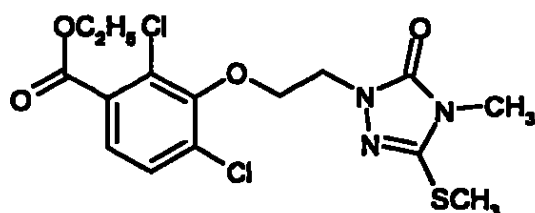


Se añaden a una solución de 15 g (68 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxibenzoato de etilo en 80 ml de N,N-dimetil-formamida, sucesivamente, 19 g (137 mmoles) de carbonato de potasio (polvo), 38,6 g (205 mmoles) de 1,2-dibromoetano y 0,4 g de yoduro de sodio. Se calienta la mezcla durante 2 horas a 80°C, a continuación se deja refrigerar hasta la temperatura ambiente y se sacude seguidamente con 350 ml de dietiléter. La fase orgánica se lava con agua, con lejía de hidróxido sódico al 10 % y finalmente con ácido clorhídrico al 10 %, a

continuación se seca con sulfato de sodio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 22,2 g (95 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-(2-bromo-etoxi)-benzoato de etilo en forma de residuo oleaginoso ($\log P = 3,98^a$).

Segunda etapa.

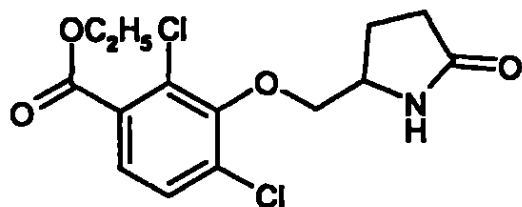


Se añaden a una solución de 18 g (93 mmoles) del 2,4-dicloro-3-(2-bromo-etoxi)-benzoato de etilo, en 100 ml de N,N-dimetil-formamida, sucesivamente 14,6 g (106 mmoles) de carbonato de potasio (polvo), 19,3 g (133 mmoles) de 3-metiltio-4-metil-1,2,4-triazolin-5-ona y 0,5 g de yoduro de sodio. Se calienta la mezcla durante 4 horas a 80°C, y a continuación se refrigera hasta la temperatura ambiente, se sacude con 400 ml de diclorometano, la fase orgánica se lava con agua, a continuación con lejía de hidróxido sódico al 10 % y finalmente con ácido clorhídrico al 10 %, se seca a continuación con sulfato de sodio y se filtra.

El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida .

Se obtienen 17,7 g (82 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-[2-(3-metiltio-4-metil-5-oxo-1,2,4-triazolin-1-il)-etoxi]-benzoato de etilo en forma de residuo oleaginoso ($\log P = 2,66^a$).

El compuesto indicado en la tabla 2 como ejemplo (II-61) puede prepararse, por ejemplo, de la manera siguiente:

Ejemplo (II-61).

Se agita durante 13 horas a 76°C, una mezcla constituida por 2,0 g (8,5 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo, 3,6 g (12,75 mmoles) de (S)-(+)-5-(p-toluenosulfoniloximetil)-pirrolidin-2-ona, 2,3 g (17 mmoles) de carbonato de potasio y 30 ml de acetonitrilo, tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se diluye con agua hasta un volumen aproximadamente dos veces mayor y se sacude con cloruro de metileno. La fase orgánica se lava con solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se seca con sulfato de sodio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 2,6 g (92 % de las teoría) del (S)-2,4-dicloro-3-[(2-oxo-pirrolidin-5-il)-metoxi]-benzoato de etilo (log P = 2,14 ^{ab}).

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 semillas de las plantas de ensayo en terreno normal. 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 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 y 11 con una compatibilidad ampliamente buena frente a 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.

Se pulverizan plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm 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:

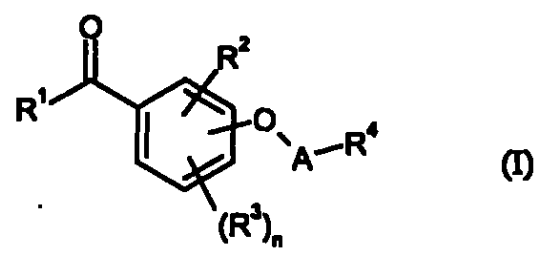
0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 y 13, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

REIVINDICACIONES

1.- Arilcetonas substituidas de la fórmula general (I)

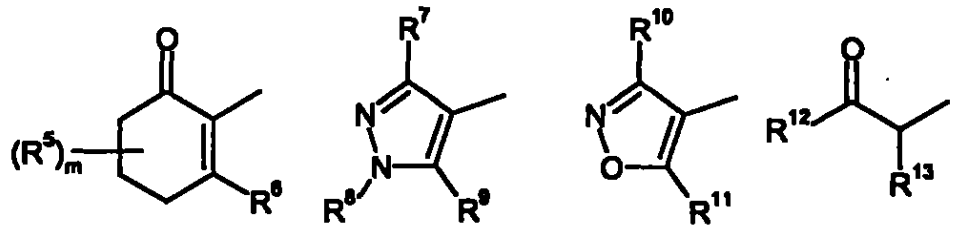


en la que

n` significa los números 0, 1 o 2,

A` significa alcanodiilo (alquileno),

R¹` significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m` significa los números 0 hasta 6,

R⁵` significa halógeno o significa alquilo, alquiltio o arilo substituidos respectivamente en caso dado, o -en el caso en que m signifique 2- significa en caso dado también junto con un segundo resto R⁵` alcanodiilo (alquileno),

R⁶` significa hidroxí, formiloxi, halógeno, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi,

alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxicarbonilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁸ significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R¹¹ significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R¹² significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo,

halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R⁴ significa un agrupamiento heterocíclico, monocíclico o bicíclico, saturado o insaturado, con 4 a 12 miembros, en caso dado substituido, que contiene de 1 a 4 heteroátomos (hasta 4 átomos de nitrógeno y en caso dado -alternativa o adicionalmente- 1 o 2 átomos de oxígeno y 1 o 2 átomos de azufre, o uno o dos agrupamientos SO- o uno o dos agrupamientos SO₂-), y que contiene además de uno hasta tres grupos oxo (C=O) y/o grupos tioxo (C=S) como componentes del heterociclo,

-con inclusión de todas las formas tautómeras posibles de los compuestos de la fórmula general (I) y de las sales o bien aductos con ácido o con bases posibles de los compuestos de la fórmula general (I)-.

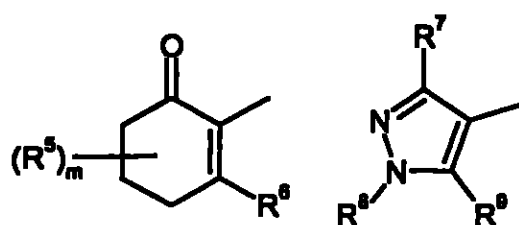
(2). Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0 o 1,

m significa los números 0, 1, 2, 3 o 4,

A significa alcanodiilo (alquilenos) con 1 a 6 átomos de carbono,

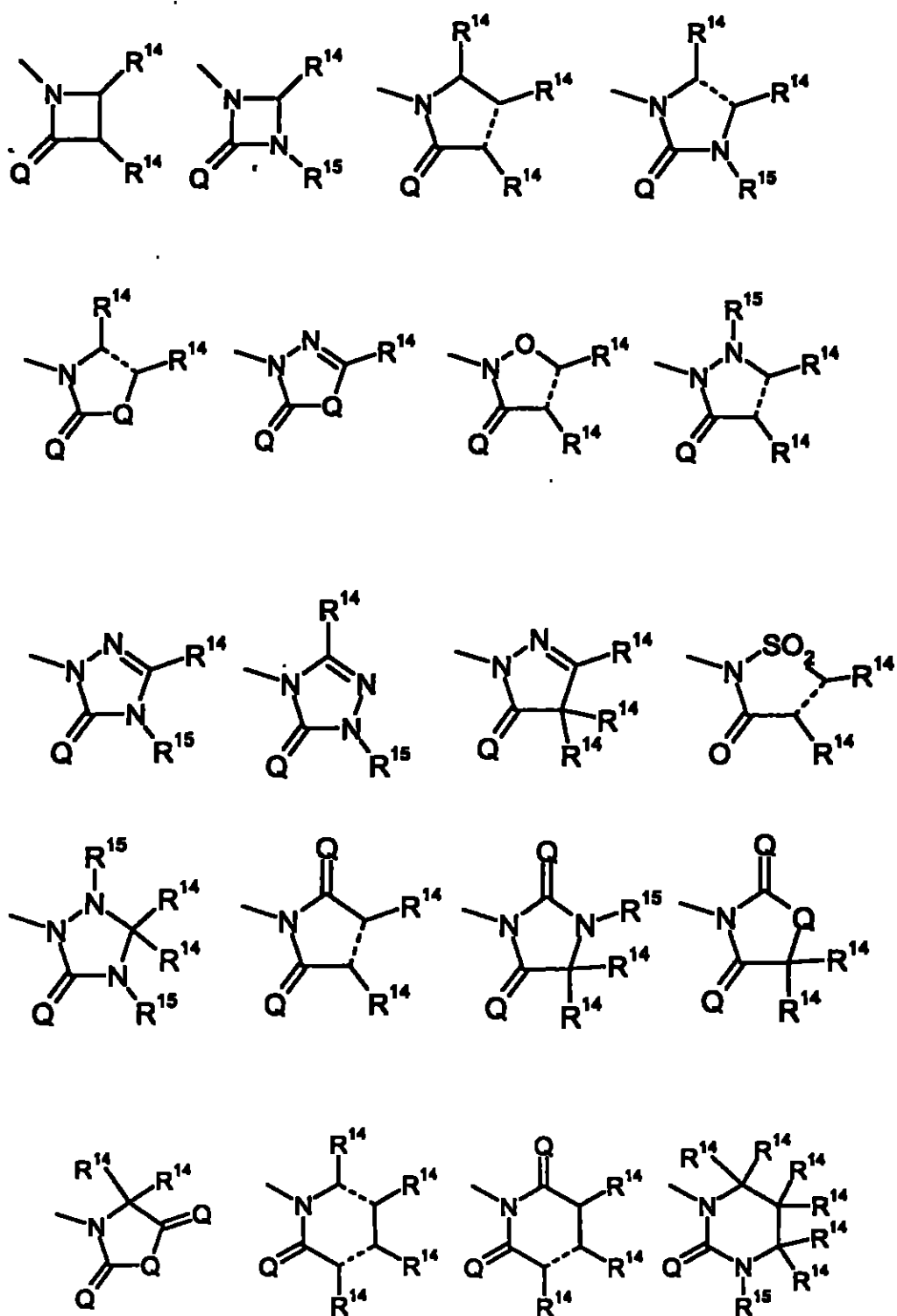
R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes

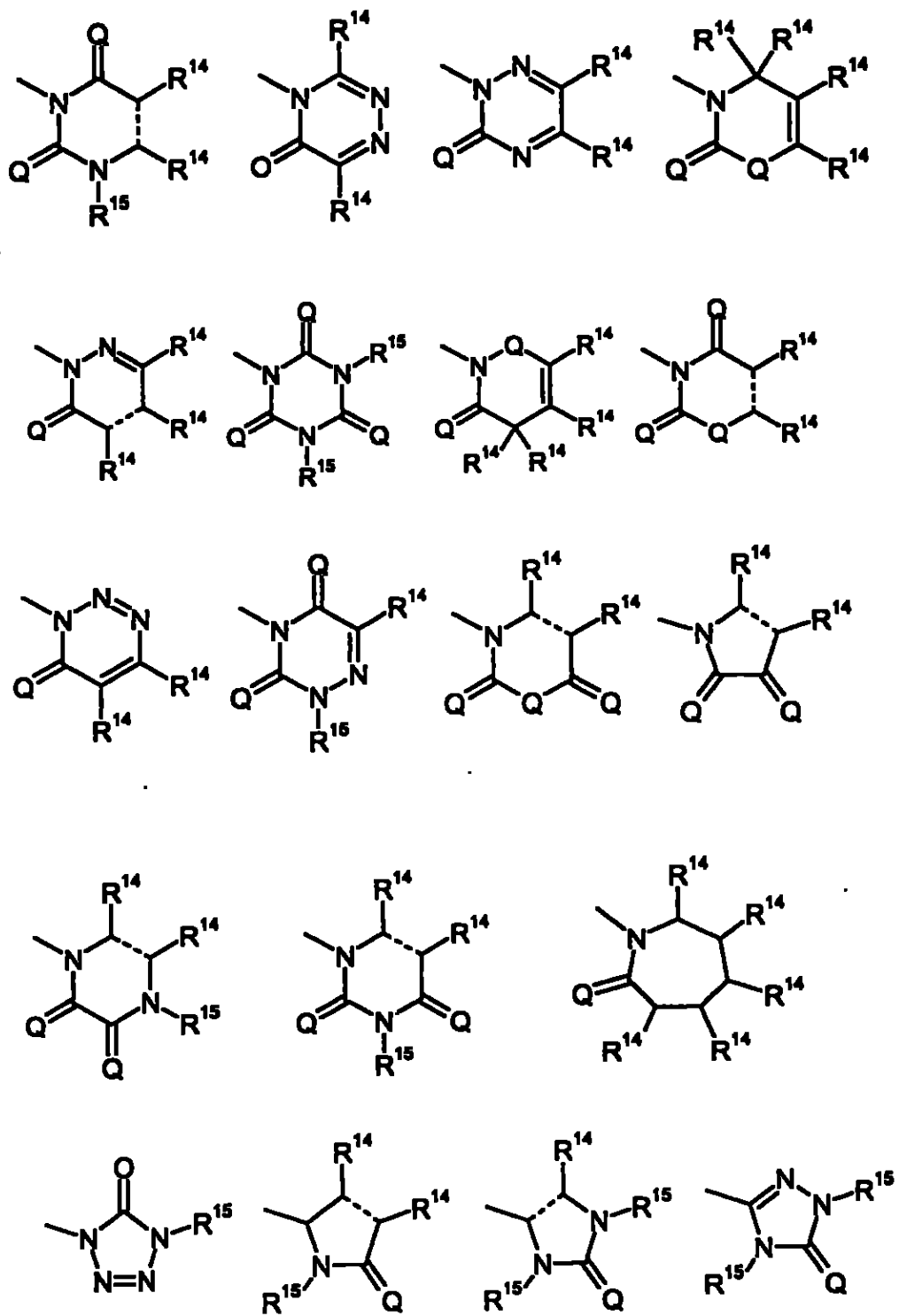


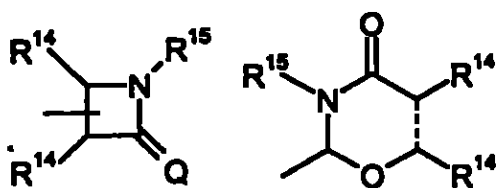
R^1 significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^3 significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^4 significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes







siendo el enlace dibujado con trazos discontinuos respectivamente un enlace sencillo o un enlace doble,



R¹⁴

significa oxígeno o azufre,

significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilamino o dialquilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino

substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa también junto con el resto R^{14} contiguo un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxí, amino, alquilidenamino con hasta 4 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino o alcanoilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alquinilo o alqueniloxi respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa alcanodiilo con 3 hasta 5 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior,

R^3 significa halógeno, significa alquilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta

6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R⁵ significa alcanodiilo (alquilen) con 2 hasta 6 átomos de carbono,

R⁶ significa hidroxi, formiloxi, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcoxicarbonilo respectivamente con 1 hasta 6 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 significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono,

R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁹ significa hidroxi, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi,

arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, o po alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹¹ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹² significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 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.

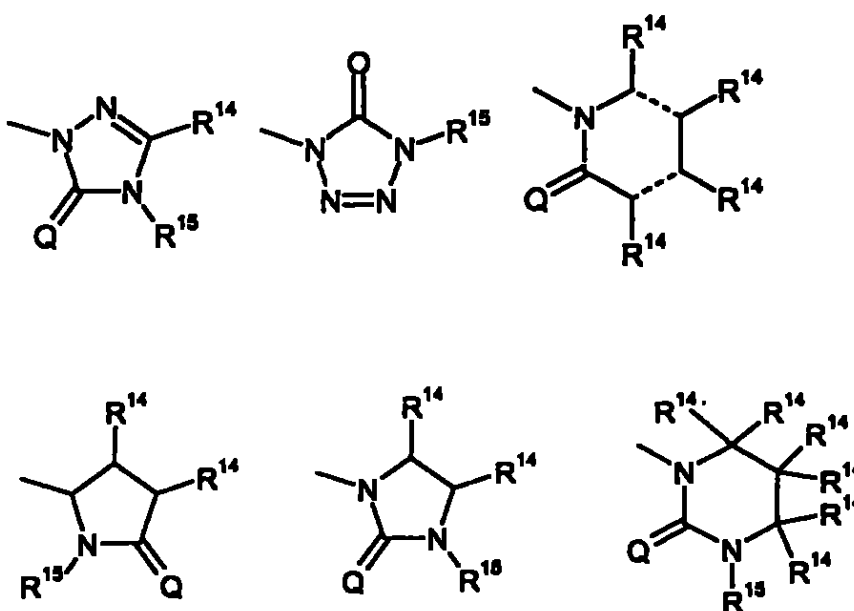
3.- Compuestos de la fórmula (I) según las reivindicaciones 1 o 2, caracterizados porque

- m** significa los números 0, 1, 2 o 3,
- A** significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), etano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo o butano-1,4-diilo (tetrametileno),
- R¹** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo,
- R²** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi substituidos respectivamente en caso

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

R⁴

significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes



R⁵ significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo o por metoxi, o significa en caso dado también –en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R⁵ etano-1,2-diilo (dimetileno) propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno),

- R⁶** significa hidróxi, formilóxi, significa metóxi, etóxi, n- o i-propóxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, acetilóxi, propionilóxi, n- o i-butirolóxi, metoxycarbonilóxi, etoxycarbonilóxi, n- o i-propoxycarbonilóxi, metilaminocarbonilóxi, etilaminocarbonilóxi, n- o i-propilaminocarbonilóxi, metilsulfonilóxi, etilsulfonilóxi, n- o i-propilsulfonilóxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metóxi o por etóxi, significa propenilóxi, butenilóxi, propinilóxi o butinilóxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenóxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, bencilóxi, bencilmetóxi, fenilsulfonilóxi, fenilmetóxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluóormetilo, por metóxi, por etóxi, por n- o i-propóxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluóormetóxi o por trifluóormetóxi,
- R⁷** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metóxi, etóxi, n- o i-propóxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metóxi o por etóxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituídos respectivamente en caso

dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi o por trifluórmtoxi,

R² significa hidroxí, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o t-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi,

por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmoxi o por trifluórmoxi,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirola, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo,

etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,

- R¹⁴ . significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metilsulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino o di-i-propilamino, significa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o

significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o —en el caso en que los restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace— significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i- o s-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo o propeniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

4. Compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizados porque

- m significa los números 0, 1 o 2,
- A significa metileno o dimetileno,

- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiométilo, metilsulfinilmétilo, metilsulfonilmétilo, metoxi, etoxi, difluórmetoxi, trifluórmetoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo,
- R³** significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiométilo, metilsulfinilmétilo, metilsulfonilmétilo, metoxi, etoxi, difluórmetoxi, trifluórmetoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo,
- R⁵** significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa fenilo, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R⁵ significa etano-1,2-diilo (dimetileno), propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno),
- R⁶** significa hidroxí, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenoxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benzoiloxi, benzoilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituidos respectivamente en caso

dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R⁸ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa ciclopropilo substituído en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,

R⁹ significa hidroxi, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenilmetoxi,

- benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,
- R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituído en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,
- R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituído en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,
- R¹³ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o 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 substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,
- R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo,

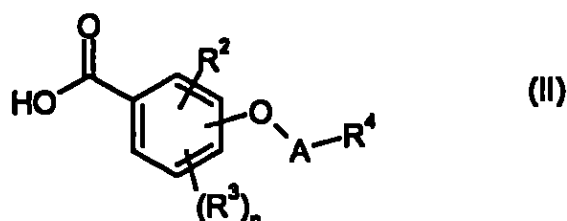
significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, 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, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, propenilo, propenilo, propenilo o propenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclopropilo, ciclopropilamino, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi o ciclopropilmetiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, fenilo, fenilo, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidrógeno, hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo, significa ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopropilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo,

por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

5.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque

(a) se hacen reaccionar ácidos benzoicos substituidos de la fórmula general (II)



en la que

n , A , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o derivados reactivos de los mismos, tal como por ejemplo los correspondientes halogenuros de acilo, cianuros de acilo o ésteres-
con compuestos de la fórmula general (III)



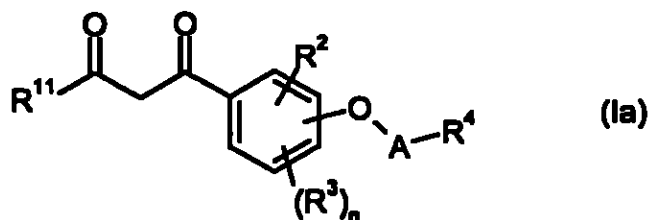
en la que

R^1 tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante, en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque

(b) se hacen reaccionar benzoilcetonas substituidas de la fórmula general (Ia)



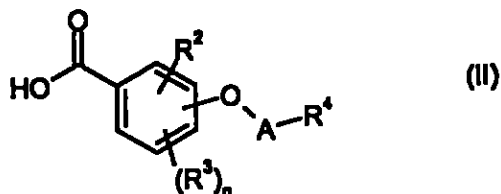
en la que

n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} tienen el significado indicado en la reivindicación 1, con un éster del ácido ortofórmico o con un N,N-dimetil-formamida-acetal o con un éster del ácido cianofórmico o con disulfuro de carbono (carburo de azufre) y con un agente de alquilación, y a continuación con hidroxilamina o con un aducto con ácido de la misma,

en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y en caso dado después de la realización de los procedimientos según la invención (a) o (b) se llevan a cabo en los compuestos, así obtenidos, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual, reacciones de substitución, de oxidación o de reducción y/o los compuestos de la fórmula general (I) se transforman de manera usual en los compuestos de tipo salino.

6. Compuestos de la fórmula (II)



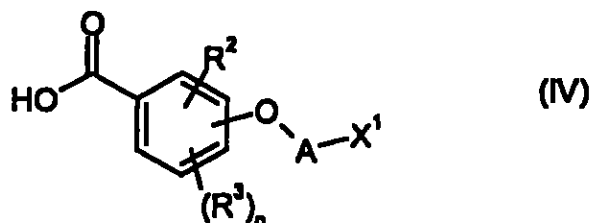
en la que

n , A , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

así como sus derivados reactivos.

7.- Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (II) según la reivindicación 6, caracterizado porque

(α) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (IV)



en la que

n, A, R² y R³ tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y

X¹ significa halógeno o significa alquilsulfonilo,

-o también sus derivados-

con compuestos heterocíclicos de la fórmula general (V)



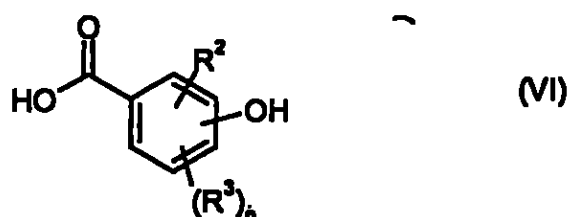
en la que

R⁴ tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, a temperaturas comprendidas entre 10°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de conversión en el ámbito de la definición de los substituyentes, en forma usual,

o porque.

(β) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o también sus derivados-

con hidroxialquilheterociclos de la fórmula general (VII)



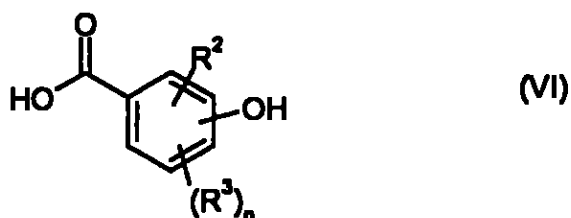
en la que

A y R^4 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

en presencia de agentes auxiliares de la condensación y, en caso dado, en presencia de un diluyente, a temperaturas comprendidas entre -20°C y $+50^{\circ}\text{C}$ y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de conversión en el ámbito de la definición de los sustituyentes, de manera usual,

o porque

(γ) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)

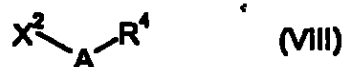


en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o también sus derivados-

con halógenoalquilheterociclos de la fórmula general (VIII)



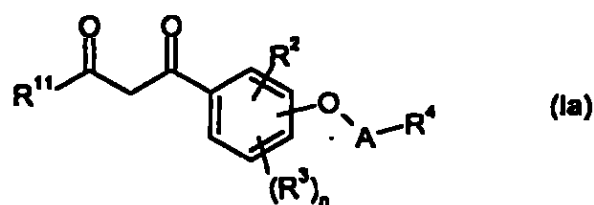
en la que

A y R⁴ tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y

X² significa halógeno, significa alquilsulfoniloxi o significa arilsulfoniloxi,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de conversión en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual.

8.- Compuestos de la fórmula (Ia)



en la que

n, A, R², R³, R⁴ y R¹¹ tienen el significado indicado en la reivindicación 1.

9.- Agentes caracterizados porque tienen un contenido en al menos un compuesto de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4.

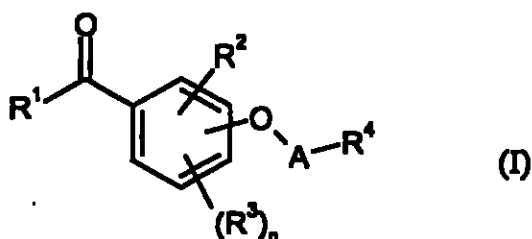
10.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4 o de agentes según la reivindicación 9 para la lucha contra las plantas indeseables.

11.- Procedimiento para la lucha contra las plantas indeseables, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4 o agentes según la reivindicación 9.

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general

(I)

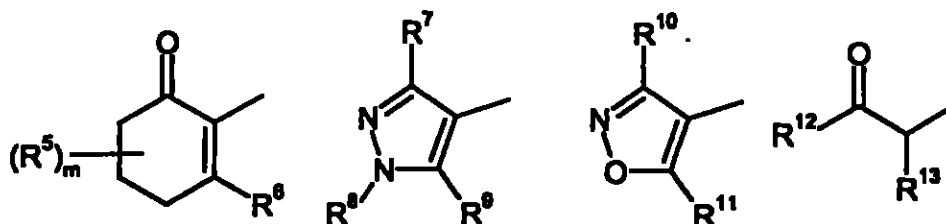


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileno),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ tienen uno de los significados indicados en la descripción,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R⁴ significa un agrupamiento heterocíclico con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, substituido en caso dado,

así como a procedimientos para su obtención, a productos intermedios y al empleo de estos compuestos como herbicidas.

118
C693
6028

CONSULADO DE COLOMBIA

CERTIFICACION

No. 145

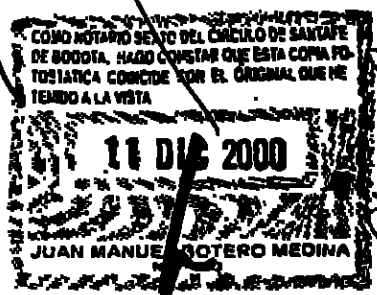
Bonn, 8 de agosto de 1996

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 autentico la firma de los signatarios DR. ROLF BRAUN y DR. JOACHIM GREMM del documento precedente, ejercian en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la empresa BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT 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\$106,00 = DM\$169,60

JUAN PABLO GONZALEZ
Segundo Secretario
Encargado de las Funciones Consulares



COPIA FIRMADA AL VISO DE LA
DOCUMENTO DESMPEKA
LAS FUNCIONES INDICADAS
1996 AGO 23 A 11:58
DE LAS FUNCIONES
SANTIAGO DE BOGOTA D.C.
RESPONSABLE DEL TEXTO
NO SE ASUME

1.044.572.247 E.2.2.2.

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª N° 72-35

BOGOTÁ, D. C. - COLOMBIA

REPRESENTACION Y PODER

119
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.

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; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia 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 ante 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 oficiales.

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 N° 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 of the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the tutela for writ mandamus, the protection of industrial 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 matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Given and signed this/Dado y firmado hoy

31st July 1996

In/en Leverkusen

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Signature

Firma

CAVELIER ABOGADOS

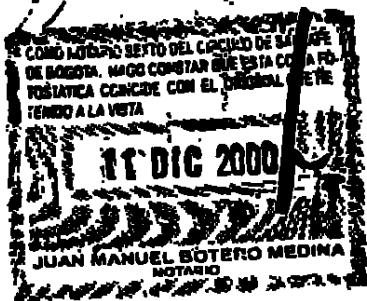
WPMODEKE-1 (MINUTA N° 12.1.1.2.5)

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 dárselo. 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 certificate* the legal existence of the company which grants the Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exercise of company purposes, and (3) that the persons who execute the Power of Attorney is authorized to do so. To this effect, show the Consul the evidence to prove the above facts and (3).



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

have a consular certificate
company which is in actual exercise
the persons who are
do so. To this effect
rove the above facts

120 X15

URNr 1799/1996

Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften der Herren

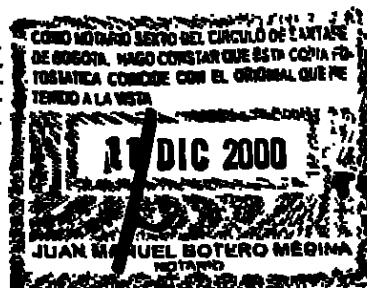
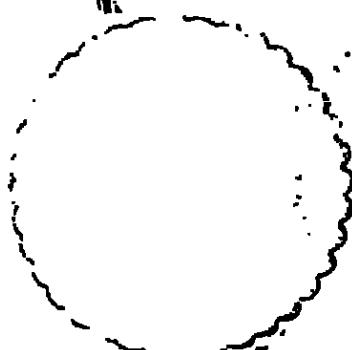
1. Dr. Wolf Braun, geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,
2. Dr. Joachim Gremm, geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,

- 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

H. L. m. A.
Notar



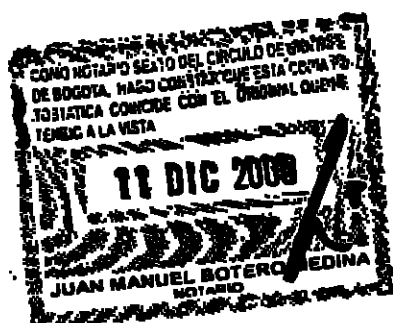
Die Echtheit der vorsehenden Unterschrift des Notars *Dirk Schindlerhoff in Leverkusen* sowie die Echtheit des beigefügten Dienststempels - siegels werden hiermit bestätigt. Zugleich wird bescheinigt, daß der Notar zur Vornahme der Amtshandlung befugt war.

Köln, den 02. Aug. 1996

Der Präsident des Landgerichts

R. Wahlmich
(Dr. Wahlmich)





121

TRADUCCION OFICIAL No. 5424

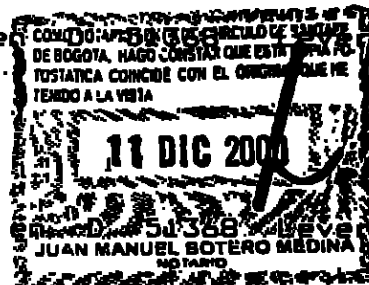
de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

(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 Leverkusen, Bayerwerk,
 2. Dr. Joachim Gremm, domiciliado en Leverkusen, Bayerwerk,
- a quienes conozco en persona-



122 422

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



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
[Firma]
C. C. *[Firma]*
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLOS)
EN ESTA NOTARIA. 9 SET. 1996

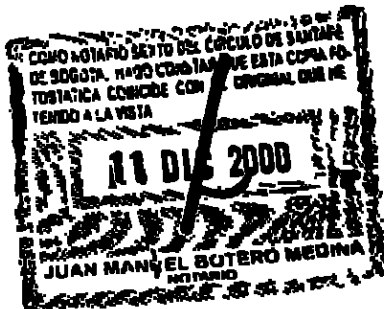
[Firma]

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.



JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.
[Firma]
150 SET 14 1996
RESPONSABILIDAD DEL REVISOR
NO SE ASUME

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES
D. C. LEGAL
CUYA FIRMA APARECE EN
LAS FUNCIONES INDICADAS
DOCUMENTO SE RECONOCE
205398
23 SET 1996



124 122

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

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

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

TELEFAX: (57) (1) 2388850
CABLES CAVELEYES
TELEX: 48478

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

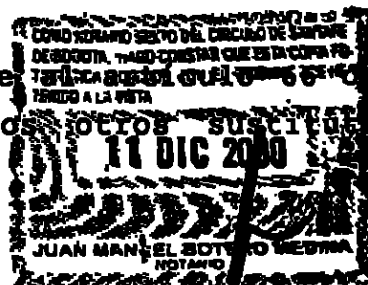
Poderdante: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

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 Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,



German Cavelier

GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

Acepto:

Emilio Ferrero

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 1998

Ante M^{te} JUAN MANUEL BOTERO MEDINA

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA

Compareció(en) personalmente,

[Firma]

[Firma]

quien(es) exhibió,erón, la(s) C. C.

418010

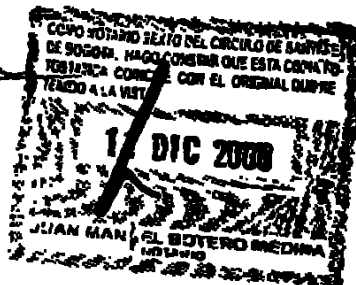
y la(s) Libreta(s) milita,erón, (es).

2877924

77852 7787929

domiciliado(s) en Bogotá, y (señalando) que la(s) firma(s) que
aparece(n) en el presente documento, es/son de la(s) suya(s), y que
el contenido es verídico y cierto.
En constancia se firmó esta diligencia.

[Firma]



Emilio Ferrera





CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA
TOKIO-JAPON

125
08733
06028

El suscrito, Encargado de las Funciones Consulares en
Tokio, vistos los siguientes documentos:

- 1) Certificado de registro mercantil de la
compañía;
- 2) Certificado auténtico sobre autorización para
otorgar el poder;

C E R T I F I C A :

Que la compañía NIHON BAYER AGROCHEM K.K. - - - - -
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
del Japón y cumple su objeto social conforme a las
mismas.

Que el señor KOICHI TATENO - - - - - en su
carácter de "PRESIDENT"
de la citada compañía, está autorizado para conferir
el poder adjunto.

Que el señor TAKEO SAITO - - - - - , quien
autentica el mencionado documento,
autorizado de la División Consular de
Relaciones Exteriores del Japón, y su firma coincide
con la registrada en este Consulado.

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

Tokio, 2 de Agosto de 1994



[Firma]
Ricardo Duarte
Segundo Secretario
Encargado de
Las Funciones Consulares

[Firma]
Bernarda R. de Silaritas
Traductora e Interprete Oficial
Removida 03-11-1994

Número: 82

Derechos: US\$106 (Resolución 2570, Sep.30/92)
(Ciento seis dólares)

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE



COMO NOTARIO DEL CÍRCULO DE SAN DIEGO
DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA
FOTOSTÁTICA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE
SIDO A LA VISTA

18 DIC 2000

JUAN MANUEL BOTERO GARCÍA
NOTARIO

*Remite a la Oficina de
Gestión y Atención al Ciudadano*

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES
BOGOTÁ
0820
RECEBIDO
18 DIC 2000

Ricardo Lora

RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
A H. 15
SECRET - 4
DEFE DE LEGALIZACIÓN
SANTAFE DE BOGOTÁ D.C.
LAS FUNCIONES INDICADAS
DOCUMENTO DESEMPLA

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISEKI
CARRERA 4ª N° 72-35
BOGOTÁ 8 - COLOMBIA



REPRESENTACION Y PODER

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)/Yo (nosotros), abajo firmado (s)
NIHON BAYER AGROCHEM K.K.

wohnhaft in/domiciliado(s) en
4-10-8, Takanawa, Minato-Ku, Tokyo, Japan

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; y EMILIO FERRERO, tpa. 31929; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como 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 suplente, 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, y bajo las mismas reglas, 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, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas y de servicios; el depósito de nombres comerciales y enseñanzas; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, desistirse, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos hechos por agentes oficiosos.

Para patentes, modelos y dibujos; marcas de fábrica y de servicios; nombres comerciales y enseñanzas.

Für Patente, Modelle und Zeichnungen; Warenzeichen und Servicezeichen; Handelsnamen-und-zeichen.

VERTRETUNG UND VOLLMACHT

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519; und EMILIO FERRERO, tpa. 31929; wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter, beziehungsweise, als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiligen oder definitiven Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fällen der Hauptvertreter, oder der erste oder der zweite Stellvertreter, beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten, oder Kolumbianischen Konsul im Auslande; und wenn es ein Hindernis sei, mittels der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendet, einer oder anderen, ordnungsweise werden die Vertretung ausüben und sie zu sich nehmen nur auf Grund sie auszuüben, mit Aufhören zur Zeit der Ausübung der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter, beziehungsweise, oder alle so. Ausserdem, und unter denselben Bedingungen, verleihen den genannten Rechtsanwälten die Vollmacht, und um den Schutz meiner (unser) industriellen Eigentum zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb; zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n) damit sie die verschiedenen Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs- und juristischem Charakter, in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten: a) Erlangung von Patenten, Modellen, und Zeichnungen; Registrierung von Waren-, Sammel-Defensive- und Service-zeichen; Aufbewahrung von Handelsnamen- und zeichen; ihre Erneuerung und Übertragung, Names und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertraglizenz; b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmaßnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil-, Straf-, Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse, die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und; c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am \Dado y firmado hoy July 22, 1994 at Tokyo, Japa
NIHON BAYER AGROCHEM K.K.

in /en

Koichi Tateno
Firma Unterschrift

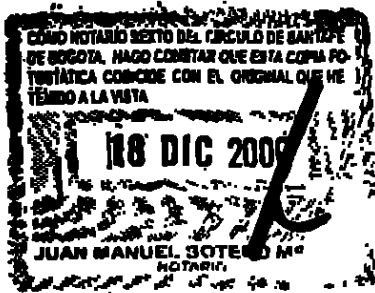
NIT 287-CO

Koichi Tateno (President)

Bernardo R. de Martinis
Traductor e Interpretes Oficial
Resolución 603 Magistratura 1994

BEMERKUNG FÜR ÜBERTRAGER: Die konsularische Legalisierung ist notwendig mit konsularischer Bestätigung über die jetzigen Existenz der Gesellschaften, die Vollziehung seiner gesellschaftlichen Zwecke, und daß seine Vertreter die diese Urkunde ausfertigen, berechtigt sind es zu tun. Dafür bitte dem Konsul die entsprechenden Dokumente vorzeigen.

LEGALISIERUNG



Die konsularische Legalisierung ist notwendig.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según los artículos 65 del C. de P. C. y 480 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social, que quien confiere el poder es su representante y puede otorgar el poder, y seguidamente autenticar la firma de éste.

平成 6 年 登 簿 第 0756 号

認 証

同級の委任状における作成名義人日本バイエルアグロケム株式会社代表取締役館野浩一の代理人渡辺晃吉は当職の面前において本人が作成名義人の署名を自認していると陳述した。以下余白

よつて、これを認証する。

平成 6 年 7 月 27 日、本公証役場において

東京都千代田区丸の内 2 丁目 1 番 2 号

東京法務局所属

公証人

豎 山 真 一

總公証 № 021072 号

証 明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違り、かつ、その押印は、真実のものであることを証

平成 6 年 7 月 27 日

東京法務局長 荒木友雄

Bernardo R. de Martinez

Traductor e Interpret Oficial

Resolución 603 Minjusticia 1991

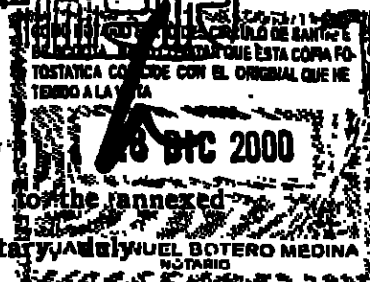
CERTIFICATE

This is to certify that the signature affixed to the annexed Notarial Certificate has been provided by Notary JUAN WUEL BOTERO MEDINA authorized by the Tokyo Legal Affairs Bureau and that the Official Seal appearing on the same is genuine.

Date JUL 27 1994

Tomoo ARAKI

Director of the Tokyo Legal Affairs Bureau





公証人

For legalization by the foreign consul in Japan,
this is to certify that the Seal affixed to
the surface is genuine.
Tokyo, JUL. 28. 1994

Official
Ministry of Foreign Affairs
(Consular and Migration Policy Division)

Bernardo R. de Martinez
Interpreter & Interpreter Official
Resolución 603 Minjusticia 1991

NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Kokichi Watanabe, an agent of Koichi Tateno who is President of NIHON BAYER AGROCHEM K.K. and who is authorized to sign to the attached document on behalf of the said company organized and existing according to the laws of Japan, located at No. 10-8, Takanawa 4-chome, Minato-ku, Tokyo, Japan
....., stated in my very presence that said Koichi Tateno
..... acknowledge(s)
himself (themselves) to have signed to the attached document.

Dated this 27th day of July, 1994.

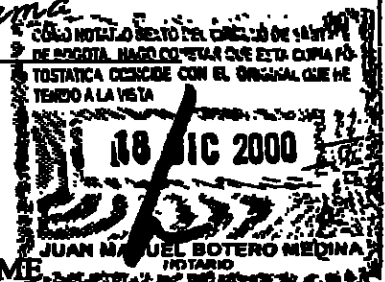


Shinichi Tateyama

SHINICHI TATEYAMA

NOTARY

1-2, MARUNOUCHI 2-CHOME
CHIYODA-KU, TOKYO, JAPAN



ATTACHED TO

TOKYO LEGAL AFFAIRS BUREAU

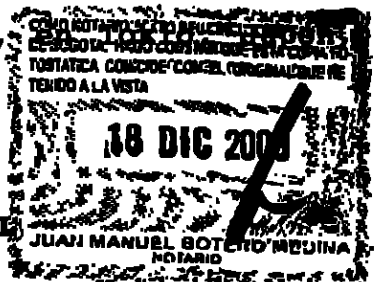


Bernarda R. de Martinez
Traductora e Interprete Oficial
Resolución 633 Minjusticia 1991

TRADUCCION OFICIAL No. 9.154.94 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta traducción ha sido preparada por Bernarda R. de Martínez, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolución No. 683 de 1991.

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un Poder escrito en inglés y español otorgado por la sociedad **NIHON BAYER AGROCHEM K.K.**, a favor de los Doctores **GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO**).

Dado y firmado hoy 22 de julio de 1994, en Tokio, por **Koichi Tateno, (Presidente)**.



CERTIFICADO NOTARIAL

Por medio del presente se certifica que **Koichi Watanabe**, representante de **Koichi Tateno** quien es el Presidente de **NIHON BAYER AGROCHEM K.K.**, y quien está autorizado para firmar el documento adjunto a nombre de la sociedad mencionada constituida y existente de acuerdo con las leyes del Japón, la cual está ubicada en No. 10-8, Takanawa 4-Chome, Minatu-ku, Tokio, Japón....., declaró en mi presencia que el mencionado **Koichi Tateno**..... reconoce (reconocen tachado) haber firmado el documento adjunto. Fechado hoy 27 de julio de 1994.

130 28

(Firmado), Shinichi Tateyama

Notario

1-2, MARUNOUCHI 2-CHOME,
CHIYODA-KU, TOKIO, JAPON

ADSCRITO A

LA OFICINA DE ASUNTOS LEGALES DE TOKIO

(Sello en tinta roja en japonés)

(Se traduce del inglés texto escrito en inglés y japonés)

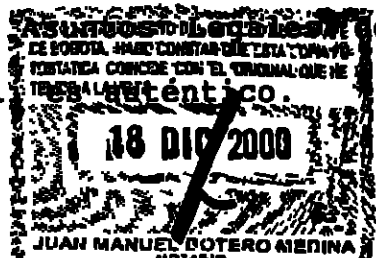
CERTIFICADO

Por medio del presente se certifica que la firma que aparece en el Certificado Notarial adjunto fue estampada por un Notario debidamente autorizado por la Oficina de Asuntos Legales de Tokio y que el sello oficial que aparece allí es auténtico.

Fecha 27 de julio de 1994

Tomoo ARAKI

Director de la Oficina de Asuntos Legales
de Tokio



(Sello en tinta azul), MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES JAPON

(Sellos en tinta roja en japonés)

(Al dorso), Para la legalización del cónsul extranjero en el Japón, por medio del presente se certifica que el sello estampado en la superficie es auténtico.

Tokio 28 de julio de 1994.

(Firmado), T. Saito

Funcionario

Ministro de Relaciones Exteriores

(División de Política Consular y de Migración)

(Al dorso), Legalización de la firma que antecede expedida por el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES, bajo el No. 0826(ilegible), de fecha 06 de septiembre de 1994 y firmada por el Jefe de Legalizaciones.

COMO NOTARIO DEL CÍRCULO DE SANTO
DE HOBOYA, HAGO CONSTAR QUE EN LA CIUDAD DE
TOS DE LOS ANCHOS, DEL MUNICIPIO DE SAN JUAN DE
TENIDO A LA VISTA

78 DEC 2000

JUAN MANUEL FOTERO MEDINA
NOTARIO

BRM.4

Bernardo R. de Murrin
Traductores e Interprete Oficial
Resolución 683 Minjusticia 1991

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO DE SANTAFE
DE BOGOTA HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE
[Signature]
C. C. *[Signature]*
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLA)
EN ESTA NOTARIA.
09 SEP 1904
SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

[Circular Stamp: NOT. SEXTO ENCARGADO PABLO MENDEZ BARRAJAS]

C. C. [Signature]
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLA)
EN ESTA NOTARIA.

SANTAFE DE BOGOTÁ, D.C.



NO SE AGRADE
RECIBO DEL TEXTO

13-12-73

SECRETARIA DE SALUD
SALUD PUBLICA

Ministerio de Salud
Bogotá

005290

25/12/73

SECRETARIA DE SALUD

COMO NOTARIO DEL CIRCULO DE SAN
DE BOGOTA, HACER CONSTAR QUE LA COPIA FO
TOSTATICA CONFORME CON EL ORIGINAL QUE HE
TENIDO A LA VISTA
18 DIC 2000
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

132 7

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49, No. 72-35

BOGOTA 8, COLOMBIA

TELEFAX: (57) (1) 2358850

TELEX: 45479 CAVE CO

(23)7407375 CAVE UC

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE

TELEFONO (57) (1) 2130100

CABLES: CAVELEYES

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

Poderdante: NIHON BAYER AGROCHEM K.K.

Poder conferido el: 22-07-94

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. 2-877-824 de Bogotá

Acepto:

EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-780-2



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Reyni
Technologies S.A.
Bogotá D.C. - Colombia

133

Expediente No		01002813	No de Follo
Item		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



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

Aktenzeichen:

100 01 588.3 ✓

Anmeldetag:

17. Januar 2000 ✓

Anmelder/Inhaber:

Bayer AG, Leverkusen/DE;
Nihon Bayer Agrochem K.K., Tokio/JP
Erstanmelder: Bayer AG, Leverkusen/DE;

Bezeichnung:

Substituierte Arylketone

IPC:

C 07 D, A 01 N

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

München, den 3. November 2000
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

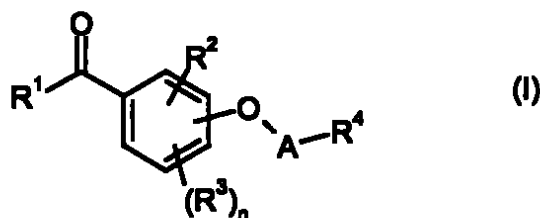
Seller

Substituierte Arylketone

Die Erfindung betrifft neue substituierte Arylketone, Verfahren zu ihrer Herstellung
und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte substituierte Arylketone herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, EP-A-352543, EP-A-418175, EP-A-487357, EP-A-527036, EP-A-527037, EP-A-560483, EP-A-609797, EP-A-609798, EP-A-625505, EP-A-625508, EP-A-636622, US-A-5804532, US-A-5834402, US-A-5846906, US-A-5863865, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I)

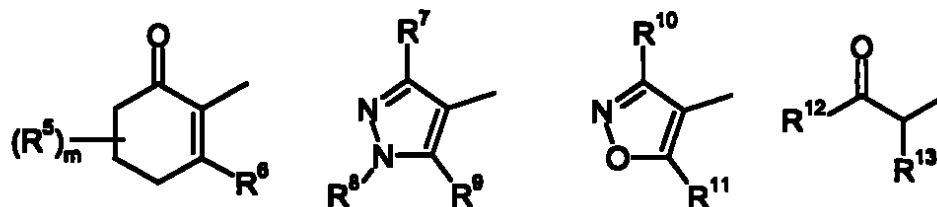


in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

A für Alkandiyol (Alkylen) steht,

R^1 für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



wobei

5

m für die Zahlen 0 bis 6 steht,

R^5 für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylthio oder Aryl steht, oder - für den Fall, daß m für 2 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Alkandiyl (Alkylen) steht,

10

R^6 für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Aryloxy, Arylthio, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy oder Arylalkylthio steht,

15

R^7 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxy-carbonyl oder Cycloalkyl steht,

20

R^8 für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

25

R^9 für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyloxy, Alkylamino-

carbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy steht,

5 R^{10} für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl oder Alkylthio steht,

R^{11} für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl steht,

10 R^{12} für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl steht, und

15 R^{13} für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl steht,

20 R^2 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

25 R^3 für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und

30 R^4 für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein oder zwei Sauerstoffatome oder ein oder zwei

Schwefelatome, oder eine oder zwei SO-Gruppierungen oder eine oder zwei SO₂-Gruppierungen) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,

5

- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) -

10

gefunden.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkandiyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

15

Bevorzugte Substituenten bzw. bevorzugte Bereiche der oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im Folgenden definiert.

n steht bevorzugt für die Zahlen 0 oder 1 .

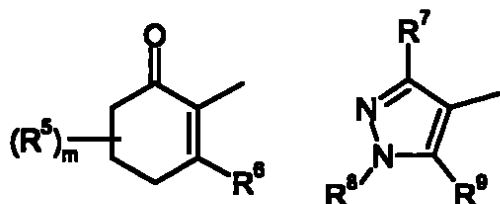
20

m steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4.

A steht bevorzugt für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen.

25

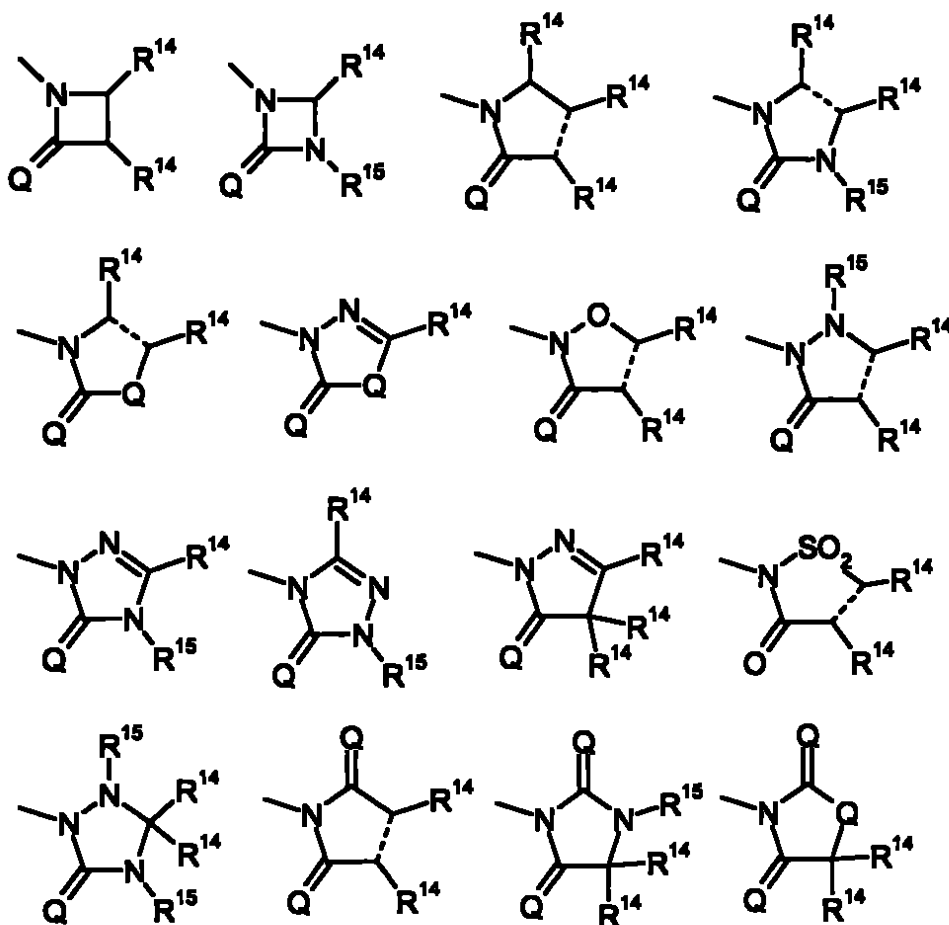
R¹ steht bevorzugt für eine der nachstehenden Gruppierungen

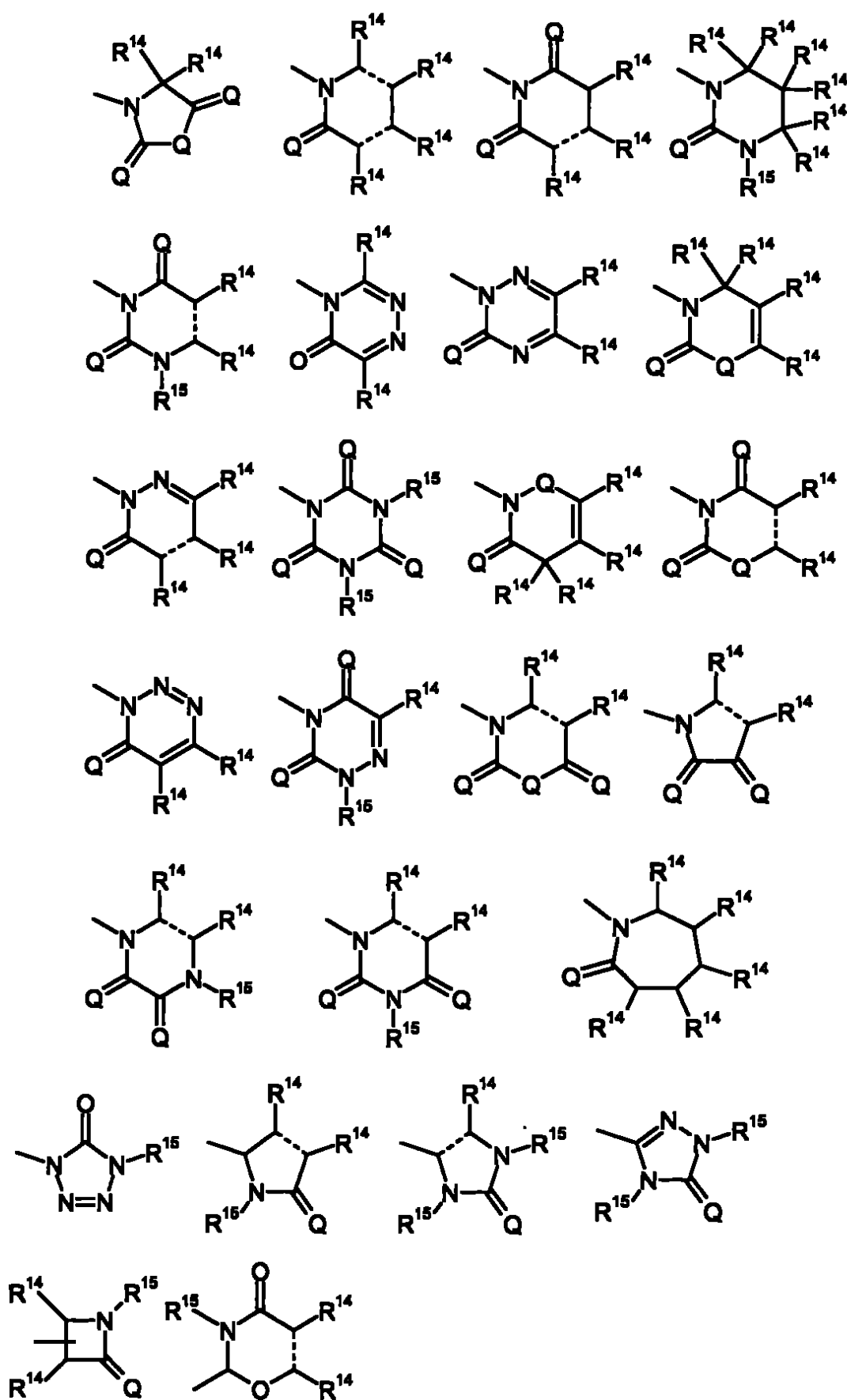


R² steht bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

R³ steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

R⁴ steht bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen





worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

5 Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10 R¹⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder – für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R¹⁴ und R¹⁴ sich an einer Doppelbindung befinden – auch zusammen mit dem benachbarten Rest R¹⁴ für eine Benzogruppierung steht, und

20
25
30 R¹⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-

C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R¹⁴ oder R¹⁵ für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Alkandiyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

5

10

15

wobei die einzelnen Reste R¹⁴ und R¹⁵ – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

20

R⁵ steht bevorzugt für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Alkandiyl (Alkylen) mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen.

25

R⁶ steht bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils ge-

30

gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Aryloxy, Arylthio, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy, Arylalkylthio oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.

R⁷ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

R⁸ steht bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.

R⁹ steht bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkynyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch

Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.

5

R¹⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

10

R¹¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

15

R¹² steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

20

R¹³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

25

A steht besonders bevorzugt für Methylen, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Ethan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,2-diyl, Butan-1,3-diyl oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).

30

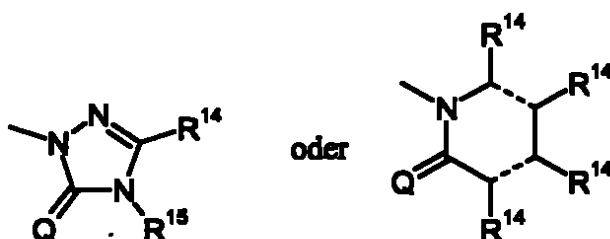
m steht besonders bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3.

R² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

R³ steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

R⁴ steht besonders bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen

- 12 -



R⁵ steht besonders bevorzugt für 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).

R⁶ steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio oder Benzyl.

- 5 **R⁷** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thio-
carbamoyl, 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, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s-
oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-
Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methyl-
sulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxy-
carbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl,
Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- 10
- 15 **R⁸** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl,
Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls
durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl,
Propinyl oder Butinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor,
Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclo-
pentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentyl-
methyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro,
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-
Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-
Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder
Benzyl.
- 20
- 25 **R⁹** steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegeben-
falls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy
substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy,
Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy,
Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyl-
oxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methyl-
sulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gege-
- 30

benenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy.

5

R¹⁰ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thio-carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio.

10

15

R¹¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclo-propyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

20

R¹² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclo-propyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

25

R¹³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy,

30

Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl.

5

R^{14} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyl-oxy, Butenyl-oxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino, Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenyl-oxy, Phenylthio, Phenylamino,

15

20

25

30

Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung.

5

R^{15} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14} oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen),

10

15

20

wobei die einzelnen Reste R^{14} und R^{15} – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

25

A steht ganz besonders bevorzugt für Methylen oder Dimethylen.

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

30

R^2 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl,

Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

5 R^3 steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

10

15 R^5 steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, für Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).

20

25

30

R^6 steht ganz besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio oder Benzyl.

R⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl.

R⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl.

R⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy.

R¹⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n-

oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio.

5 R^{11} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl.

10 R^{12} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl.

15 R^{13} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, 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.

20 R^{14} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, 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, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, für

jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl, Propenyloxy, Propenylthio oder Propenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropyloxy, Cyclopropylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy oder Cyclopropylmethylanino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-propoxy substituiertes Phenyl, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzylthio oder Benzylamino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung.

R^{15} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylanino, Ethylanino oder Dimethylanino, für Propenyl oder Propinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl oder Cyclopropylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14} oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen),

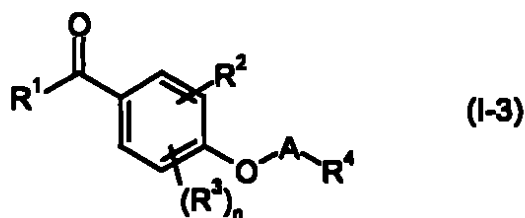
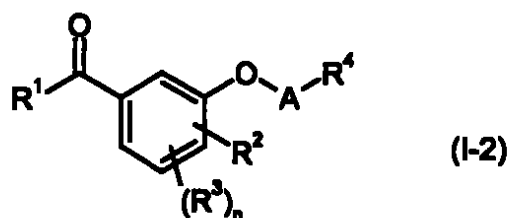
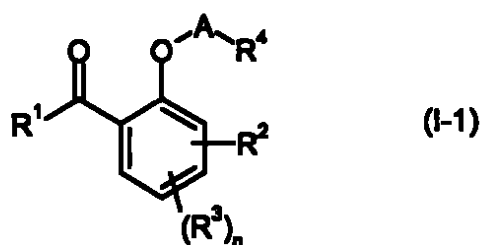
wobei die einzelnen Reste R^{14} und R^{15} - soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

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

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

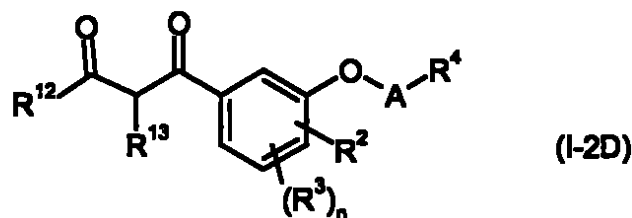
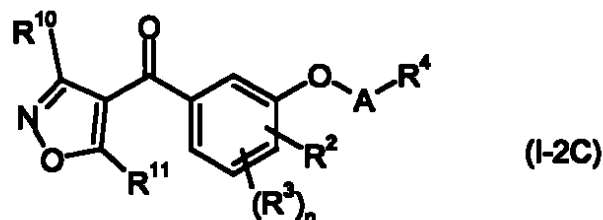
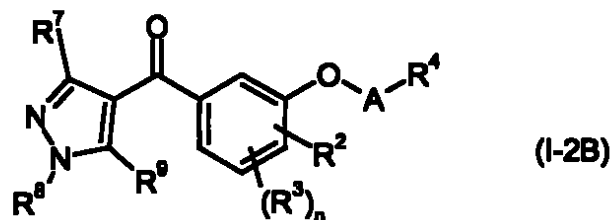
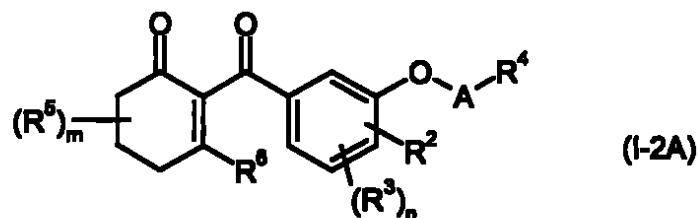
5 Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-1) bis (I-3) werden besonders hervor-
gehoben:



15 n, A, R¹, R², R³ und R⁴ haben hierbei jeweils die am meisten vorzuziehende Bedeutung.

Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-2A) bis (I-2D) werden ganz besonders hervorgehoben:



m, n, A, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ haben hierbei jeweils die am meisten vorzuziehende Bedeutung.

Gegenstand der Erfindung sind auch Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C₁-C₄-Alkyl-ammonium-, Di-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tetra-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium-, C₅- oder C₆-Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C₁-C₂-alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen der Formel (I), in welcher vorzugsweise n, A, R¹, R², R³ und R⁴ die oben als bevorzugt angegebenen Bedeutungen haben.

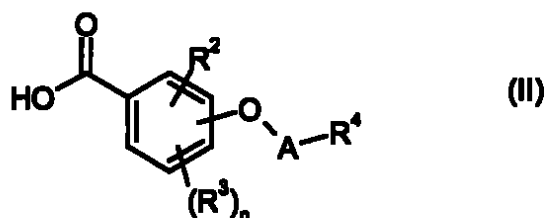
Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese

Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

5 Die neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I), wenn man

(a) substituierte Benzoesäuren der allgemeinen Formel (II)



in welcher

n, A, R², R³ und R⁴ die oben angegebene Bedeutung haben,

15

- oder reaktionsfähige Derivate hiervon, wie z.B. entsprechende Säurehalogenide, Säurecyanide oder Ester -

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

20



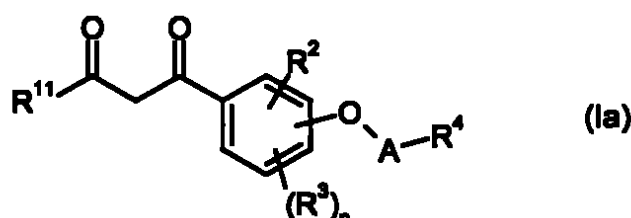
in welcher

25 R¹ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

5 oder wenn man

(b) substituierte Benzoylketone der allgemeinen Formel (Ia)



10

in welcher

n , A , R^2 , R^3 , R^4 und R^{11} die oben angegebene Bedeutung haben,

15

mit einem Orthoameisensäureester oder mit einem N,N-Dimethyl-formamid-acetal oder mit einem Cyanoameisensäureester oder mit Carbondisulfid (Schwefelkohlenstoff) und einem Alkylierungsmittel, und anschliessend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

20

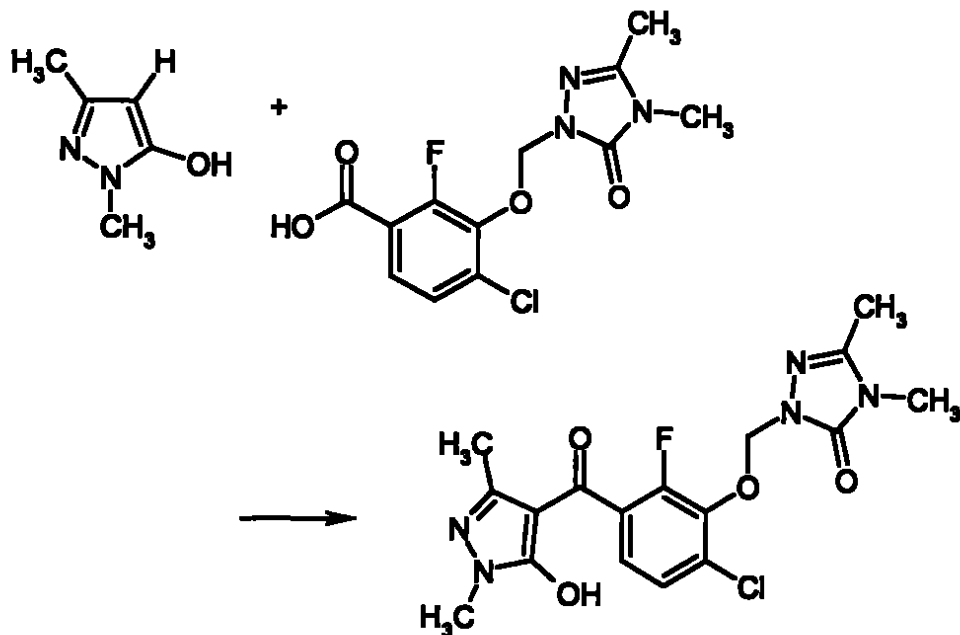
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

25

und gegebenenfalls im Anschluss an die Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) oder (b) an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise Substitutions-, Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt und/oder die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auf übliche Weise in salzartige Verbindungen überführt.

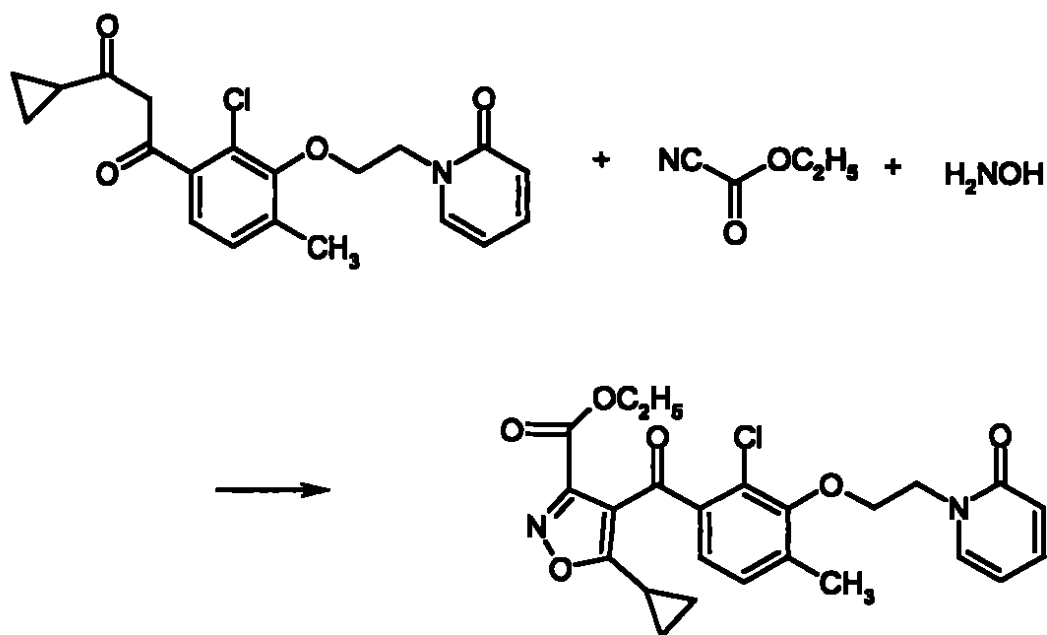
Verwendet man beispielsweise 4-Chlor-3-[(3,4-dimethyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-3-yl)-methoxy]-2-fluor-benzoesäure und 1,3-Dimethyl-5-hydroxy-pyrazol als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

5



Verwendet man beispielsweise 1-[2-Chlor-4-methyl-3-[2-(2-oxo-1(2H)-pyridinyl)-ethoxy]-phenyl-3-cyclopropyl-1,3-propandion, Cyanoameisensäure-ethylester und Hydroxylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

10

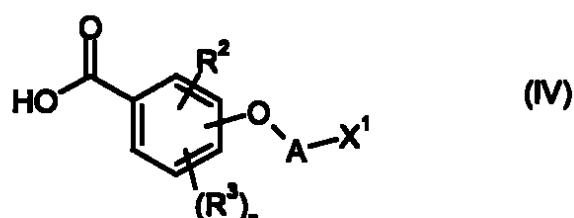


Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoesäuren sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben n, A, R², R³ und R⁴ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, A, R², R³ und R⁴ angegeben worden sind.

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 substituierten Benzoesäuren -oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester - wenn man

(a) entsprechende Halogenalkoxybenzoesäuren der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

5 n , A , R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben und

X^1 für Halogen (insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom) oder für Alkylsulfonyloxy (insbesondere Methylsulfonyloxy oder Ethylsulfonyloxy) steht,

10

- oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester -

mit heterocyclischen Verbindungen der allgemeinen Formel (V)

15



in welcher

20 R^4 die oben angegebene Bedeutung hat,

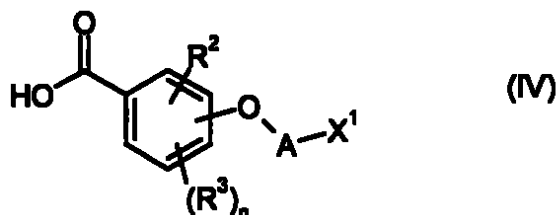
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumcarbonat, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Aceton, Butanon, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder Dimethylsulfoxid, bei Temperaturen zwischen 10°C und 150°C umsetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt (vgl. die Herstellungsbeispiele),

25

oder wenn man

(β) entsprechende Hydroxybenzoesäuren der allgemeinen Formel (VI)



5 in welcher

n , R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben,

- oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester -

mit Hydroxyalkylheterocyclen der allgemeinen Formel (VII)



15

in welcher

A und R^4 die oben angegebene Bedeutung haben,

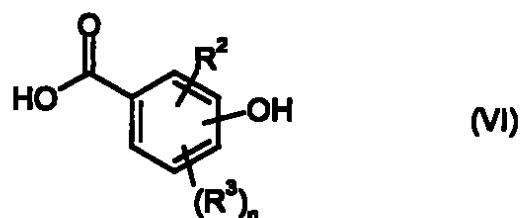
20

in Gegenwart von Kondensationshilfsmitteln, wie z.B. Azodicarbonsäure-diethylester und Triphenylphosphin, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrahydrofuran, bei Temperaturen zwischen -20°C und $+50^{\circ}\text{C}$ umgesetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt (vgl. die Herstellungsbeispiele),

25

oder wenn man

(γ) entsprechende Hydroxybenzoesäuren der allgemeinen Formel (VI)



5

in welcher

n , R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben,

10

- oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester -

mit Halogenalkylheterocyclen der allgemeinen Formel (VII)



15

in welcher

A und R^4 die oben angegebene Bedeutung haben und

20

X^2 für Halogen (insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom) oder für Alkylsulfonyloxy (insbesondere Methylsulfonyloxy oder Ethylsulfonyloxy) steht,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumcarbonat oder Triethylamin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Aceton, Butanon, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder

164 ~~186~~

Dimethylsulfoxid, bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C umgesetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

5

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat R^1 vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für R^1 angegeben worden ist.

10

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannte organische Verbindungen.

15

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoylketone sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (Ia) haben n , A , R^2 , R^3 , R^4 und R^{11} vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n , A , R^2 , R^3 , R^4 und R^{11} angegeben worden sind.

20

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (Ia) sind erfindungsgemäße, neue Verbindungen; sie können nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) hergestellt werden.

25

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines De-

30

hydratisierungsmittels durchgeführt. Es kommen hierbei die üblichen zur Bindung von Wasser geeigneten Chemikalien in Betracht.

5 Als Beispiele hierfür werden Dicyclohexylcarbodiimid und Carbonyl-bis-imidazol genannt.

Als besonders gut geeignetes Dehydratisierungsmittel wird Dicyclohexylcarbodiimid genannt.

10 Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittels durchgeführt.

15 Als Beispiele hierfür werden Natriumcyanid, Kaliumcyanid, Acetoncyanhydrin, 2-Cyano-2-(trimethylsilyloxy)-propan und Trimethylsilylcyanid genannt.

Als besonders gut geeignetes weiteres Reaktionshilfsmittel wird Trimethylsilylcyanid genannt.

20 Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines weiteren Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als weiteres Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im allgemeinen basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, 25 Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, 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-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 30 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU) in Betracht.

166 ~~167~~

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung von Orthoameisensäureestern oder N,N-Dimethyl-formamid-acetalen durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele werden Orthoameisensäure-trimethylester, Orthoameisensäure-triethylester, N,N-Dimethyl-formamid-dimethylacetal und N,N-Dimethyl-formamid-diethylacetal genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung von Cyanoameisensäureestern durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele werden Cyanoameisensäure-methylester und Cyanoameisensäureethylester genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung von (Carbondisulfid und) Alkylierungsmitteln durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele werden Methylchlorid, Methylbromid, Methyliodid, Dimethylsulfat, Ethylchlorid, Ethylbromid, Ethyliodid und Diethylsulfat genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) werden unter Verwendung von Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon durchgeführt. Als bevorzugtes Säureaddukt wird Hydroxylamin-Hydrochlorid genannt.

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung von Verdünnungsmitteln durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) kommen 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.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) 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.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) 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 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 Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, 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.

5

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.

10

15

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 Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

25

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische

30

und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

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 schaum-erzeugenden 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 Alkyl-

naphthaline, 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 schaum-erzeugende 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-Sulfit-ablaugen 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 Metallphthalocyanin-farbstoffe 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 %.

- 5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern („Safenern“) zur Unkrautbekämpfung verwendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

- 15 Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim (-sodium), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, BAS-662H, Bflubutamid, Benazolin (-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butoxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinidon (-ethyl), Cinnethylin, 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, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Dichlorprop (-P), 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, Eto-
25 benzanid, Fenoxaprop (-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L,

-methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone (-sodium), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpyrsulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl),
5 Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammonium), Glyphosate (-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxyethyl, -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, Mecoprop, 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, Oxa-
15 sulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Proflumizox, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Procarbazone (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl),
20 Pyriithiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tiocarbamil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

174 7

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

- 5 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.

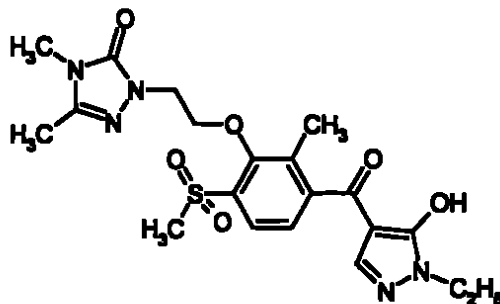
10

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.

- 15 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.

20

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

Herstellungsbeispiele:**Beispiel 1****(Verfahren (a))**

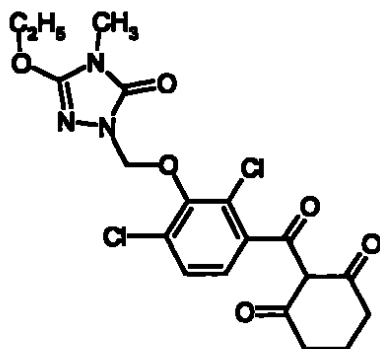
Zu einer Lösung von 1,1 g (2,7 mMol) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäurechlorid in 20 ml Dichlormethan gibt man nach einander 0,30 g (2,7 mMol) 1-Ethyl-5-hydroxy-pyrazol, 0,8 g (8,0 mMol) Triethylamin und einen Tropfen N,N-Dimethyl-formamid. Man rührt die Mischung ca. 24 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C), wäscht die Reaktionslösung nach einander mit 1N-Salzsäure und gesättigter Natriumchlorid-Lösung, trocknet über Magnesiumsulfat und entfernt das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 30ml Acetonitril gelöst und nach einander unter leichtem Kühlen mit 0,28 g (3,3 mMol) 2-Hydroxy-2-methyl-propionitril und 1,4 g (14 mMol) Triethylamin versetzt. Man rührt weitere 24 Stunden bei Raumtemperatur, entfernt den überwiegenden Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum und löst den Rückstand in Dichlormethan und 1N-Salzsäure. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert

Man erhält 1,1 g (88 % d. Theorie) 4-{3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylsulfonyl-benzoyl}-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol als öligen Rückstand.

Log P : 1,23.

Beispiel 2

5



(Verfahren (a))

10

1.95 g (5.4 mMol) 3-(3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoesäure werden in 75 ml Acetonitril gelöst und mit 0.61 g 1,3-Cyclohexandion (5.4 mMol) sowie 1.33 g Dicyclohexylcarbodiimid (DCC, 1.2 Äquiv.) versetzt. Nach 15-stündigem Rühren bei Raumtemperatur (ca. 20°C) werden 1.5 ml Triethylamin (2 Äquiv.) und 0.29 ml Trimethylsilylcyanid (0.4 Äquiv.) dazu gegeben. Nach zwei Stunden bei Raumtemperatur wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand in 10 %iger wäßriger Natriumcarbonat-Lösung verrührt und abfiltriert. Das Filtrat wird mit Diethylether geschüttelt und die wäßrige Phase mit 2N Salzsäure angesäuert. Das ausgefallene Produkt wird mit Dichlormethan mehrfach extrahiert, die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt.

20

Man erhält 1.3 g (53% der Theorie) 2-[3-(3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoyl]-1,3-cyclohexandion als zähes Harz.

LogP = 2.52.

25

177 2

Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

5

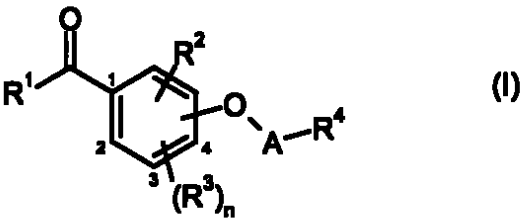
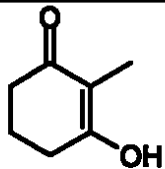
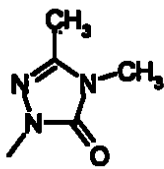
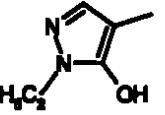
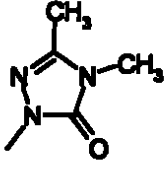
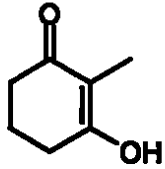
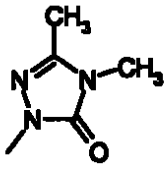
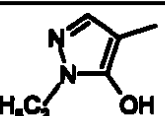
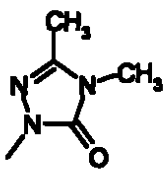
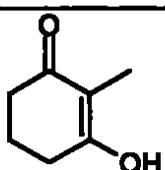
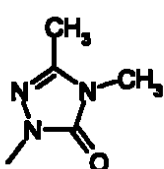
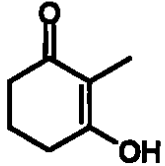
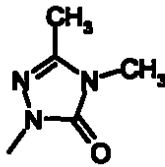
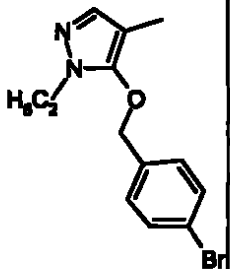
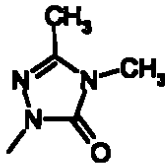
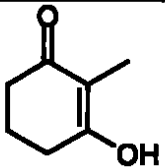
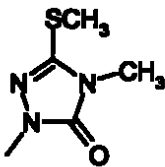
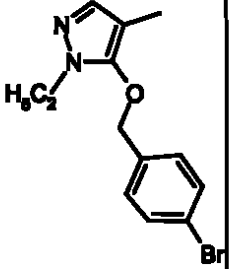
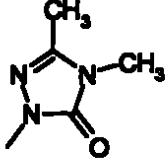
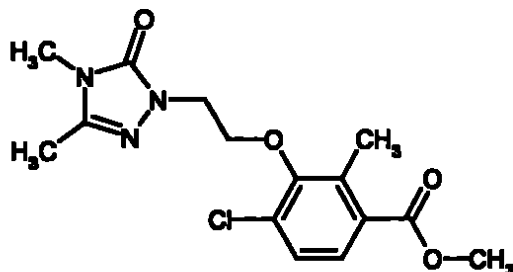


Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

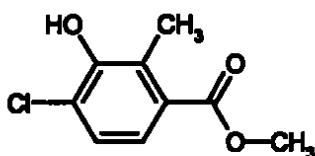
Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
3	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
4	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
5	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,52 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
6	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
7	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,68 ^{a)}
8	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,94 ^{a)}
9	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,58 ^{a)}
10	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,91 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
11	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	logP = 1,65 ^{a)}
12	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,07 ^{a)}
13	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,44 ^{a)}
14	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}

Ausgangsstoffe der Formel (II):**Beispiel (II-1)**

5

Stufe 1

10

In eine siedende Lösung von 100 g (0,6 Mol) 3-Hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester und 0,4 ml Diisopropylamin in 800 ml 1,2-Dichlor-ethan leitet man innerhalb von 4 bis 6 Stunden 43 g (0,606 Mol) Chlorgas ein. Nach dem Abkühlen wäscht man die Lösung nach einander mit jeweils 200ml 5 %iger Natriumhydrogensulfit-Lösung und mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung, trocknet die organische Phase über Magnesiumsulfat und entfernt das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum. Das als Rückstand erhaltene dunkelbraune Öl wird mit 30 ml Diethylether versetzt und zur Kristallisation auf 0° bis 4°C abgekühlt. Die ausgefallenen Kristalle werden durch Absaugen isoliert, mit wenig kaltem Diethylether gewaschen, und im Vakuum bei 30°C getrocknet.

15

20

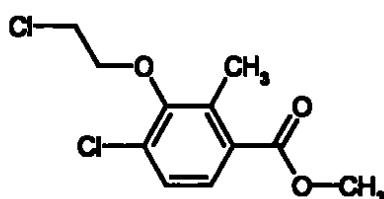
Man erhält 46,6 g (39 % d. Theorie) 4-Chlor-3-hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester.

Log P: 2,14.

Verwendet man an Stelle von 3-Hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester den entsprechenden Ethylester, so erhält man nach dem gleichen Verfahren 4-Chlor-3-hydroxy-2-methyl-benzoesäure-ethylester.

5 Schmelzpunkt: 51°C

Stufe 2



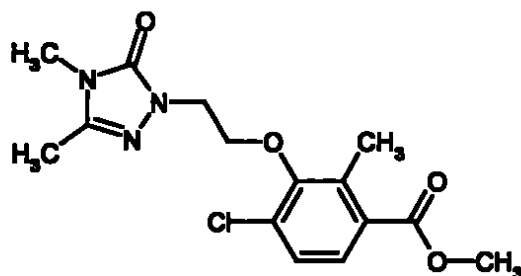
10

Zu einer Lösung von 25 g (0,125 Mol) 4-Chlor-3-hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester in 400 ml Acetonitril gibt man nach einander 34,2 g (0,248 Mol) gepulvertes wasserfreies Kaliumcarbonat und 29,3 g (0,125 Mol) 2-Chlor-ethanol-p-toluolsulfonat. Man erhitzt ca. sieben Stunden auf 70°C, läßt das Reaktionsgemisch abkühlen und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 200ml Dichlormethan und 300 ml Wasser gelöst. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

20

Man erhält 32,5 g (99 % der Theorie) 4-Chlor-3-(2-chlor-ethoxy)-2-methyl-benzoesäure-methylester als dunkles Öl.

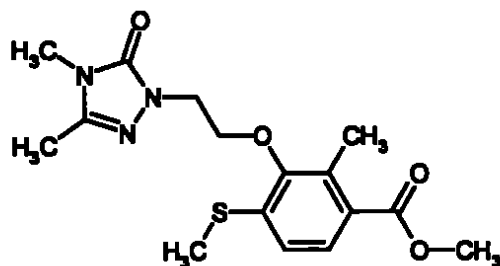
Log P = 3,52.

Stufe 3

5 Zu einer Lösung von 16,0 g (60,8 mMol) 4-Chlor-3-(2-chlor-ethoxy)-2-methylbenzoesäure-methylester in 70 ml Dimethylsulfoxid gibt man nacheinander 18,4 g (0,133 Mol) gepulvertes wasserfreies Kaliumcarbonat und 6,9 g (60,8 mMol) 3,4-Dimethyl-1,2,4-triazolin-5-on. Man erhitzt ca. sechs Stunden auf 90°C, lässt das Reaktionsgemisch abkühlen und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 140 ml Dichlormethan und 60 ml Wasser gelöst. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und im Wasserstrahlvakuum eingeeengt. Der ölige Rückstand wird mit 25 ml Petrolether verrührt. Das hierbei kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert.

15 Man erhält 18,5 g (80 % der Theorie) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methylbenzoesäure-methylester.

Log P: 1,94.

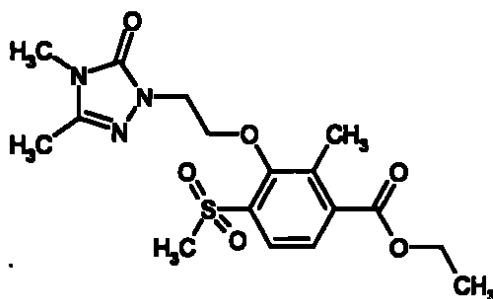
Beispiel (II-2)

Zu einer Lösung von 12,4 g (36,5 mMol) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure-methylester. in 100 ml N,N-Dimethyl-formamid gibt man unter Eiskühlung 3,3 g (44,5 mMol) Natriummethylmercaptid. Man rührt ca. sechs Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 300 ml Essigsäureethylester und 200 ml Wasser gelöst. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 5,4 g (42 % der Theorie) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylthio-benzoesäure-methylester.

Log P = 1,89.

Beispiel (II-3)



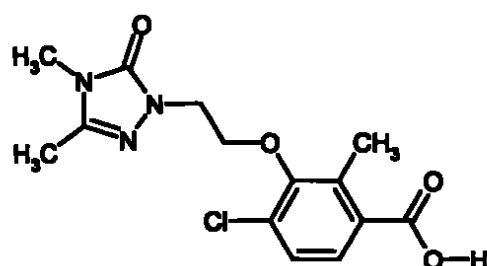
Zu einer Lösung von 12,3 g (33,7 mMol) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylthio-benzoesäure-ethylester. in 40 ml Essigsäure gibt man 10 mg Ammoniummolybdat-Tetrahydrat und 17,3g (178 mMol) 35%ige wäßrige Wasserstoffperoxid-Lösung. Man erwärmt die Reaktionsmischung ca. sechs Stunden auf 50° bis 60°C, verdünnt mit Wasser und extrahiert mit Essigsäureethylester. Die organische Phase wird abgetrennt, nacheinander mit Wasser, Natriumhydrogencarbonat-Lösung, Natriumthiosulfat-Lösung und abermals Wasser

gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 12,3 g (92 % der Theorie) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure-ethylester.

Log P = 1,76.

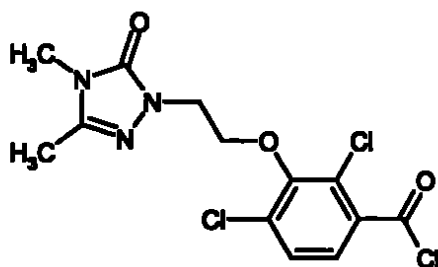
Beispiel (II-4)



Zu einer Lösung von 6,5 g (19,0 mMol) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure-methylester in 40 ml Ethanol gibt man 1,2 g (30mMol) eine Lösung von Natriumhydroxid in 20 ml Wasser. Man rührt die Lösung ca. 24 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C), und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in Wasser gelöst und mit Salzsäure angesäuert. Die entstehende Suspension wird mit Essigsäureethylester extrahiert, die organische Phase abgetrennt, mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 5,9 g (95 % der Theorie) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure.

Log P = 1,37.

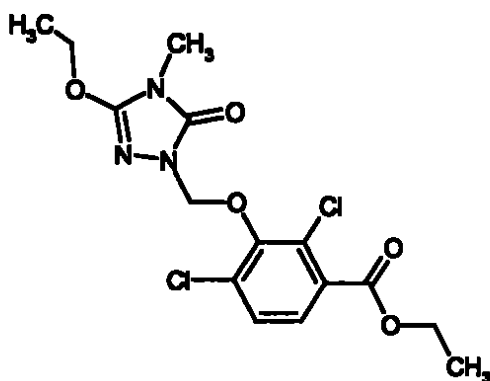
Beispiel (II-5)

- 5 2,3 g (6,65 mMol) 2,4-Dichlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-benzoesäure werden in 10 ml Thionylchlorid ca. 1,5 Stunden auf 70°C erwärmt. Man läßt die Reaktionslösung abkühlen und entfernt das überschüssige Thionylchlorid unter vermindertem Druck.

- 10 Man erhält 2,4 g (100 % der Theorie) 2,4-Dichlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-benzoesäurechlorid.

Log P = 1,24.

- 15 **Beispiel (II-6)**



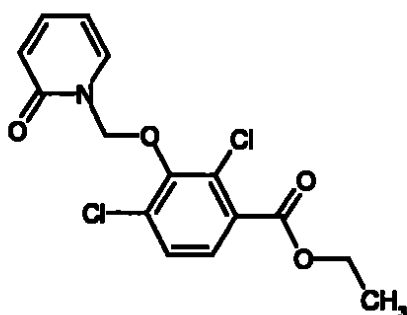
- 20 5 g (21.3 mMol) 2,4-Dichlor-3-hydroxy-benzoesäure-ethylester werden in 200 ml Tetrahydrofuran gelöst und mit 3.68 g (21.3 mMol) 1-Hydroxymethyl-3-ethoxy-4-methyl-1,2,4-triazolin-5-on versetzt. Nach Zugabe von 5.58 g (21.3 mMol) Tri-

phenylphosphin werden bei 0 °C 4.4 g 85 %iges Diethyl-diazo-dicarboxylat zuge-
tropft. Die resultierende Lösung wird über Nacht gerührt, im Wasserstrahlvakuum
eingeeengt und über Kieselgel filtriert (Essigsäureethylester/Hexan). Das Filtrat wird
eingeeengt und mit Diethylether versetzt. Der sich abscheidende Feststoff wird ab-
filtriert und vom Filtrat das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig ab-
destilliert.

Man erhält 6.8 g (82% der Theorie) 3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-
on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoesäure-ethylester als zähes Öl.

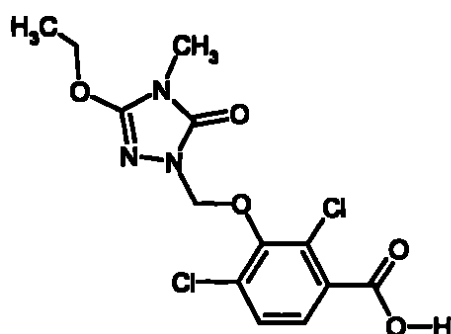
LogP = 2.77.

Beispiel (II-7)



2 g (8,5 mMol) 2,4-Dichlor-3-hydroxy-benzoesäure-ethylester werden in 30 ml
Acetonitril gelöst und nacheinander mit 0,86 g (8,5 mMol) Triethylamin und 1,2 g
(8,5 mMol) N-Chlormethyl-2-pyridon versetzt. Die resultierende Mischung wird
7 Stunden bei 60°C gerührt, mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester ex-
trahiert. Die organische Phase wird abgetrennt, mit gesättigter Natriumchlorid-
Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Lösungs-
mittel wird unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 2,4 g (82% % der Theorie) 2,4-Dichlor-3-(1H-pyrid-2-on-1-yl)-methoxy-
benzoesäure-ethylester.

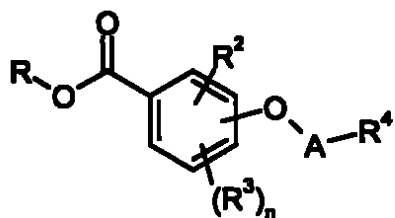
Beispiel (II-8)

6.4 g (16.3 mMol) 3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoessäure-ethylester werden in einem Gemisch aus 250 ml Cyclohexan und 25 ml Ethylenglycol-monomethylether in Gegenwart von 0.91 g gepulvertem Kaliumhydroxid 15 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) geführt. Es wird mit Wasser verdünnt und mit 2N Salzsäure angesäuert. Das ausgefallene Feststoff wird durch Absaugen isoliert.

Man erhält 4.05 g (69% der Theorie) 3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoessäure.

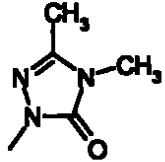
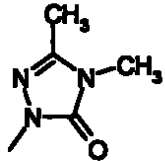
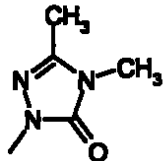
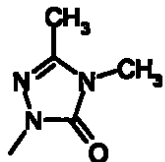
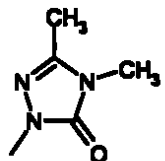
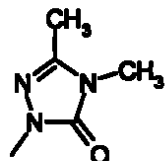
log P: 1,74.

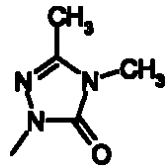
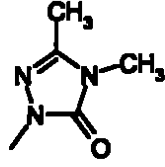
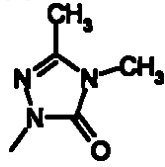
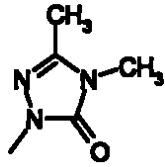
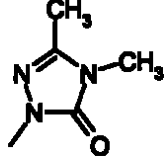
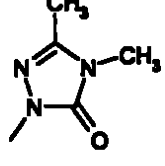
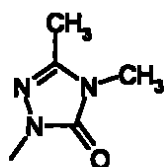
Analog zu den Beispielen (II-1) bis (II-8) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (II) oder reaktionsfähige Derivate hiervon - vgl. Formel (IIA) - hergestellt werden.

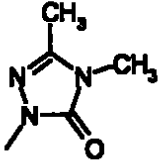
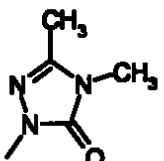
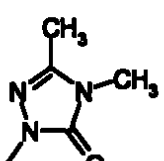
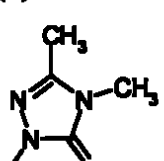
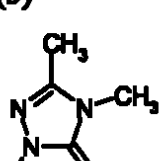
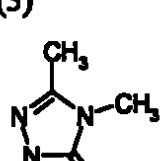


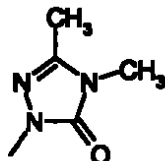
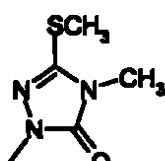
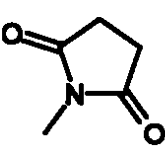
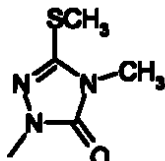
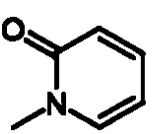
(IIA)

Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (II) bzw. (IIA)

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-9	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,25 ^{a)}
II-10	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,16 ^{a)}
II-11	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	CH ₃	logP = 1,48 ^{a)}
II-12	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,33 ^{a)}
II-13	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,92 ^{a)}
II-14	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,08 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-15	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,23 ^{a)}
II-16	CH ₂ CH ₂	(2) SCH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,13 ^{a)}
II-17	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,09 ^{a)}
II-18	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,27 ^{a)}
II-19	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	H	logP = 0,59 ^{a)}
II-20	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,72 ^{a)}
II-21	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H.	logP = 0,77 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-22	CH ₂ CH ₂	(2) SO ₂ CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,46 ^{a)}
II-23	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,49 ^{a)}
II-24	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,95 ^{a)}
II-25	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,83 ^{a)}
II-26	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,34 ^{a)}
II-27	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,27 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-28	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,37 ^{a)}
II-29	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,69 ^{a)}
II-30	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,13 ^{a)}
II-31	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,68 ^{a)}
II-32	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆), δ): 5,89 ppm (s, CH ₂)

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10

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.

15

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.

20

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

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 und 11 bei weitgehend guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Beispiel B

Post-emergence-Test

- 5 **Lösungsmittel:** 5 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 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.

- 15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5-15 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.

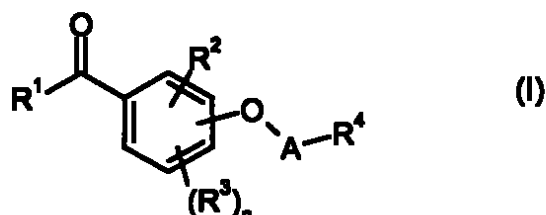
- 20 **Es bedeuten:**

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

- 25 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 und 13 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Substituierte Arylketone der allgemeinen Formel (I)

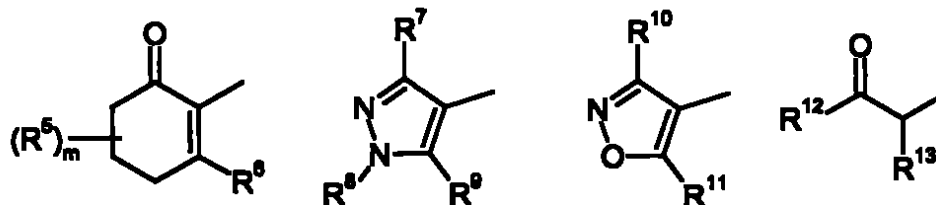


in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

A für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R¹ für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



wobei

m für die Zahlen 0 bis 6 steht,

R⁵ für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylthio oder Aryl steht, oder - für den Fall, daß m für 2 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R⁶ für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylcarbonyloxy,

Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Aryloxy, Arylthio, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy oder Arylalkylthio steht,

5

R⁷ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxycarbonyl oder Cycloalkyl steht,

10

R⁸ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

15

R⁹ für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy steht,

20

R¹⁰ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl oder Alkylthio steht,

25

R¹¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl steht,

R¹² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl steht, und

30

196

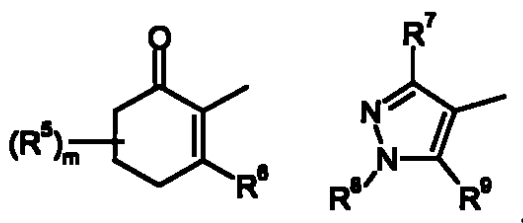
- R^{13} für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl steht,
- 5 R^2 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,
- 10 R^3 für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und
- 15 R^4 für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein oder zwei Sauerstoffatome oder ein oder zwei Schwefelatome, oder eine oder
- 20 zwei SO-Gruppierungen oder eine oder zwei SO₂-Gruppierungen) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,
- 25 - einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) - .
2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass
- 30 n für die Zahlen 0 oder 1 steht,

m für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

A für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

5

R¹ für eine der nachstehenden Gruppierungen steht,



10

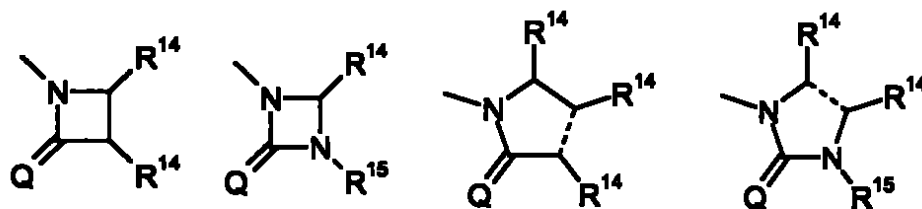
R² für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

15

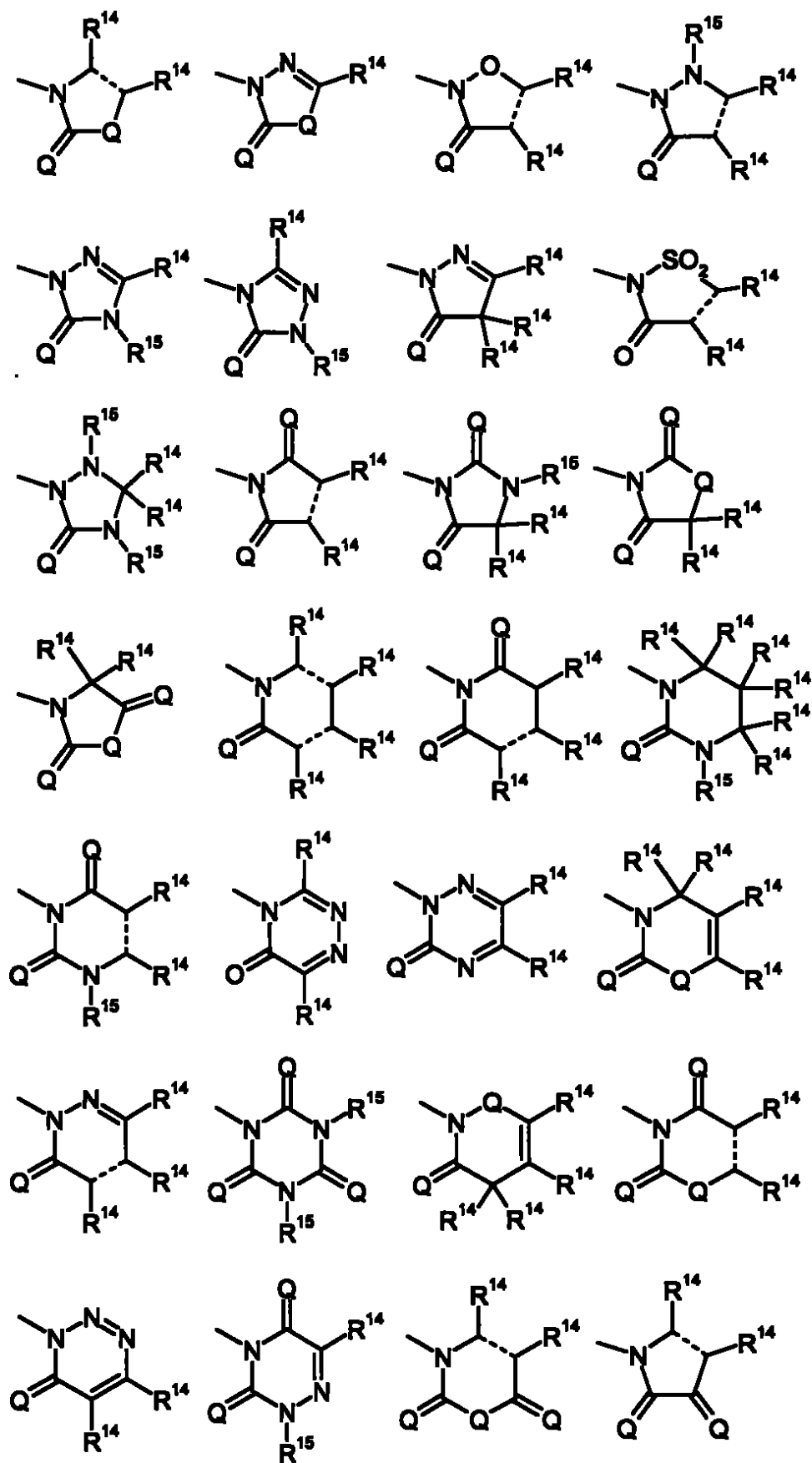
R³ für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

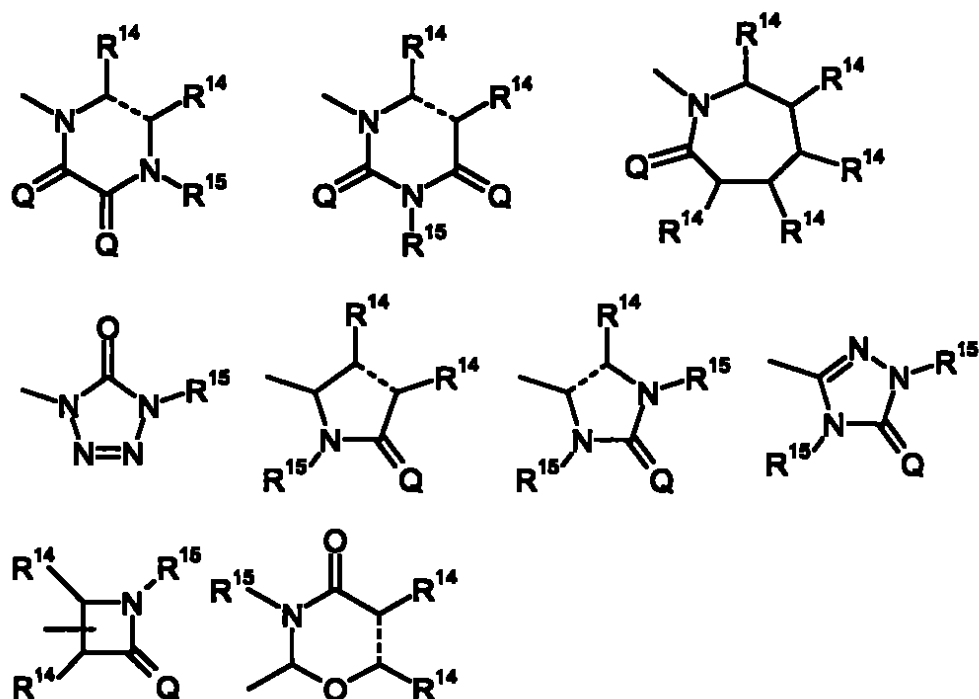
20

R⁴ für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht,



25





5 worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10 R^{14} für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkyl-

15

20

alkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder – für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R¹⁴ und R¹⁴ sich an einer Doppelbindung befinden – auch zusammen mit dem benachbarten Rest R¹⁴ für eine Benzogruppierung steht, und

10

R¹⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R¹⁴ oder R¹⁵ für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Alkandiyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

15

20

25

wobei die einzelnen Reste R¹⁴ und R¹⁵ – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können,

30

5 R^5 für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Alkandiy! (Alkylen) mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10 R^6 für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy substituiertes Aryloxy, Arylthio, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy, Arylalkylthio oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

20

25 R^7 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxy carbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

30 R^8 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoff-

- 5 atomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- 10 **R⁹** für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für
15 jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder
20 Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- 25 **R¹⁰** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,
- 30 **R¹¹** für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für

gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

5 R¹² für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10 R¹³ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht.

15 3. Verbindungen gemäß Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass

 A für Methylen, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Ethan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,2-diyl, Butan-1,3-diyl oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

20

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

 R² für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-

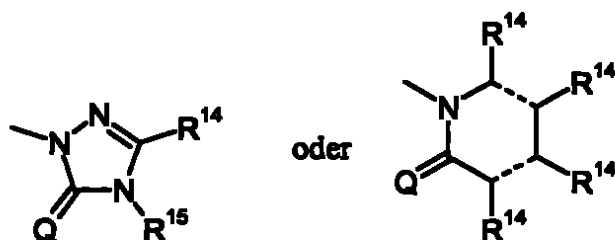
25

30

Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

R^3 für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

R^4 für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht,



R^5 für 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenen-

falls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

- 5 R^6 für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio oder Benzyl steht,
- 10
- 15
- 20
- 25 R^7 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, 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, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl
- 30

substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

5 **R⁸** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Tri-
10 fluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,
15

20 **R⁹** für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy steht,
25
30

- 5 **R¹⁰** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio steht,
- 10 **R¹¹** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
- 15 **R¹²** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
- 20 **R¹³** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl steht,
- 25 **R¹³**
- 30

- R¹⁴** für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylanino, Cyclobutylmethylanino, Cyclopentylmethylanino oder Cyclohexylmethylanino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte

Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung steht, und

- 5 R^{15} für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für
10 jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils
15 gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14} oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

20

wobei die einzelnen Reste R^{14} und R^{15} – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

- 25 4. Verbindungen gemäß Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass

A für Methylen oder Dimethylen steht,

m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

30

5 R^2 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

10 R^3 für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

15 R^4 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, für Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

20

25 R^6 für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls

30 durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluor-

methoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio oder Benzyl steht,

5 R^7 für Wasserstoff, Cyano, 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,

15 R^8 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

20 R^9 für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluor-

methoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy steht,

5

R¹⁰ für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio steht,

10

R¹¹ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl steht,

15

R¹² für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl steht,

20

R¹³ für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, 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 steht,

25

30

R¹⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylen-

- 5 sulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl, Propenyloxy, Propenylthio oder Propenylamino, für jeweils
- 10 gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropyloxy, Cyclopropylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy oder Cyclopropylmethylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-propoxy substituiertes Phenyl, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder
- 15 Benzylamino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung steht, und
- 20 R^{15} für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für Propenyl oder Propinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes
- 25 Cyclopropyl, Cyclobutyl oder Cyclopropylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14} oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes
- 30 Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

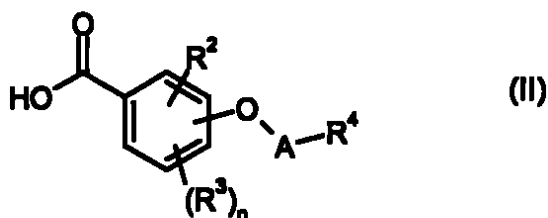
wobei die einzelnen Reste R^{14} und R^{15} - soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

5

5. Verfahren zum Herstellen von substituierten Arylketonen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass man

a) substituierte Benzoesäuren der allgemeinen Formel (II)

10



in welcher

n , A , R^2 , R^3 und R^4 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

15

- oder reaktionsfähige Derivate hiervon

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

20



in welcher

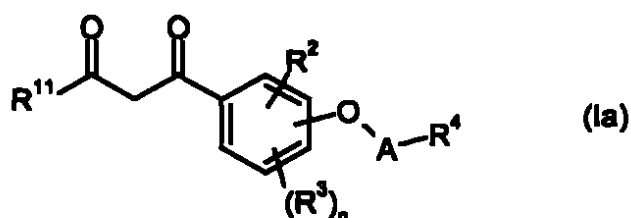
25

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

gegebenenfalls in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

5 oder dass man

(b) substituierte Benzoylketone der allgemeinen Formel (Ia)



10

in welcher

n , A , R^2 , R^3 , R^4 und R^{11} die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

15

mit einem Orthoameisensäureester oder mit einem N,N-Dimethyl-formamid-acetal oder mit einem Cyanoameisensäureester oder mit Carbondisulfid (Schwefelkohlenstoff) und einem Alkylierungsmittel, und anschliessend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

25

und gegebenenfalls im Anschluss an die Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) oder (b) an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise Substitutions-, Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt und/oder

219

TRADUCCION: Se traduce la carátula, la descripción y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Alemana No. 100 01 588.3 escrita en Alemán, para el invento denominado: **ARILCETONAS SUBSTITUIDAS**

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA
(emblema)

CERTIFICADO DE PRIORIDAD REFERENTE A LA PRESENTACION DE UNA SOLICITUD DE PATENTE

Expediente No. : 100 01 588.3 ✓
Fecha de presentación : 17 DE ENERO DE 2000 ✓
Nombre del Solicitante : BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
Leverkusen/Alemania
NIHON BAYER AGROCHEM K.K.
Tokio/Japón
Primer Solicitante: Bayer Aktiengesellschaft
Leverkusen/Alemania
Título del Invento : **ARILCETONAS SUBSTITUIDAS**
Clasificación : C07D, A01N

Las piezas anexas son una reproducción fiel y exacta de la documentación original de esta solicitud.

Munich, el día 8 de Noviembre de 2000
OFICINA ALEMANA DE PATENTES Y MARCA
El Presidente
Por Delegación

((firma ilegible))
Seiler

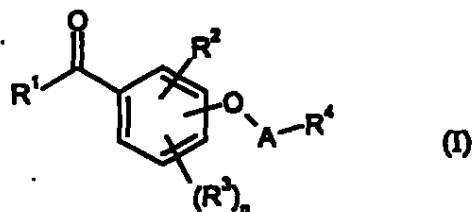
Cinta tricolor y Sello de Oblea

ARILCETONAS SUSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas arilcetonas sustituidas, a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se sabe ya que determinadas arilcetonas sustituidas tienen propiedades herbicidas (véanse las EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, EP-A-352543, EP-A-418175, EP-A-487357, EP-A-527036, EP-A-527037, EP-A-560483, EP-A-609797, EP-A-609798, EP-A-625505, EP-A-625508, EP-A-636622, US-A-5804532, US-A-5834402, US-A-5846906, US-A-5863865, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328). El efecto de estos compuestos sin embargo no es satisfactorio desde todos los puntos de vista.

Se han encontrado ahora las nuevas arilcetonas sustituidas de la fórmula general (I)

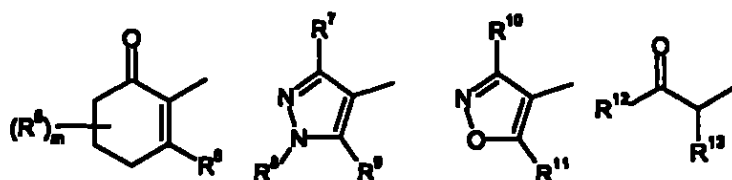


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquilenos),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

- m** significa los números 0 hasta 6,
- R⁵** significa halógeno o significa alquilo, alquiltio o arilo substituidos respectivamente en caso dado, o -en el caso en que m signifique 2- significa en caso dado también junto con un segundo resto R⁵ alcanodiilo (alquileno),
- R⁶** significa hidroxí, formiloxi, halógeno, o significa alcoxi, alquiltio, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi o arilalquiltio, substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁷** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcóxicarbonilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁸** significa hidrógeno o significa alquilo, alquénilo, alquínilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁹** significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹⁰** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo o alquiltio substituidos respectivamente en caso dado,

- R¹¹** significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹²** significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R¹³** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R⁴** significa un agrupamiento heterocíclico, monocíclico o bicíclico, saturado o insaturado, con 4 a 12 miembros, en caso dado substituido, que contiene de 1 a 4 heteroátomos (hasta 4 átomos de nitrógeno y en caso dado -alternativa o adicionalmente- 1 o 2 átomos de oxígeno y 1 o 2 átomos de azufre, o uno o dos agrupamientos SO- o uno o dos agrupamientos SO₂-), y que contiene además de uno hasta tres grupos oxo (C=O) y/o grupos tioxo (C=S) como componentes del heterociclo,

-con inclusión de todas las formas tautómeras posibles de los compuestos de la fórmula general (I) y de las sales o bien aductos con ácido o con bases posibles de los compuestos de la fórmula general (I)-.

En las definiciones las cadenas hidrocarbonadas, tales como alquilo o alcanodiilo -incluso en combinación con heteroátomos, como en el alcoxi- son

respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

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

Preferentemente,

n significa los números 0 o 1.

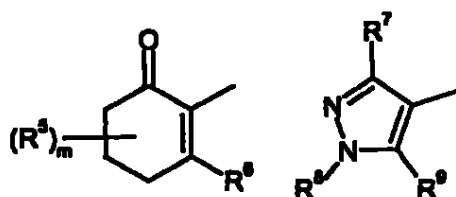
Preferentemente,

m significa los números 0, 1, 2, 3 o 4.

Preferentemente,

A significa alcanodiilo (alquileo) con 1 a 6 átomos de carbono,

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



Preferentemente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

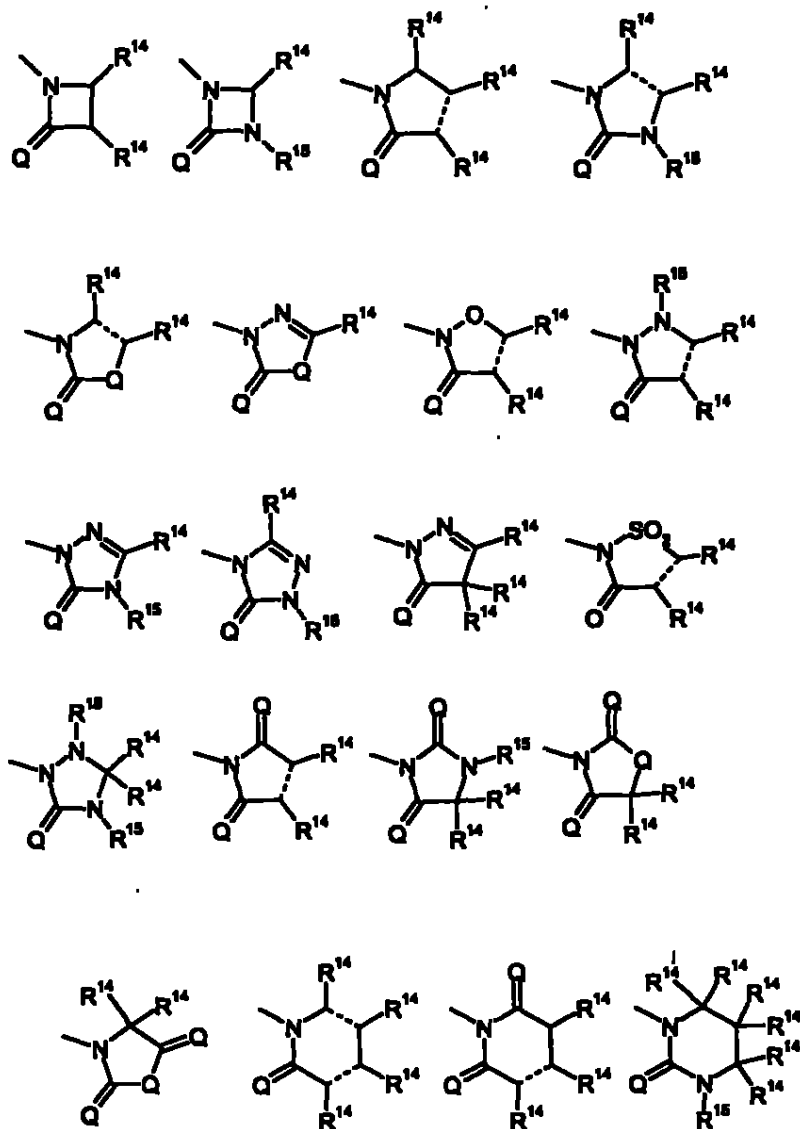
Preferentemente,

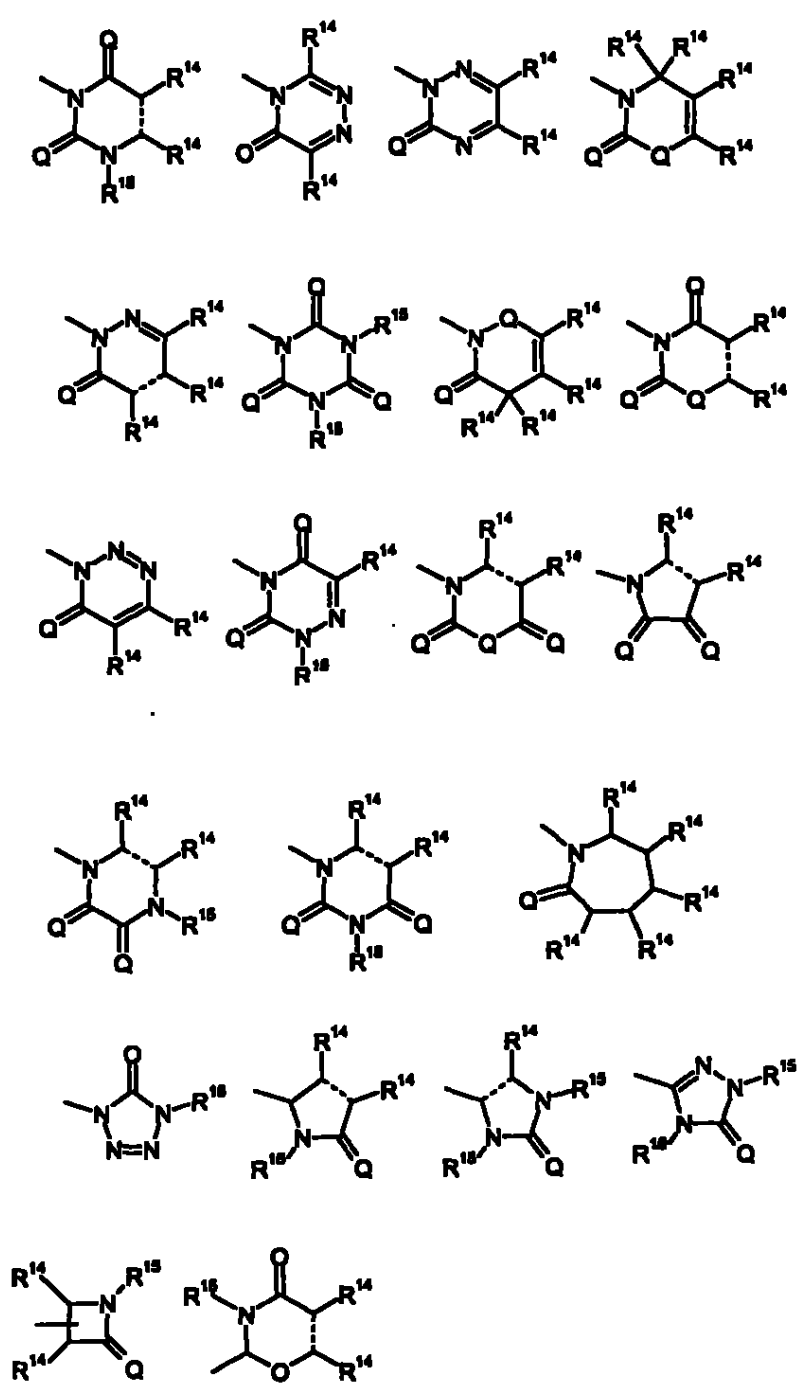
R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o

significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁴ significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes





siendo el enlace dibujado con trazos discontinuos respectivamente un enlace sencillo o un enlace doble,

Q significa oxígeno o azufre,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo,

substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilamino o dialquilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa alquenilo, alquinilo, alqueni-oxi, alqueniltio o alquenilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquiloxi, ciclo-alquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquil-alquiltio o cicloalquilalquil-amino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa también junto con el resto R^{14} contiguo un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxí, amino, alquilidenamino con hasta 4 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino o alcanoilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alquinilo o alqueni-oxi respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno,

significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa alcanodiilo con 3 hasta 5 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

Preferentemente,

R^5 significa halógeno, significa alquilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R^5 significa alcanodiilo (alquilen) con 2 hasta 6 átomos de carbono.

Preferentemente,

R^6 significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquiltio, alquilcarboniloxi, alcoxícarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos

respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcoxicarbonilo respectivamente con 1 hasta 6 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 significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en

caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respecti-vamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁹ significa hidroxi, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarbo-niloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamen-te con 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo , substituidos respectiva-mente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, o po alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹² significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 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.

De forma especialmente preferente,

A significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), etano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma especialmente preferente,

m significa los números 0, 1, 2 o 3.

De forma especialmente preferente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-

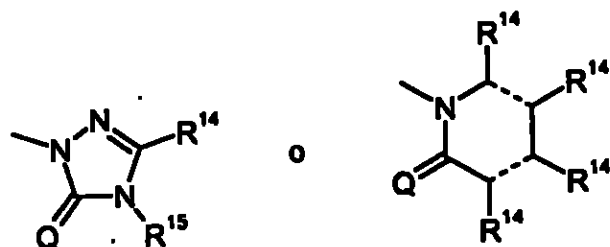
propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosulfo-nilo o dietilaminosulfonilo.

De forma especialmente preferente,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosul-fonilo o dietilaminosulfonilo.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes



De forma especialmente preferente,

- R⁵** significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo o por metoxi, o significa en caso dado también –en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R⁵ etano-1,2-diilo (dimetileno) propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma especialmente preferente,

- R⁶** significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenoxi, feniltio, benciloxi, bencilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s-

o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma especialmente preferente,

- R⁷** · significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etil-sulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo 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 bromo, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

- R⁸** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexil-metilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma especialmente preferente,

- R⁹** significa hidroxi, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s-

o t-butoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o t-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfonil-oxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtilo o por trifluórmtilo.

De forma especialmente preferente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamilo, tiocarbamilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolil, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, meto-xicarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma especialmente preferente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

235

De forma especialmente preferente,

- R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

- R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

- R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metil-sulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino o di-i-propilamino, significa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi,

buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropil-amino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclo-butilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclo-butilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencil-amino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o - en el caso en que los restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo.

De forma especialmente preferente,

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i- o s-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo o propeniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o

significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, p or etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} , significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

Pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} - en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico, significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

De forma muy especialmente preferente,

A significa metileno o dimetileno.

De forma muy especialmente preferente,

m significa los números 0, 1 o 2.

De forma muy especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmtilo, trifluórmtilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiomtilo, metilsulfinilmtilo, metilsulfonilmtilo, metoxi, etoxi, difluór-metoxi, trifluór-metoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsul-fonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

R^3 significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmtilo, trifluórmtilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiomtilo, metilsulfinilmtilo, metilsulfonilmtilo, metoxi, etoxi, difluór-metoxi, trifluór-metoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsul-fonilo o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

R^5 significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio

substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa fenilo, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R³ significa etano-1,2-diilo (dimetileno), propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma muy especialmente preferente,

R⁶ significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfo-niloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenoxi, feniltio, benzoiloxi, benzoilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmethyl, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmethyl o por trifluórmethyl.

De forma muy especialmente preferente,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R⁸ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o

239

por etoxi, significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmethyl, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmethyl o por trifluórmethyl.

De forma muy especialmente preferente,

R⁹ significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenil-sulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmethyl, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmethyl o por trifluórmethyl.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos

respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o 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 substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, 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, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, propenilo, propeniltio o propenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo,

241

ciclopropiloxi, ciclopropilamino, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi o ciclopropilmetiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencil-amino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo.

De forma muy especialmente preferente,

R^{14} significa hidrógeno, hidroxil, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo, significa ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopropilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

Pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} - en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico, significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

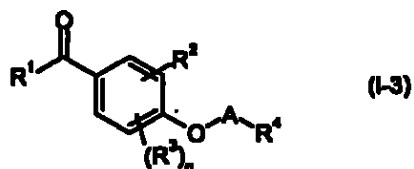
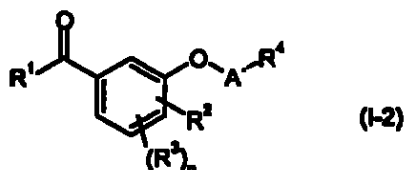
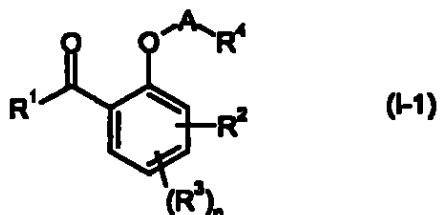
Según la invención son preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

Según la invención son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados

anteriormente de manera especialmente preferente.

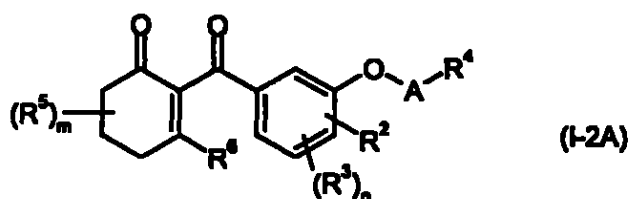
Según la invención son muy especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

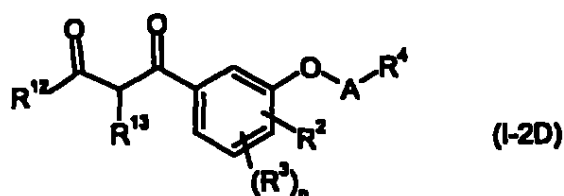
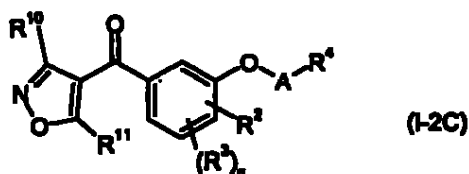
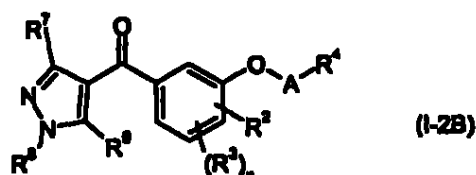
Se señalarán especialmente los compuestos de las fórmulas generales (I-1) hasta (I-3):



en este caso n, A, R¹, R², R³ y R⁴ tienen respectivamente los significados mas preferentes.

Se señalarán de forma muy especial los compuestos de las fórmulas generales (I-2A) hasta (I-2D):





en este caso m, n, A, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ tienen respectivamente el significado mas preferente.

El objeto de la invención son también las sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio de los compuestos de la fórmula (I), en la que preferentemente n, A, R¹, R², R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente como preferentes.

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 correspondientes productos de partida o productos intermedios necesarios para la obtención.

Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí,

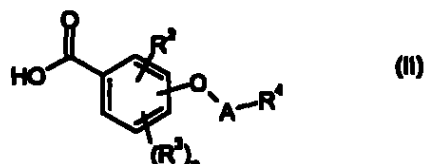
244

es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se caracterizan por una actividad herbicida potente y selectiva.

Se obtienen las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I), si

(a) Se hacen reaccionar ácidos benzoicos substituidos de la fórmula general (II)



en la que

n, A, R², R³ y R⁴ tienen el significado anteriormente indicado,

-o derivados reactivos de los mismos, tal como por ejemplo los correspondientes halogenuros de acilo, cianuros de acilo o ésteres-

con compuestos de la fórmula general (III)



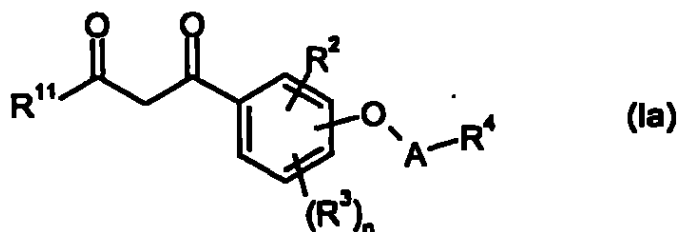
en la que

R¹ tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante, en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o si

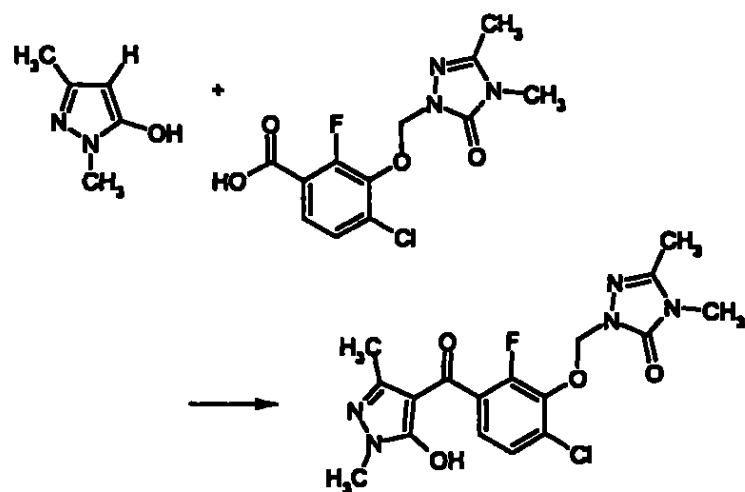
(b) se hacen reaccionar benzoilcetonas substituidas de la fórmula general (Ia)



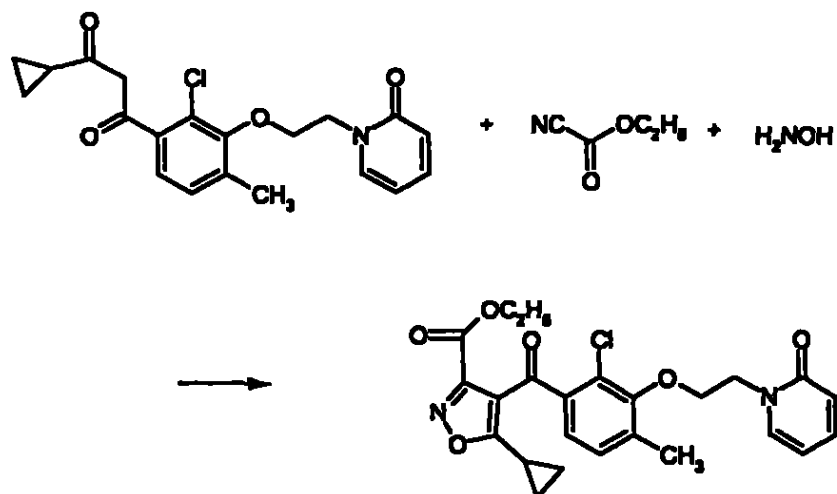
en la que

n , A, R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} tienen el significado anteriormente indicado, con un éster del ácido ortofórmico o con un N,N-dimetil-formamida-acetal o con un éster del ácido cianofórmico o con disulfuro de carbono (carburo de azufre) y con un agente de alquilación, y a continuación con hidroxilamina o con un aducto con ácido de la misma, en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes, y en caso dado después de la realización de los procedimientos según la invención (a) o (b) se llevan a cabo en los compuestos, así obtenidos, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los sustituyentes, de manera usual, reacciones de sustitución, de oxidación o de reducción y/o los compuestos de la fórmula general (I) se transforman de manera usual en los compuestos de tipo salino.

Si se emplean, por ejemplo, el ácido 4-cloro-3-[(3,4-dimetil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-metoxi]-2-flúor-benzoico y 1,3-dimetil-5-hidroxipirazol como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Si se emplean, por ejemplo, la 1-[2-cloro-4-metil-3-[2-(2-oxo-1(2H)-piridinil)-etoxi]-fenil]-3-ciclopropil-1,3-propanodiona, cianoformiato de etilo e hidroxilamina como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:

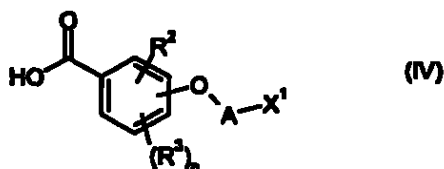


Los ácidos benzoicos substituidos a ser empleados como productos de partida en el procedimiento (a) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), n, A, R¹, R³ y R⁴ tienen preferentemente

aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para n, A, R², R³ y R⁴ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

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 los nuevos ácidos benzoicos substituidos -o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo- si (α) se hacen reaccionar los correspondientes ácidos halogenoalcoxibenzoicos de la fórmula (IV)



en la que

n, A, R² y R³ tienen el significado anteriormente indicado y

X¹ significa halógeno (especialmente significa flúor, cloro o bromo) o significa alquilsulfoniloxi (especialmente metilsulfoniloxi o etilsulfoniloxi),

-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con compuestos heterocíclicos de la fórmula general (V)



en la que

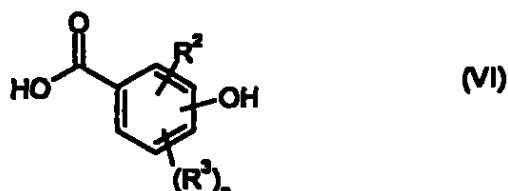
R⁴ tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, tal como por ejemplo carbonato de potasio, y, en caso dado, en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo

acetona, butanona, acetonitrilo, N,N-dimetil-formamida o dimetilsulfóxido, a temperaturas comprendidas entre 10°C y 150°C y, en caso dado, a continuación se llevan a cabo otras reacciones de transformación en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual (véanse los ejemplos de obtención),

o si

(β) se hacen reaccionar los correspondientes ácidos hidroxibenzoicos de la fórmula (VI)



en la que

n, R² y R³ tienen el significado anteriormente indicado,

-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con hidroxialquilheterociclos de la fórmula general (VII)



en la que

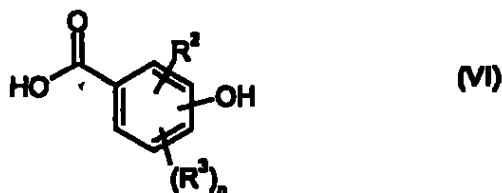
A y R⁴ tienen el significado anteriormente indicado,

en presencia de agentes auxiliares de la condensación, tales como por ejemplo azodicarboxilato de dietilo y trifenilfosfina, en caso dado en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo tetrahidrofurano, a temperaturas comprendidas entre -20°C y +50°C y, en caso dado, a continuación se llevan a cabo, en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual, otras reacciones de transformación (véanse los ejemplos de obtención),

o si

249 250

(γ) se hacen reaccionar los correspondientes ácidos hidroxibenzoicos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado anteriormente indicado,

o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con halógenoalquilheterociclos de la fórmula general (VIII)



en la que

A y R^4 tienen el significado anteriormente indicado y

X^2 significa halógeno (especialmente significa flúor, cloro o bromo), significa alquilsulfonilo (especialmente metilsulfonilo o etilsulfonilo), o significa arilsulfonilo (especialmente p-tolilsulfonilo),

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, tal como por ejemplo carbonato de potasio o trietilamina y, en caso dado, en presencia de un diluyente tal como por ejemplo acetona, butanona, acetonitrilo, N,N-dimetil-formamida o dimetilsulfóxido, a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de transformación en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual (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 sustancias, 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-anales.

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 según la invención pueden emplearse también en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación para la lucha contra las plagas animales y contra las enfermedades fúngicas o bacterianas de las plantas. Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales

como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimientos con una o varias capas.

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 clorobenzenos, 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, metilisobutylcetona, o ciclohexa-nona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsul-fóxido, 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 polioxietilenados de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixivitaciones sulfúricas 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 arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfo-lípidos 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 ferrocianico 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 y/o con productos que mejoren la compatibilidad para con las plantas de cultivo ("protectores") conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque. También son posibles con agentes para combatir las malas hierbas, que contengan uno o varios herbicidas conocidos y un protector.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo: Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid(-sodio), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, BAS-622H, Bflubutamid, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil(alilo), Butoxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron,

255

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, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclorprop(-P), 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, -metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone(-sodio), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrasulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-butoxipropilo, -neptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen, Haloxyfop(-etoxietilo, -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, Mecoprop., 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, Picolinafen, Piperophos,

Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Profluazol, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Procarbazon(-sodio), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-etilo), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo, -P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron(-metilo), Tritosulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias 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. Fundamentalmente dependen del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se

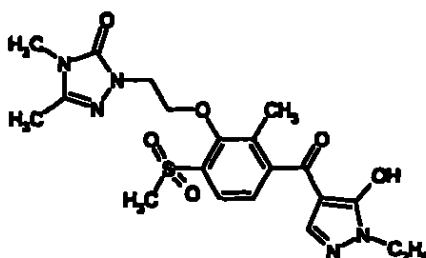
25*

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 sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



(Procedimiento (a)).

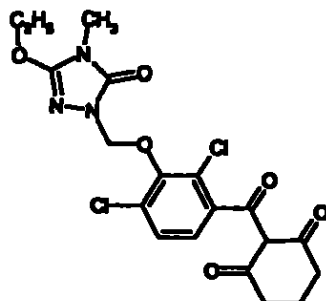
Se añaden a una solución de 1,1 g (2,7 mmoles) de cloruro de 3-[2-(3',4'-dimetil-1'.2',4'-1H-triazolin-5-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoilo en 20 ml de diclorometano, sucesivamente, 0,30 g (2,7 mmoles) de 1-etil-5-hidroxi-pirazol, 0,8 g (8,0 mmoles) de trietilamina y una gota de N,N-dimetil-formamida. Se agita la mezcla aproximadamente durante 24 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C), la solución de la reacción se lava sucesivamente con ácido clorhídrico 1N y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 30 ml de acetonitrilo y se combina, sucesivamente, bajo ligera refrigeración, con 0,28 g (3,3 mmoles) de 2-hidroxi-2-metil-propionitrilo y 1,4 g (14 mmoles) de trietilamina. Se agita durante otras 24 horas a temperatura ambiente, se elimina la parte principal del disolvente al vacío de la trompa de agua y el residuo se disuelve en diclorometano y ácido clorhídrico 1N. La fase orgánica se separa, se lava con agua y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

256 88

Se obtienen 1,1 g (88 % de la teoría) del 4-{3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etiloxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoil}-1-etil-5-hidroxi-1H-pirazol en forma de residuo oleaginoso.

Log P: 1,23.

Ejemplo 2.



(Procedimiento (a)).

Se disuelven 1,95 g (5,4 mmoles) del ácido 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoico en 75 ml de acetonitrilo y se combinan con 0,61 g de 1,3-ciclohexanodiona (5,4 mmoles) así como con 1,33 g de diciclohexilcarbodiimida (DCC, 1,2 equivalentes). Al cabo de 15 minutos de agitación a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) se añaden 1,5 ml de trietil-amina (2 equivalentes) y 0,29 ml de cianuro de trimetilsililo (0,4 equivalentes). Al cabo de 2 horas a temperatura ambiente se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua, el residuo se agita con solución acuosa al 10 % de carbonato de sodio y se separa por filtración. El filtrado se sacude con dietiléter y la fase acuosa se acidifica con ácido clorhídrico 2N. El producto precipitado se extrae varias veces con diclorometano, las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y se concentran por evaporación.

Se obtienen 1,3 g (53 % de la teoría) de la 2-[3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona en forma de resina viscosa.

Log P = 2.52.

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2 así como de acuerdo con la descripción general de los procedimientos de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

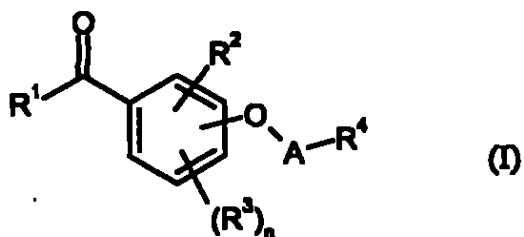
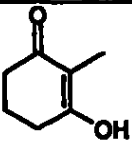
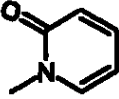
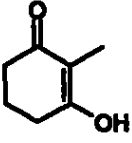
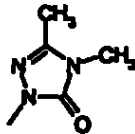
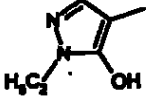
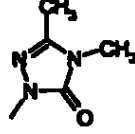
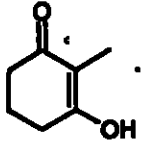
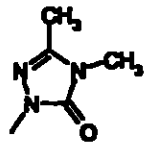
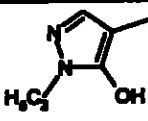
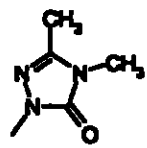
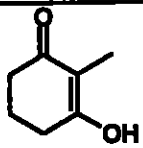
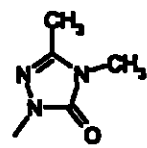
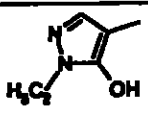
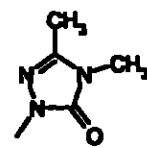
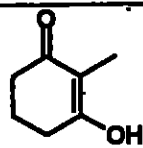
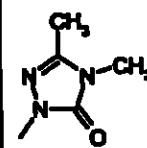
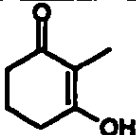
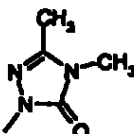
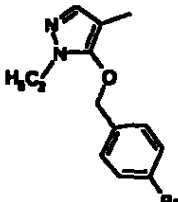
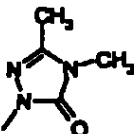
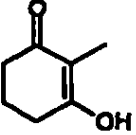
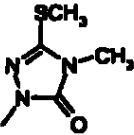
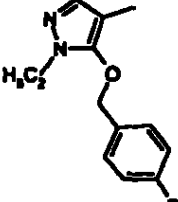
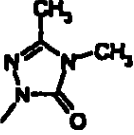


Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I)

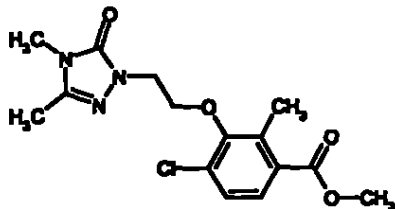
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
3	CH ₃		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ⁿ⁾
4	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ⁿ⁾
5	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,52 ⁿ⁾

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
6	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
7	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,68 ^{a)}
8	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,94 ^{a)}
9	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,58 ^{a)}
10	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,91 ^{a)}

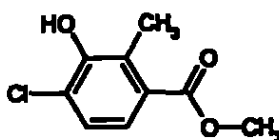
Ej. nº	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
11	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	logP = 1,65 ^{a)}
12	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,07 ^{a)}
13	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,44 ^{a)}
14	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}

Productos de partida de la fórmula (II):

Ejemplo (II-1).



Primera etapa.



Se hace pasar a través de una solución a ebullición de 100 g (0,6 moles) de 3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo y 0,4 ml de diisopropilamina, en 800 ml de 1,2-dicloro-etano, en el transcurso de 4 hasta 6 horas, 43 g (0,606 moles) de cloro gaseoso. Tras la refrigeración se lava la solución sucesivamente con, respectivamente, 200 ml de solución al 5 % de bisulfito de sodio y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca la fase orgánica sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente al vacío de la trompa de agua. El aceite de color pardo oscuro, obtenido como residuo, se combina con 30 ml de dietiléter y se refrigera a 0° hasta 4°C para la cristalización. Los cristales precipitados se aíslan mediante filtración por succión, se lavan con un poco de dietiléter frío y se secan en vacío a 30°C.

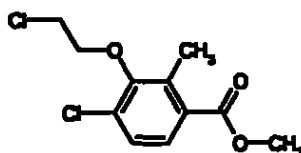
Se obtienen 46,6 g (39 % de la teoría) del 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo.

Log P: 2,14.

Si en lugar del 3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo se emplea el correspondiente éster de etilo, se obtendrá, según el mismo procedimiento, el 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de etilo.

Punto de fusión: 51°C.

Segunda etapa.



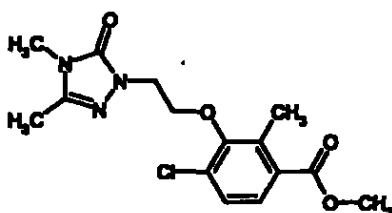
Se añaden a una solución de 25 g (0,125 moles) de 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo, en 400 ml de acetonitrilo, sucesivamente, 34,2 g (0,248

moles) de carbonato de potasio anhidro en forma de polvo y 29,3 g (0,125 moles) de p-toluenosulfonato de 2-cloro-etanol. Se calienta aproximadamente durante 7 horas a 70°C, se deja refrigerar la mezcla de la reacción y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 200 ml de diclorometano y 300 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 32,5 g (99 % de la teoría) del 4-cloro-3-(2-cloro-etoxi)-2-metilbenzoato de metilo en forma de aceite oscuro.

Log P = 3,52.

Tercera etapa.

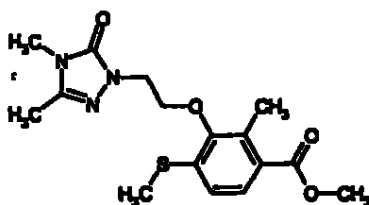


Se añaden a una solución de 16,0 g (60,8 mmoles) de 4-cloro-3-(2-cloro-etoxi)-2-metilbenzoato de metilo en 70 ml de dimetilsulfóxido, sucesivamente, 18,4 g (0,133 moles) de carbonato de potasio anhidro en forma de polvo y 6,9 g (60,8 mmoles) de 3,4-dimetil-1,2,4-triazolin-5-ona. Se calienta aproximadamente durante 6 horas a 90°C, se deja refrigerar la mezcla de la reacción y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 140 ml de diclorometano y 60 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua. El residuo oleaginoso se agita con 25 ml de éter de petróleo. El producto cristalino precipitado en este caso se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 18,5 g (80 % de la teoría) del 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metilbenzoato de metilo.

Log P: 1,94.

Ejemplo (II-2).

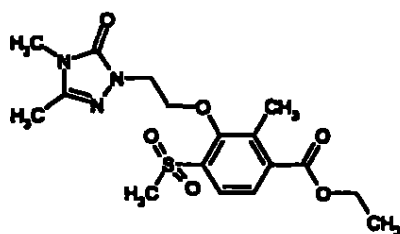


Se añaden a una solución de 12,4 g (36,5 mmoles) de 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo, en 100 ml de N,N-dimetil-formamida, bajo refrigeración con hielo, 3,3 g (44,5 mmoles) de metilmercáptido de sodio. Se agita durante aproximadamente 6 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 300 ml de acetato de etilo y 200 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 5,4 g (42 % de la teoría) del 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metiltio-benzoato de metilo.

Log P $\approx$ 1,89.

Ejemplo (II-3).



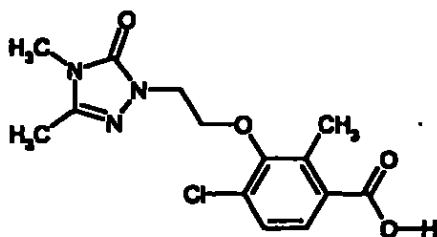
Se añaden a una solución de 12,3 g (33,7 mmoles) de 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metiltio-benzoato de etilo en 40 ml de ácido acético, 10 mg de tetrahidrato de molibdato de amonio y 17,3 g (178

mmoles) de solución acuosa al 35 % de peróxido de hidrógeno. La mezcla de la reacción se calienta durante aproximadamente 6 horas a 50°C hasta 60°C, se diluye con agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa, se lava sucesivamente con agua, con solución de bicarbonato de sodio, con solución de tiosulfato de sodio y nuevamente con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 12,3 g (92 % de la teoría) del 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoato de etilo.

Log P = 1,76.

Ejemplo (II-4).



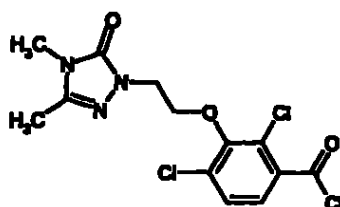
Se añaden a una solución de 6,5 g (19,0 mmoles) de 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazol-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo en 40 ml de etanol, 1,2 g (30 mmoles) de una solución de hidróxido de sodio en 20 ml de agua. La solución se agita durante aproximadamente 24 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C), y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en agua y se acidifica con ácido clorhídrico. La suspensión formada se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se separa, se lava con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra.

El disolvente se elimina cuidadosamente el filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 5,9 g (95 % de la teoría) del ácido 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoico.

Log P = 1,37.

Ejemplo (II-5).

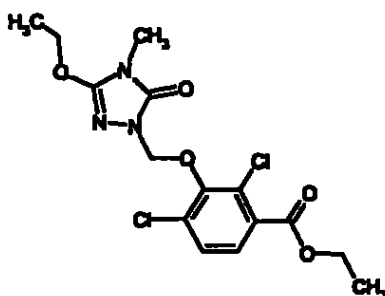


Se calientan 2,3 g (6,65 mmoles) del ácido 2,4-dicloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-benzoico, en 10 ml de cloruro de tionilo aproximadamente durante 1,5 horas a 70°C. Se deja refrigerar la solución de la reacción y se elimina el cloruro de tionilo en exceso bajo presión reducida.

Se obtienen 2,4 g (100 % de la teoría) del cloruro de 2,4-dicloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-benzoilo.

Log P = 1,24.

Ejemplo (II-6).



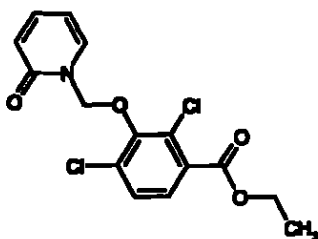
Se disuelven 5 g (21,3 mmoles) del 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo en 200 ml de tetrahidrofurano y se combinan con 3,68 g (21,3 mmoles) de 1-hidroxi-metil-3-etoxi-4-metil-1,2,4-triazolin-5-ona. Tras adición de 5,58 g (21,3 mmoles) de trifenilfosfina se añaden, gota a gota, a 0°C, 4,4 g de diazodicarboxilato de dietilo al 85 %. La solución resultante se agita durante la noche,

se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y se filtra a través de gel de sílice (acetato de etilo/hexano). El filtrado se concentra por evaporación y se combina con dietiléter. El producto sólido que se separa se recoge por filtración y el disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 6,8 g (82 % de la teoría) del 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoato de etilo en forma de aceite viscoso.

Log P = 2.77.

Ejemplo (II-7).

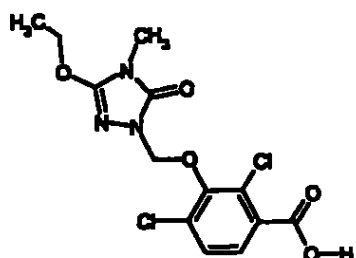


Se disuelven 2 g (8,5 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo en 30 ml de acetonitrilo y se combinan sucesivamente con 0,86 g (8,5 mmoles) de trietilamina y 1,2 g (8,5 mmoles) de N-clorometil-2-piridona. La mezcla resultante se agita durante 7 horas a 60°C, se combina con agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa, se lava con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina por destilación cuidadosamente bajo presión reducida.

Se obtienen 2,4 g (82 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-(1H-pirid-2-on-1-il)-metoxi-benzoato de etilo.

Ejemplo (II-8).

269



Se agitan 6,4 g (16,3 mmoles) del 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoato de etilo en una mezcla constituida por 250 ml de ciclohexano y 25 ml de etilenglicol-monometiléter en presencia de 0,91 g de hidróxido de potasio en polvo durante 15 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C). Se diluye con agua y se acidifica con ácido clorhídrico 2N. El producto sólido precipitado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 4,05 g (69 % de la teoría) del ácido 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoico.

log P: 1,74.

De manera análoga a la de los ejemplos (II-1) hasta (II-8) pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (II) o los derivados reactivos de los mismos -véase la fórmula (IIa)-, indicados en la tabla 2 siguiente,

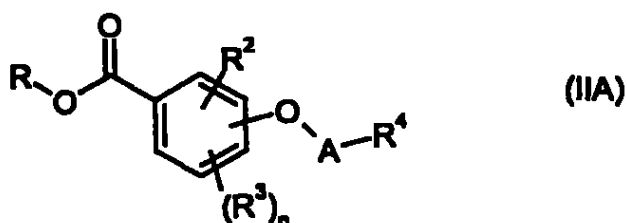
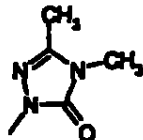
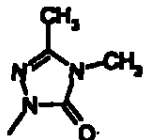
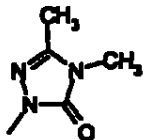
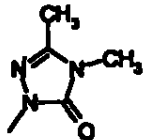
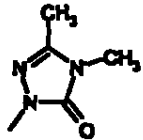
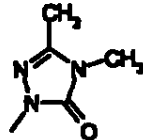
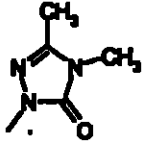
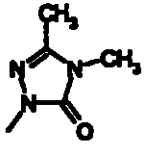
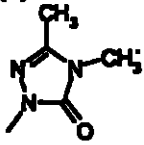
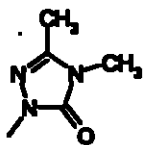
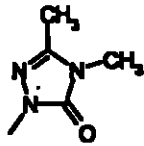
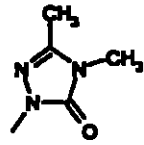
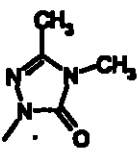
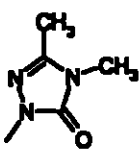
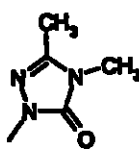
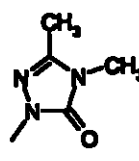
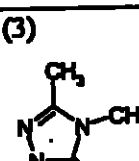
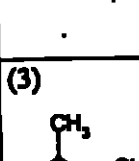


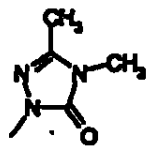
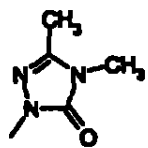
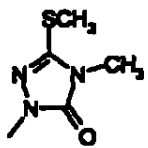
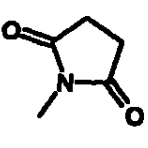
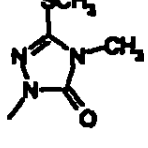
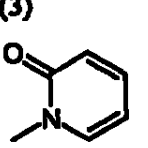
Tabla 2: Ejemplos de compuestos de la fórmula (II) o bien (IIA).

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-9	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,25 ^{a)}
II-10	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,16 ^{a)}
II-11	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	CH ₃	logP = 1,48 ^{a)}
II-12	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,33 ^{a)}
II-13	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,92 ^{a)}
II-14	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,08 ^{a)}

271

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-15	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,23 ^{a)}
II-16	CH ₂ CH ₂	(2) SCH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,13 ^{a)}
II-17	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,09 ^{a)}
II-18	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,27 ^{a)}
II-19	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	H	logP = 0,59 ^{a)}
II-20	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,72 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-21	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,77 ^{a)}
II-22	CH ₂ CH ₂	(2) SO ₂ CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,46 ^{a)}
II-23	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,49 ^{a)}
II-24	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,95 ^{a)}
II-25	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,83 ^{a)}
II-26	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,34 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-27	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,27 ^{a)}
II-28	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,37 ^{a)}
II-29	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,69 ^{a)}
II-30	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,13 ^{a)}
II-31	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,68 ^{a)}
II-32	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆), δ): 5,89 ppm (s, CH ₂)

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 semillas de las plantas de ensayo en terreno normal. 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 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 y 11 con una compatibilidad ampliamente buena frente a 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.

Se pulverizan plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm 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:

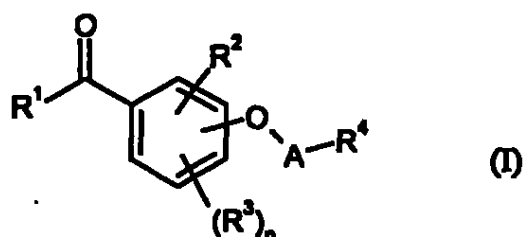
0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 y 13, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

REIVINDICACIONES

1.- Arilcetonas substituidas de la fórmula general (I)

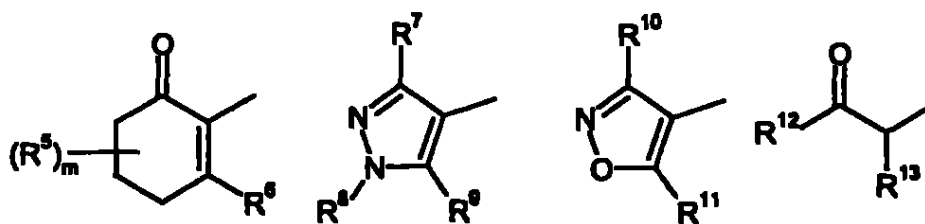


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileo),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m significa los números 0 hasta 6,

R⁵ significa halógeno o significa alquilo, alquiltio o arilo substituidos respectiva-mente en caso dado, o -en el caso en que m signifique 2- significa en caso dado también junto con un segundo resto R⁵ alcanodiilo (alquileo),

R⁶ significa hidroxí, formiloxi, halógeno, o significa alcoxi, alquiltio,

277

alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi o arilalquiltio, substituidos respectivamente en caso dado,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxicarbonilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁸ significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcovicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcovicarbonilo o alquiltio substituidos respectivamente en caso dado,

R¹¹ significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R¹² significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcovicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, haló-

geno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R⁴ significa un agrupamiento heterocíclico, monocíclico o bicíclico, saturado o insaturado, con 4 a 12 miembros, en caso dado substituido, que contiene de 1 a 4 heteroátomos (hasta 4 átomos de nitrógeno y en caso dado -alternativa o adicionalmente- 1 o 2 átomos de oxígeno y 1 o 2 átomos de azufre, o uno o dos agrupamientos SO- o uno o dos agrupamientos SO₂-), y que contiene además de uno hasta tres grupos oxo (C=O) y/o grupos tioxo (C=S) como componentes del heterociclo,

-con inclusión de todas las formas tautómeras posibles de los compuestos de la fórmula general (I) y de las sales o bien aductos con ácido o con bases posibles de los compuestos de la fórmula general (I)-.

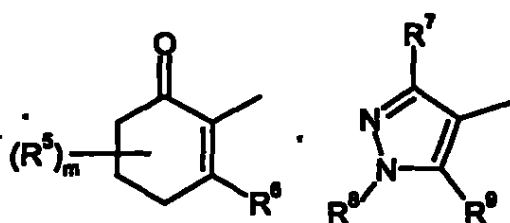
2.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0 o 1,

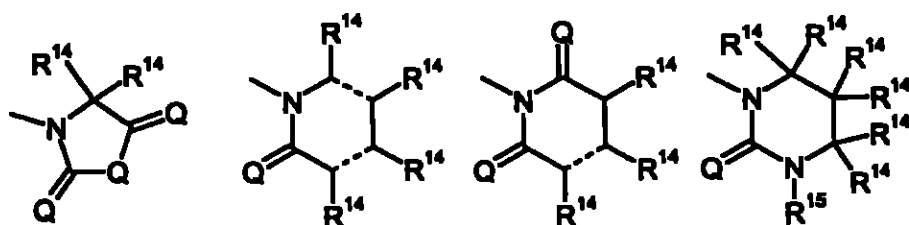
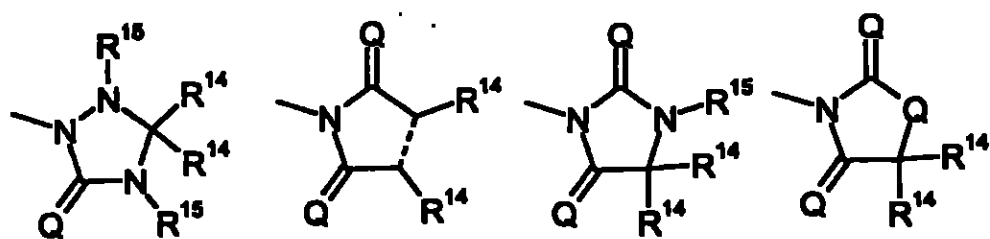
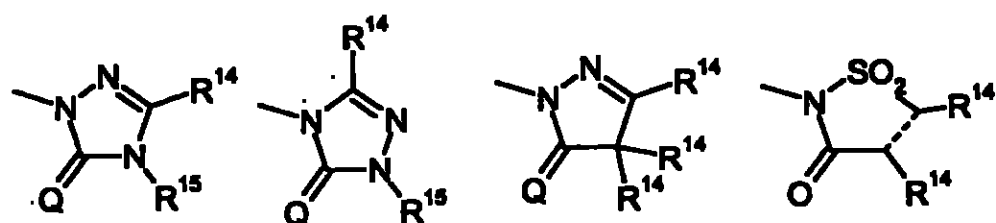
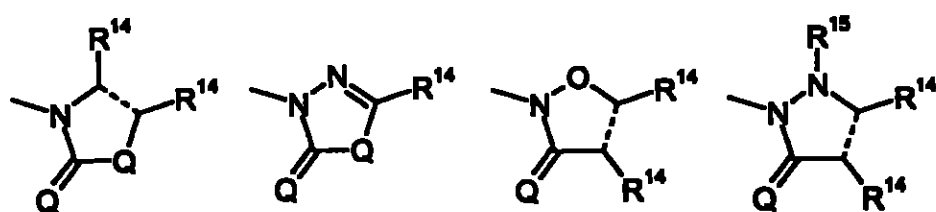
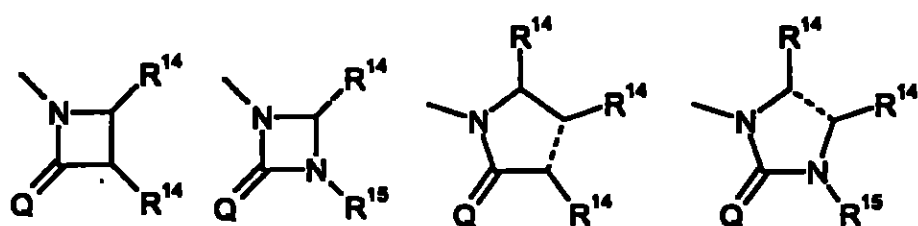
m significa los números 0, 1, 2, 3 o 4,

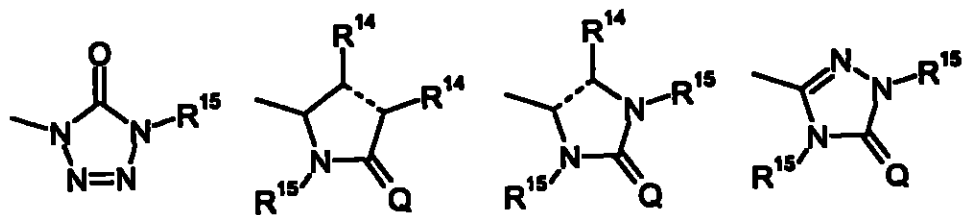
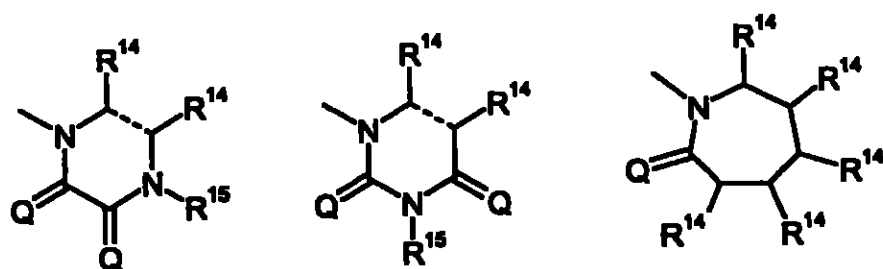
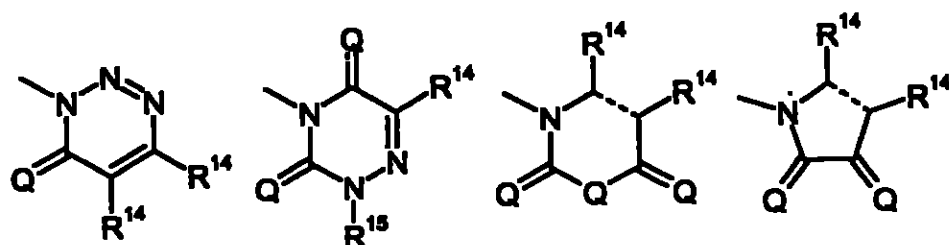
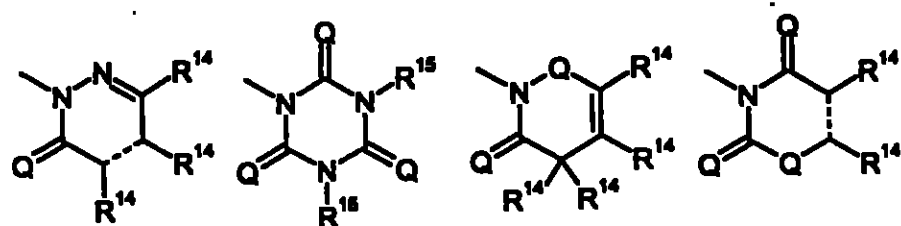
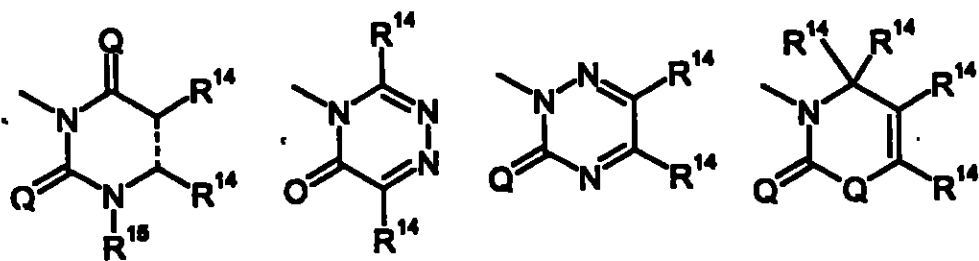
A significa alcanodiilo (alquilenos) con 1 a 6 átomos de carbono,

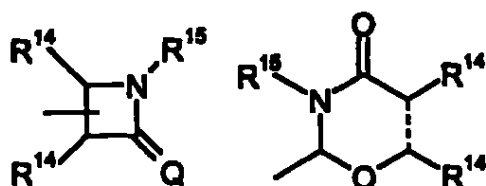
R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



- R¹** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R²** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R⁴** significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes







siendo el enlace dibujado con trazos discontinuos respectivamente un enlace sencillo o un enlace doble,

Q significa oxígeno o azufre,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilamino o dialquilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino

substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa también junto con el resto R^{14} contiguo un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxí, amino, alquilidenamino con hasta 4 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino o alcanoilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alquinilo o alqueniloxi respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa alcanodiilo con 3 hasta 5 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior,

R^5 significa halógeno, significa alquilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta

284

6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R⁵ significa alcanodiilo (alquilen) con 2 hasta 6 átomos de carbono,

R⁶ significa hidroxi, formiloxi, o significa alcoxi, alquiltio, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniiloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcoxicarbonilo respectivamente con 1 hasta 6 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 significa cicloalquilo con 3 hasta 6

átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono,

R⁸ . significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos

arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta 6 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,

R¹¹ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹² significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 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.

287

3.- Compuestos de la fórmula (I) según las reivindicaciones 1 o 2, caracterizados porque

m significa los números 0, 1, 2 o 3,

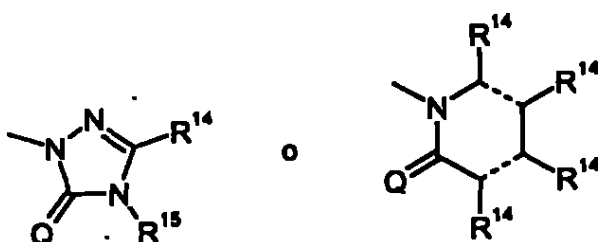
A significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), etano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo o butano-1,4-diilo (tetrametileno),

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilamino-sulfonilo o dietilaminosulfonilo,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propil-sulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilamino-sulfonilo o dietilaminosulfonilo,

R⁴ significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes



R⁵ significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo o por metoxi, o significa en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R⁵ etano-1,2-diilo (dimetileno) propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno),

R⁶ significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi, buteniloxi,

289

288

propiniloxi o butiniloxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenoxi, feniltio, benciloxi, bencilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R⁸ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexil-metilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por

- flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmethyl, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmethyl o por trifluórmethyl,
- R⁹ significa hidroxil, formiloxil, significa metoxil, etoxil, n- o i-propoxil, n-, i-, s- o t-butoxi, acetiloxil, propioniloxil, n- o t-butirolil, metoxycarboniloxil, etoxi-carboniloxil, n- o i-propoxycarboniloxil, metilaminocarboniloxil, etilaminocar-boniloxil, n- o i-propilaminocarboniloxil, metilsulfoniloxil, etilsulfoniloxil, n- o i-propilsulfoniloxil substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, por metoxil, por etoxil, por n- o i-propoxil, significa propeniloxil, buteniloxil, propiniloxil o butiniloxil substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxil, benzoiloxil, benzoilmethyl o fenilsulfoniloxil substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmethyl, por metoxil, por etoxil, por n- o i-propoxil, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmethyl o por trifluórmethyl,
- R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamilo, tiocarbamilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxil, etoxil, n- o i-propoxil, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxil, por etoxil, por n- o i-propoxil,
- R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo

substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etil-sulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metil-sulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, significa

metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino o di-i-propilamino, significa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclo-hexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopro-pilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropil-metilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropil-metoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilme-tiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilme-tilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que los restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i- o s-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo

o propeniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R¹⁴ o R¹⁵ significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo

pudiendo tener los restos individuales R¹⁴ y R¹⁵ -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

4.- Compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizados porque

m significa los números 0, 1 o 2,

A significa metileno o dimetileno,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmtilo, trifluórmtilo, dicloromtilo, tricloromtilo, metoximtilo, metiltiomtilo, metilsulfinimtilo, metilsulfonimtilo, metoxi, etoxi, difluór-metoxi, trifluórmetoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsul-fonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo,

R³ significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmtilo, trifluórmtilo, dicloromtilo, tricloromtilo, metoximtilo, metiltiomtilo, metilsulfinimtilo, metilsulfonimtilo, metoxi, etoxi,

difluórmetoxi, trifluór-metoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfo-nilo o dimetilaminosulfonilo,

R⁵ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa fenilo, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto **R⁵** significa etano-1,2-diilo (dimetileno), propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno),

R⁶ significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfo-niloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenoxi, feniltio, benzoiloxi, benzoilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitró, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmetoxi o por trifluórmetoxi,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metil-sulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

- R⁸** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa ciclopropilo substituído en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,
- R⁹** significa hidróxi, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluór-metoxi o por trifluórmétoxi,
- R¹⁰** significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

- R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,
- R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,
- R¹³ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o 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 substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,
- R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, 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, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, propeniloxi, propeniltio o propenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo,

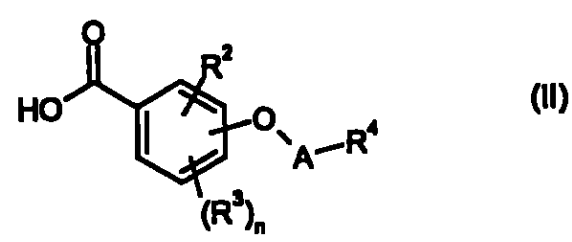
ciclopropiloxi, ciclopropilamino, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi o ciclopropilmetiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxí, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo, significa ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopropilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

5.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque

(a) se hacen reaccionar ácidos benzoicos substituidos de la fórmula general (II)



en la que

n, A, R², R³ y R⁴ tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4,

-o derivados reactivos de los mismos, tal como por ejemplo los correspondientes halogenuros de acilo, cianuros de acilo o ésteres-
con compuestos de la fórmula general (III)

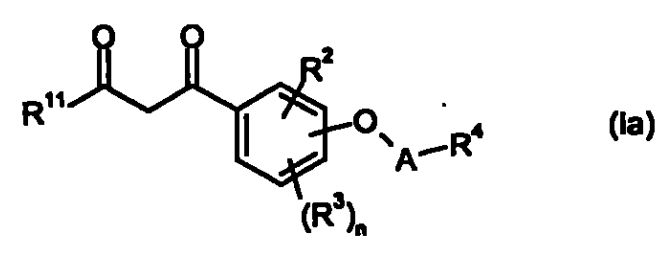


en la que

R¹ tiene el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4,
en caso dado en presencia de un agente deshidratante, en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque

(b) se hacen reaccionar benzoilcetonas substituidas de la fórmula general (Ia)



en la que

n, A, R², R³, R⁴ y R¹¹ tienen el significado indicado en las reivindicaciones 1

299

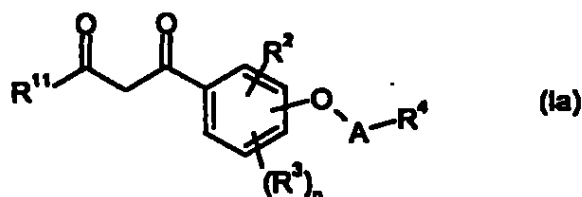
a 4,

con un éster del ácido ortofórmico o con un N,N-dimetil-formamida-acetal o con un éster del ácido cianofórmico o con disulfuro de carbono (carburo de azufre) y con un agente de alquilación, y a continuación con hidroxilamina o con un aducto con ácido de la misma,

en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y en caso dado después de la realización de los procedimientos según la invención (a) o (b) se llevan a cabo en los compuestos, así obtenidos, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual, reacciones de substitución, de oxidación o de reducción y/o los compuestos de la fórmula general (I) se transforman de manera usual en los compuestos de tipo salino.

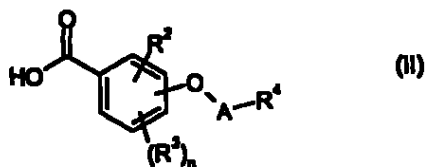
6.- Benzoilcetonas substituidias de la fórmula (Ia)



en la que

n, A, R², R³, R⁴ y R¹¹ tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4.

7.- Acidos benzoicos substituidos de la fórmula (II)



en la que

n, A, R², R³ y R⁴ tienen el significado indicado en 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.- Procedimiento para la lucha contra las plantas indeseables, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

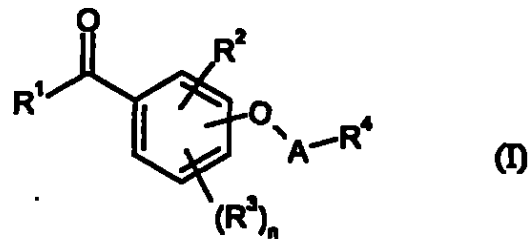
10.- Agente, caracterizado porque tiene un contenido en al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

301

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general

(I)

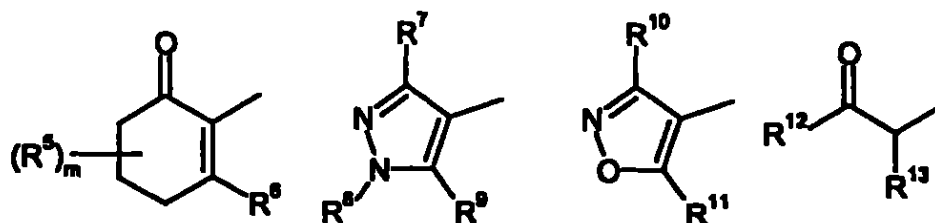


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileno),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m, R²-¹³, tienen uno de los significados indicados en la descripción,

así como a procedimientos para su obtención, a productos intermedios y al empleo de estos compuestos como herbicidas.



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

Aktenzeichen: 100 39 723.9 /

Anmeldetag: 14. August 2000 ✓

Anmelder/Inhaber: Bayer AG, Leverkusen/DE;
Nihon Bayer Agrochem K.K., Tokio/JP

Bezeichnung: Substituierte Arylketone

Priorität: 17. Januar 2000 DE 100 01 588.3

IPC: C 07 D, A 01 N

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

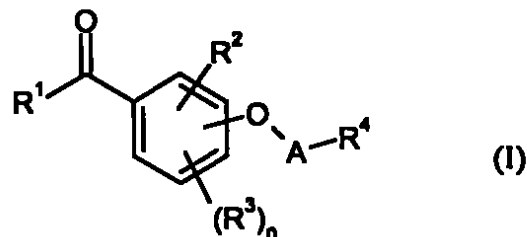
München, den 13. November 2000
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

Substituierte Arylketone

Die Erfindung betrifft neue substituierte Arylketone, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte substituierte Arylketone herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, EP-A-352543, EP-A-418175, EP-A-487357, EP-A-527036, EP-A-527037, EP-A-560483, EP-A-609797, EP-A-609798, EP-A-625505, EP-A-625508, EP-A-636622, US-A-5804532, US-A-5834402, US-A-5846906, US-A-5863865, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I)

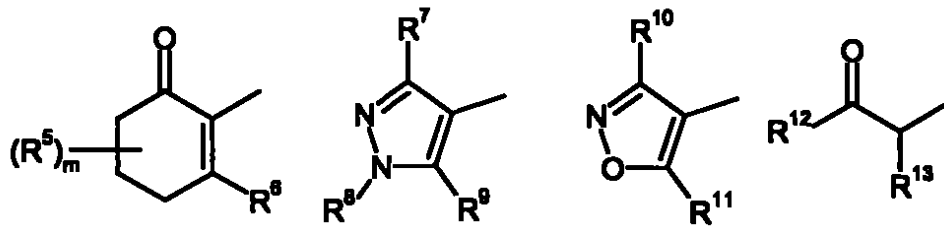


in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

A für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R^1 für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



wobei

5

m für die Zahlen 0 bis 6 steht,

10

R^5 für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylthio oder Aryl steht, oder - für den Fall, daß m für 2 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Alkandiyl (Alkylen) steht,

15

R^6 für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Aryloxy, Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl steht,

20

R^7 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxycarbonyl oder Cycloalkyl steht,

25

R^8 für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

- 5 **R⁹** für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls substitu-
iertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylamino-
carbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy,
Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy steht,
- 10 **R¹⁰** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder
für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl,
Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl
steht,
- 15 **R¹¹** für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl
oder Cycloalkyl steht,
- R¹²** für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl
oder Cycloalkyl steht, und
- 20 **R¹³** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gege-
benenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio,
Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl steht,
- 25 **R²** für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl,
Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkyl-
thio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkyl-
aminosulfonyl steht,
- 30 **R³** für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für
jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl,
Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,
und

R⁴ für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein oder zwei Sauerstoffatome oder ein oder zwei Schwefelatome, oder eine oder zwei SO-Gruppierungen oder eine oder zwei SO₂-Gruppierungen) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,

10 - einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) -

gefunden.

15

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkandiy l - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

20

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) enthalten gegebenenfalls ein oder mehrere asymmetrisch substituierte Kohlenstoffatome und können deshalb in verschiedenen enantiomeren (R- und S- konfigurierten Formen) bzw. diastereomeren Formen vorliegen. Die Erfindung betrifft sowohl die verschiedenen möglichen einzelnen enantiomeren bzw. stereoisomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wie auch die Gemische dieser stereoisomeren Verbindungen.

25

Bevorzugte Substituenten bzw. bevorzugte Bereiche der oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im Folgenden definiert.

30

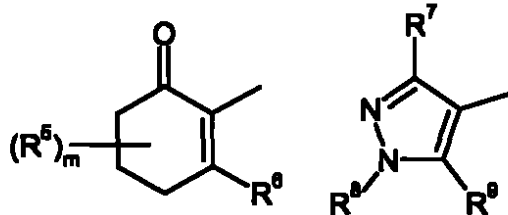
n steht bevorzugt für die Zahlen 0 oder 1 .

m steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4.

A steht bevorzugt für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen.

5

R¹ steht bevorzugt für eine der nachstehenden Gruppierungen



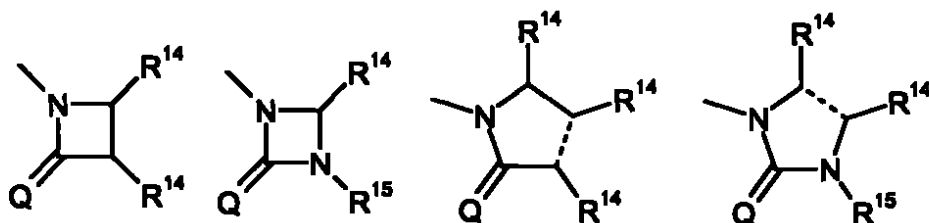
10 R² steht bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

15

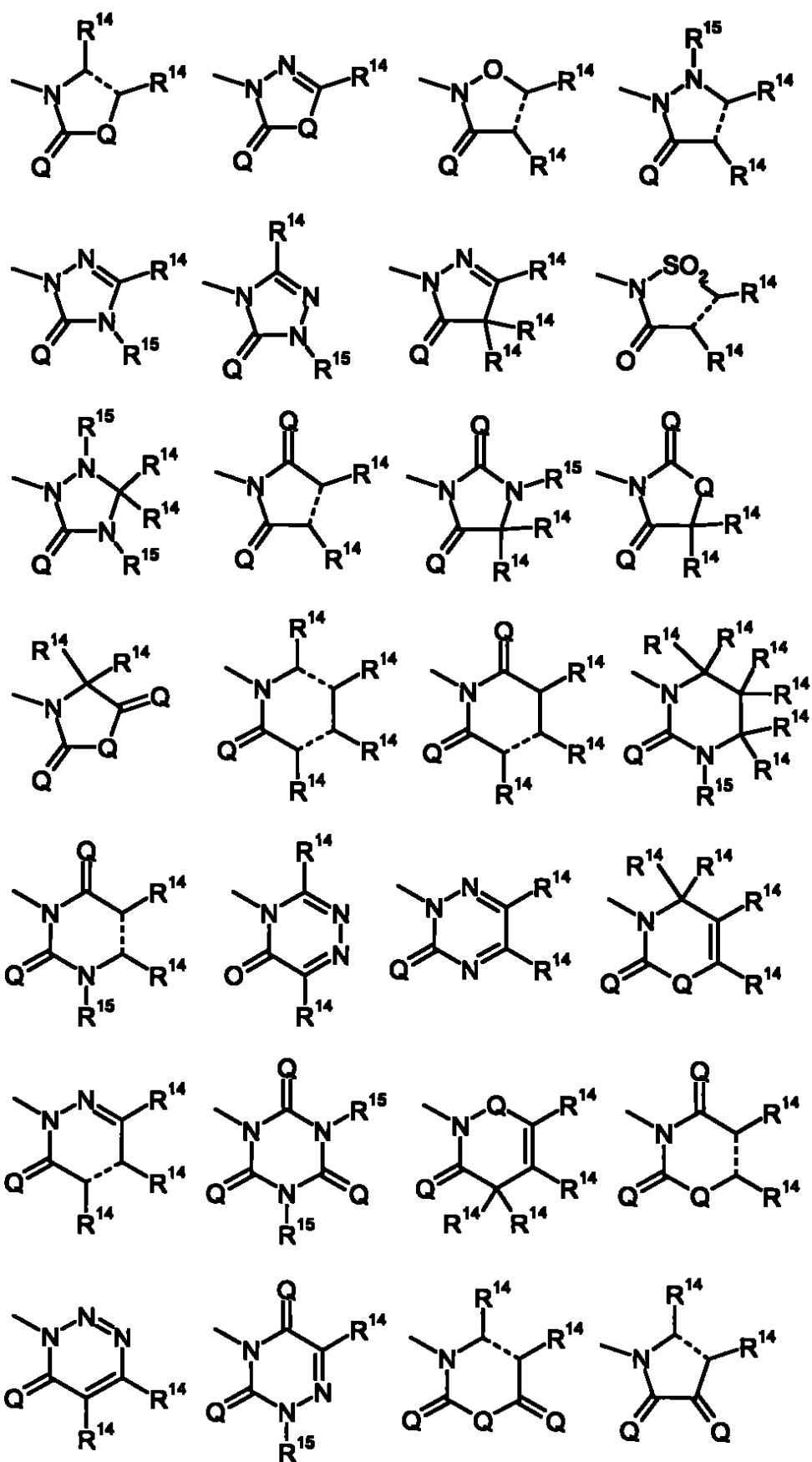
R³ steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

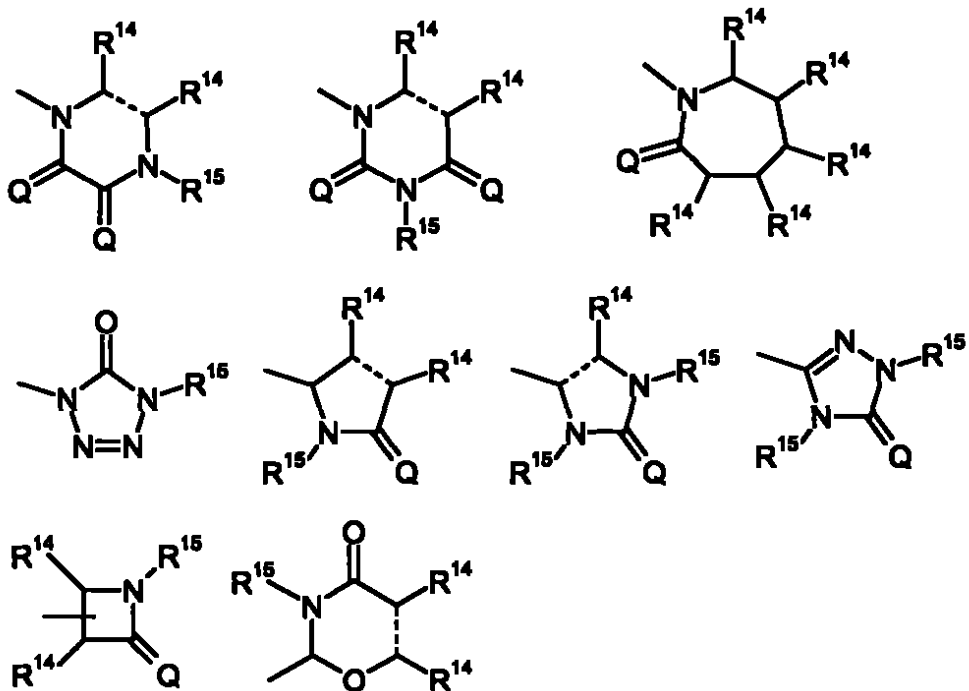
20

R⁴ steht bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen



25





5 worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10 R^{14} für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkyl-

15

20

5 alkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder – für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R¹⁴ und R¹⁴ sich an einer Doppelbindung befinden – auch zusammen mit dem benachbarten Rest R¹⁴ für eine Benzogruppierung steht, und

10

R¹⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R¹⁴ oder R¹⁵ für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Alkan-
diyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

15

20

25

wobei die einzelnen Reste R¹⁴ und R¹⁵ – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

30

- R⁵** steht bevorzugt für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Alkandiyl (Alkylen) mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen.
- R⁶** steht bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Aryloxy, Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.
- R⁷** steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.
- R⁸** steht bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes

Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder
5 für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.

10 **R⁹** steht bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy
15 mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.
20

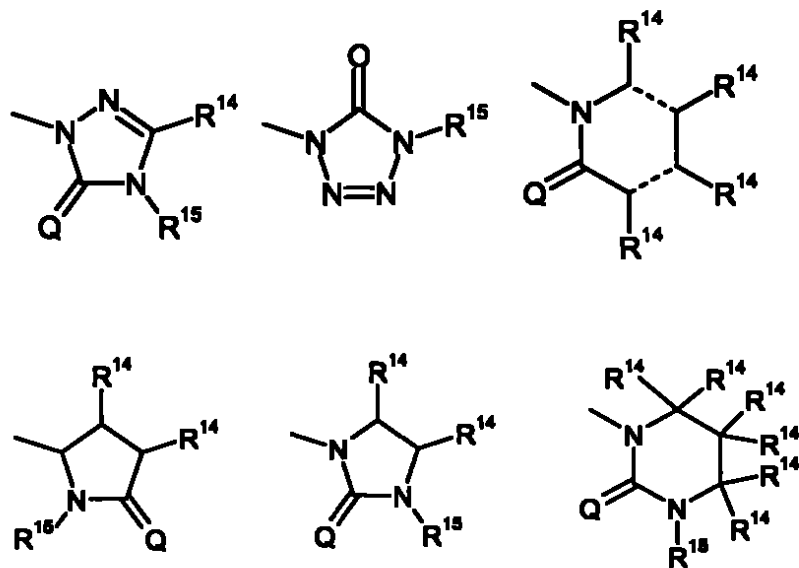
R¹⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
25

R¹¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder
30 für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

- 5 **R¹²** steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.
- 10 **R¹³** steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
- m** steht besonders bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3.
- 15 **A** steht besonders bevorzugt für Methylen, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Ethan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,2-diyl, Butan-1,3-diyl oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).
- 20 **R²** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy,
- 25 n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.
- 30

- R³** steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thio-carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

- R⁴** steht besonders bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen



- R⁵** steht besonders bevorzugt für 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für

den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).

- 5 R^6 steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyryloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio, Phenylmethylsulfinyl oder Phenylmethylsulfonyl.
- 10
- 15
- 20
- 25 R^7 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thio-carbamoyl, 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, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch
- 30

Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

5 **R⁸** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl,
Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls
durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl,
Propinyl oder Butinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor,
Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclo-
10 pentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentyl-
methyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro,
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-
Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-
Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder
15 Benzyl.

20 **R⁹** steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegeben-
falls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy
substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy,
Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy,
Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyl-
oxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methyl-
sulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gege-
benenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy,
25 Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls
durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-,
i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-,
s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes
Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy.
30

- 5 **R¹⁰** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thio-
carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano,
Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes
Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n-
oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy,
Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio,
Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl,
Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder
i-Propylsulfonyl.
- 10 **R¹¹** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl,
Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls
durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclo-
propyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- 15 **R¹²** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl,
Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls
durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclo-
propyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- 20 **R¹³** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor,
Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom,
Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s-
oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy,
Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio,
Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl,
Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder
i-Propylsulfonyl.
- 25 **R¹³**
- 30

- R¹⁴** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyl-oxy, Butenyl-oxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenyl-amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino, Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenyl-oxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R¹⁴ und R¹⁴ sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R¹⁴ auch für eine Benzogruppierung.

- R¹⁵** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R¹⁴ oder R¹⁵ für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).
- A** steht ganz besonders bevorzugt für Methylen oder Dimethylen.
- m** steht ganz besonders bevorzugt für die Zahlen 0, 1 oder 2.
- R²** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.
- R³** steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy,

Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

- 5 **R⁵** steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, für Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).
- 10 **R⁶** steht ganz besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyloxy, 15 Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, 20 Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy Phenylmethylthio, Phenylmethylsulfinyl oder Phenylmethylsulfonyl.
- 25 **R⁷** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl. 30

- 5 **R⁸** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl.
- 10 **R⁹** steht ganz besonders bevorzugt für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy.
- 20 **R¹⁰** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl.
- 30 **R¹¹** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl,

n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl.

5 R¹² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl.

10 R¹³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, 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.

20 R¹⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, 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, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, 25 Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl, Propenyloxy, Propenylthio oder Propenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropyloxy, Cyclopropylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy oder Cyclopropylmethylanino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n-

oder i-propoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino, oder - für den Fall, dass zwei benachbarte Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung.

5

R^{15} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für Propenyl oder Propinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl oder Cyclopropylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14} oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen).

10

15

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

20

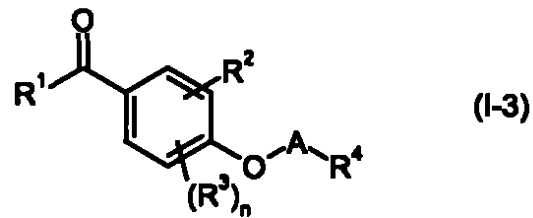
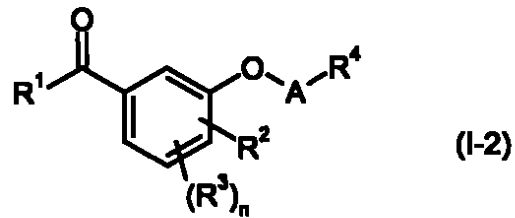
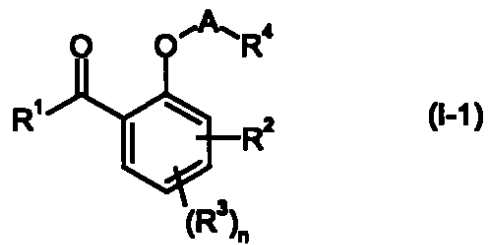
Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

25

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

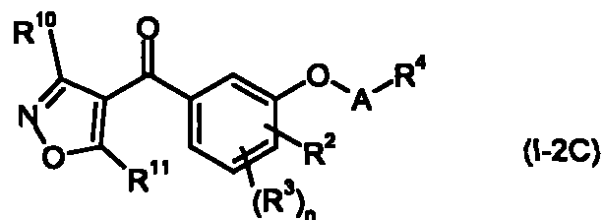
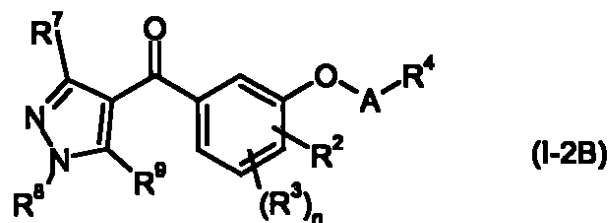
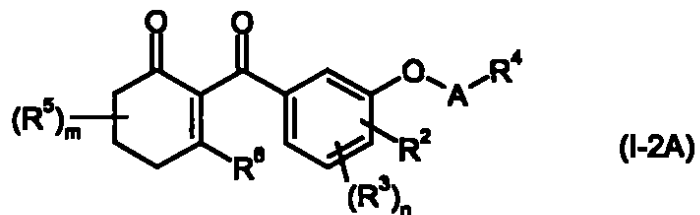
30

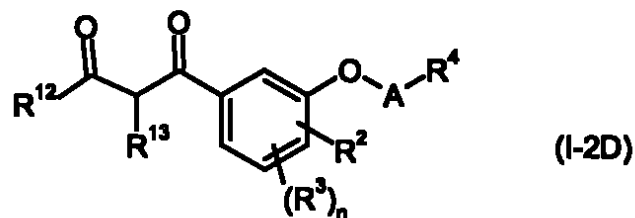
Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-1) bis (I-3) werden besonders hervorgehoben:



5 n, A, R¹, R², R³ und R⁴ haben hierbei jeweils die am meisten vorzuziehende Bedeutung.

Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-2A) bis (I-2D) werden ganz besonders hervorgehoben:





$m, n, A, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}$ und R^{13} haben hierbei jeweils die am meisten vorzuziehende Bedeutung.

5

Gegenstand der Erfindung sind auch Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C₁-C₄-Alkyl-ammonium-, Di-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tetra-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium-, C₅- oder C₆-Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C₁-C₂-alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen der Formel (I), in welcher vorzugsweise n, A, R^1, R^2, R^3 und R^4 die oben als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen haben.

10

15

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

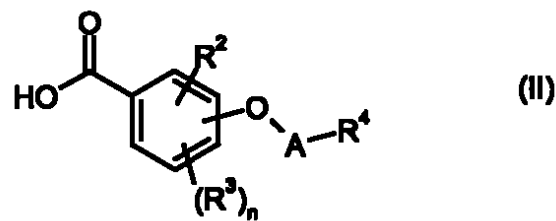
20

Die neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I), wenn man

25

(a) substituierte Benzoesäuren der allgemeinen Formel (II)



in welcher

n , A , R^2 , R^3 und R^4 die oben angegebene Bedeutung haben,

5

- oder reaktionsfähige Derivate hiervon, wie z.B. entsprechende Säurehalogenide, Säurecyanide oder Ester -

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

10



in welcher

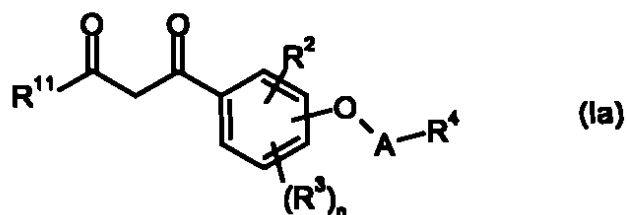
15 R^1 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

20

oder wenn man

(b) substituierte Benzoylketone der allgemeinen Formel (Ia)



25

in welcher

n , A , R^2 , R^3 , R^4 und R^{11} die oben angegebene Bedeutung haben,

5

mit einem Orthoameisensäureester oder mit einem N,N-Dimethyl-formamid-acetal oder mit einem Cyanoameisensäureester oder mit Carbondisulfid (Schwefelkohlenstoff) und einem Alkylierungsmittel, und anschliessend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

10

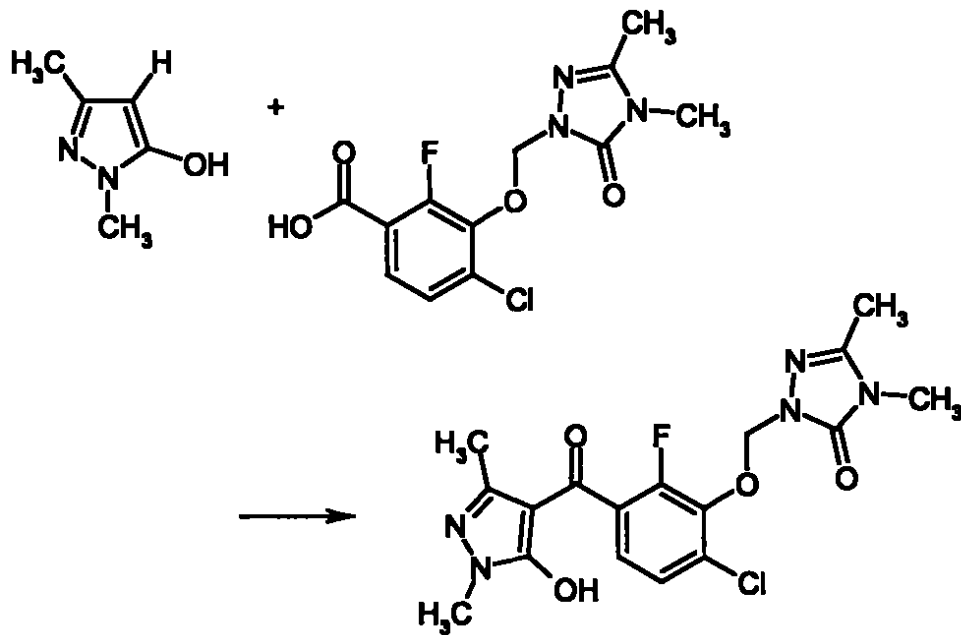
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

15

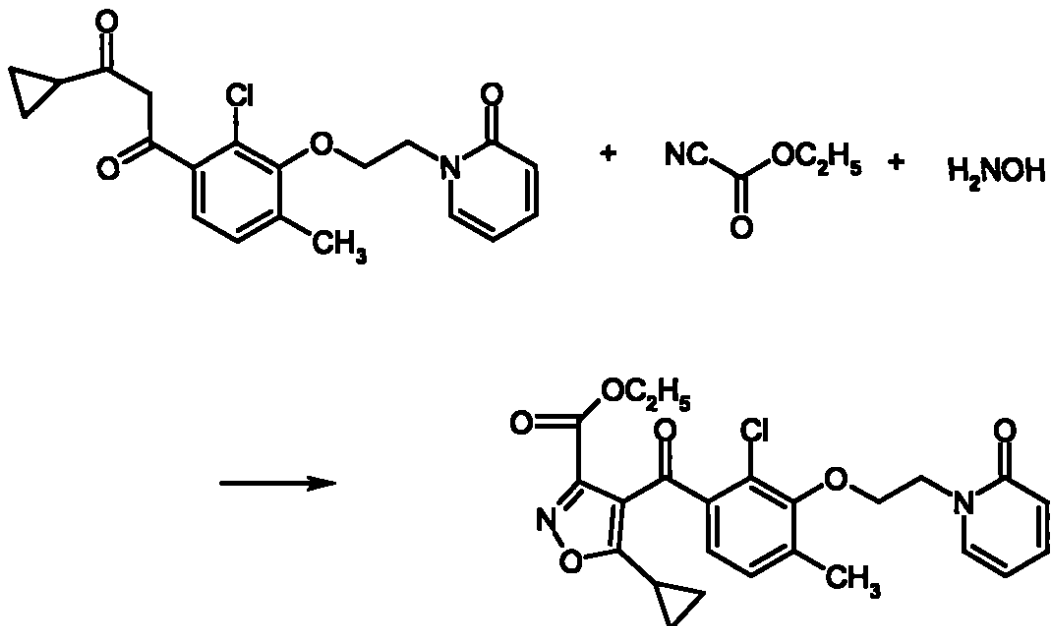
und gegebenenfalls im Anschluss an die Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) oder (b) an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise Substitutions-, Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt und/oder die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auf übliche Weise in salzartige Verbindungen überführt.

20

Verwendet man beispielsweise 4-Chlor-3-[(3,4-dimethyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-1,2,4-triazol-3-yl)-methoxy]-2-fluor-benzoesäure und 1,3-Dimethyl-5-hydroxy-pyrazol als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 1-[2-Chlor-4-methyl-3-[2-(2-oxo-1(2H)-pyridinyl)-ethoxy]-phenyl-3-cyclopropyl-1,3-propan-dion, Cyanoameisensäure-ethylester und Hydroxylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



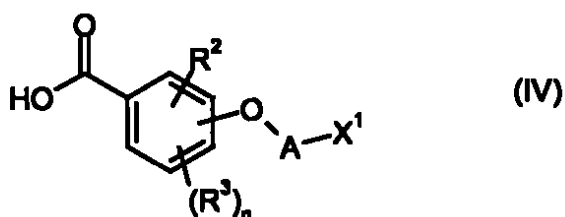
Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoe-

säuren sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben n , A , R^2 , R^3 und R^4 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n , A , R^2 , R^3 und R^4 angegeben worden sind.

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 substituierten Benzoesäuren -oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester - wenn man

(a) Verbindungen der Formel (IV)



in welcher

n , A , R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben und

X^1 für Halogen (insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom) oder für Alkylsulfonyloxy (insbesondere Methylsulfonyloxy oder Ethylsulfonyloxy) steht,

- oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester -

mit heterocyclischen Verbindungen der allgemeinen Formel (V)



in welcher

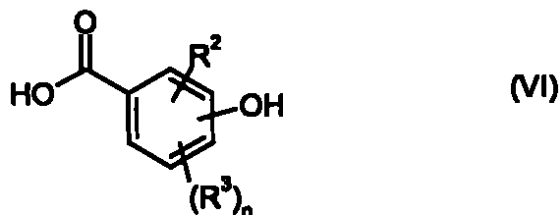
5 R^4 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumcarbonat,
und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Aceton,
Butanon, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder Dimethylsulfoxid, bei
10 Temperaturen zwischen 10°C und 150°C umsetzt und gegebenenfalls im An-
schluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise
weitere Umwandlungsreaktionen durchführt (vgl. die Herstellungsbeispiele),

oder wenn man

15

(β) Verbindungen der Formel (VI)



20

in welcher

n , R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben,

25

- oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und
Ethylester -

mit Hydroxyalkylheterocyclen der allgemeinen Formel (VII)



in welcher

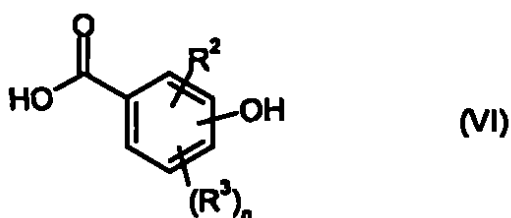
5 A und R^4 die oben angegebene Bedeutung haben,

10 in Gegenwart von Kondensationshilfsmitteln, wie z.B. Azodicarbonsäure-diethylester und Triphenylphosphin, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrahydrofuran, bei Temperaturen zwischen -20°C und $+50^\circ\text{C}$ umgesetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt (vgl. die Herstellungsbeispiele),

oder wenn man

15

(γ) Verbindungen der Formel (VI)



20

in welcher

n , R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben,

25 - oder auch ihre Derivate, wie ihre Ester, insbesondere die Methylester und Ethylester -

mit Halogenalkylheterocyclen der allgemeinen Formel (VIII)



in welcher

5

A und R⁴ die oben angegebene Bedeutung haben und

10

X² für Halogen (insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom), für Alkylsulfonyloxy (insbesondere Methylsulfonyloxy oder Ethylsulfonyloxy), oder für Arylsulfonyloxy (insbesondere p-Tolylsulfonyloxy) steht,

15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumcarbonat oder Triethylamin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Aceton, Butanon, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder Dimethylsulfoxid, bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C umgesetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

20

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat R¹ vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für R¹ angegeben worden ist.

25

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannte organische Verbindungen.

30

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoylketone sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (Ia) haben n, A, R², R³, R⁴ und R¹¹ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits
5 oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, A, R², R³, R⁴ und R¹¹ angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (Ia) sind erfindungsgemäße, neue Verbindungen; sie können nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) hergestellt werden.
10

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Arylketone der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines Dehydratisierungsmittels durchgeführt. Es kommen hierbei die üblichen zur Bindung
15 von Wasser geeigneten Chemikalien in Betracht.

Als Beispiele hierfür werden Dicyclohexylcarbodiimid und Carbonyl-bis-imidazol genannt.
20

Als besonders gut geeignetes Dehydratisierungsmittel wird Dicyclohexylcarbodiimid genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittels durchgeführt.
25

Als Beispiele hierfür werden Natriumcyanid, Kaliumcyanid, Acetoncyanhydrin, 2-Cyano-2-(trimethylsilyloxy)-propan und Trimethylsilylcyanid genannt.
30

Als besonders gut geeignetes weiteres Reaktionshilfsmittel wird Trimethylsilyl-cyanid genannt.

5 Das erfindungsgemäße Verfahren (a) zur Herstellung der neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines weiteren Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als weiteres Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im allgemeinen basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, 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-methyl-pyridin, 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) in Betracht.

20 Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung von Orthoameisensäureestern oder N,N-Dimethyl-formamid-acetalen durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele werden Orthoameisensäure-trimethylester, Orthoameisensäure-triethylester, N,N-Dimethyl-formamid-dimethylacetal und N,N-Dimethyl-formamid-diethylacetal genannt.

25 Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung von Cyanoameisensäureestern durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele werden Cyanoameisensäure-methylester und Cyanoameisensäureethylester genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung von (Carbondisulfid und) Alkylierungsmitteln durchgeführt. Diese Verbindungen enthalten vorzugsweise Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl oder Ethyl. Als Beispiele werden

5 Methylchlorid, Methylbromid, Methyliodid, Dimethylsulfat, Ethylchlorid, Ethylbromid, Ethyliodid und Diethylsulfat genannt.

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) werden unter Verwendung von Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

10 durchgeführt. Als bevorzugtes Säureaddukt wird Hydroxylamin-Hydrochlorid genannt.

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung von Verdünnungsmitteln

15 durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) kommen 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,

20 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 Hexamethylphosphorsäure-

25 triamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether.

30 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) 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.

5 Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

10 Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) 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 durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen
15 Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen der Formeln (IV), (V), (VI), (VII) und (VIII) sind bekannte organische Verbindungen.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliantes, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder
25 selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

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

30

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.

25

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 Weide-

30

flächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

5 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 Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

15

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba-

20 ren oder nicht schützba-

25 ren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

30

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

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 Alkyl-naphthaline, 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 schaum-
5 erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfit-
10 ablaugen 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 Phospho-
15 lipide, 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 Metallphthalocyanin-
20 farbstoffe 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 %.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern („Safenern“) zur Unkrautbekämpfung ver-
wendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es
30 sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

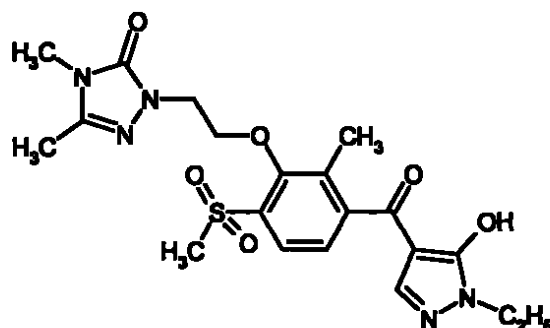
- 5 Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim (-sodium),
 Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine,
 Azafenidin, Azimsulfuron, BAS-662H, Beflubutamid, Benazolin (-ethyl), Ben-
 furesate, Bensulfuron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzo-
 fenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromo-
 butide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butroxydim,
 10 Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlo-
 methoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlor-
 sulfuron, Chlortoluron, Cinidon (-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim,
 Clethodim, Clodinafop (-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyra-
 sulfuron (-methyl), Cloransulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne,
 15 Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Des-
 medipham, Diallate, Dicamba, Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Di-
 ethatyl (-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate,
 Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphen-
 amid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethal-
 20 fluralin, Ethametsulfuron (-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Eto-
 benzanid, Fenoxaprop (-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L,
 -methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone
 (-sodium), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumi-
 propyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flu-
 25 poxam, Flupropacil, Flurpyrsulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl),
 Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Flu-
 thiacet (-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate
 (-ammonium), Glyphosate (-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxy-
 ethyl, -P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz (-methyl), Imazamethapyr, Imaza-
 30 mox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron
 (-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlor-

- tole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet, Mesosulfuron, 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, Pendi-methalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretila-chlor, Primisulfuron (-methyl), Profluazol, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propa-quiza-fop, Propisochlor, Procarbazon (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Pro-sulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyraz-oxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl), Pyri-thiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthi-uron, Tepraloxydim, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazo-pyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Tri-floxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.
- Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzen-nährstoffen 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.

5 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.

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

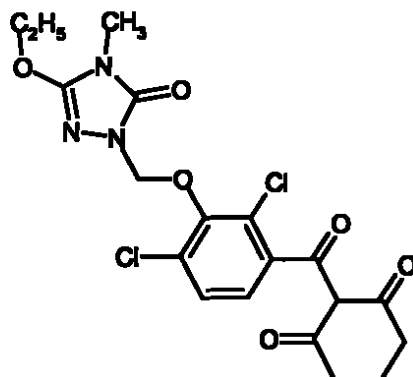
Herstellungbeispiele:**Beispiel 1**

5 (Verfahren (a))

Zu einer Lösung von 1,1 g (2,7 mMol) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäurechlorid in 20 ml Dichlormethan gibt man nach einander 0,30 g (2,7 mMol) 1-Ethyl-5-hydroxy-pyrazol, 0,8 g (8,0 mMol) Triethylamin und einen Tropfen N,N-Dimethyl-formamid. Man rührt die Mischung ca. 24 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C), wäscht die Reaktionslösung nach einander mit 1N-Salzsäure und gesättigter Natriumchlorid-Lösung, trocknet über Magnesiumsulfat und entfernt das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 30ml Acetonitril gelöst und nach einander unter leichtem Kühlen mit 0,28 g (3,3 mMol) 2-Hydroxy-2-methyl-propionitril und 1,4 g (14 mMol) Triethylamin versetzt. Man rührt weitere 24 Stunden bei Raumtemperatur, entfernt den überwiegenden Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum und löst den Rückstand in Dichlormethan und 1N-Salzsäure. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert

Man erhält 1,1 g (88 % d. Theorie) 4-{3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylsulfonyl-benzoyl}-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol als öligen Rückstand.

Log P : 1,23.

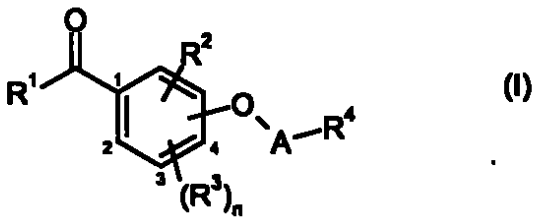
Beispiel 2**5 (Verfahren (a))**

1,95 g (5,4 mMol) 3-(3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoesäure werden in 75 ml Acetonitril gelöst und mit 0,61 g 1,3-Cyclohexandion (5,4 mMol) sowie 1,33 g Dicyclohexylcarbodiimid (DCC, 1,2 Äquiv.) versetzt. Nach 15-stündigem Rühren bei Raumtemperatur (ca. 20°C) werden 1,5 ml Triethylamin (2 Äquiv.) und 0,29 ml Trimethylsilylcyanid (0,4 Äquiv.) dazu gegeben. Nach zwei Stunden bei Raumtemperatur wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand in 10 %iger wäßriger Natriumcarbonat-Lösung verrührt und abfiltriert. Das Filtrat wird mit Diethylether geschüttelt und die wäßrige Phase mit 15 2N Salzsäure angesäuert. Das ausgefallene Produkt wird mit Dichlormethan mehrfach extrahiert, die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt.

Man erhält 1,3 g (53 % der Theorie) 2-[3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoyl]-1,3-cyclohexandion als zähes Harz.

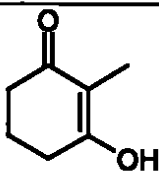
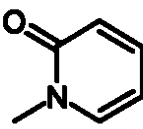
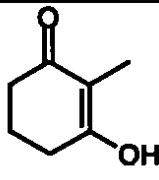
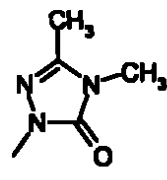
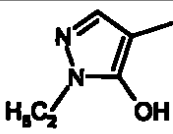
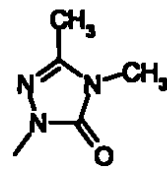
LogP = 2.52.

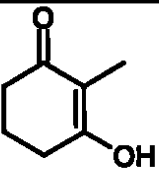
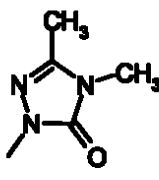
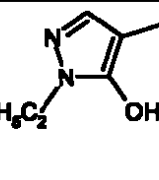
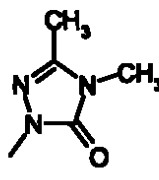
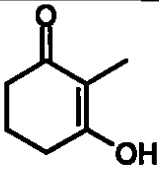
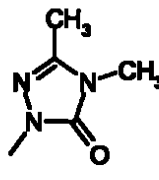
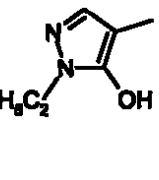
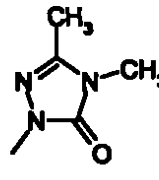
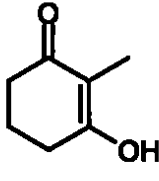
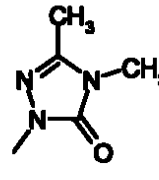
Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

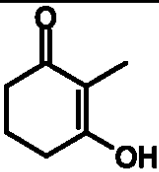
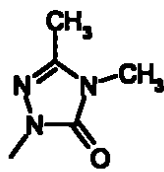
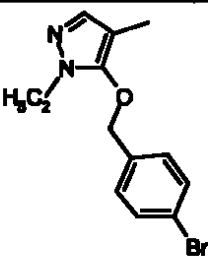
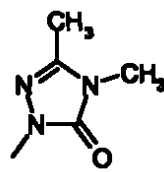
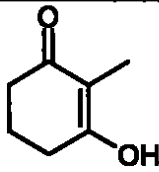
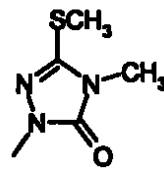
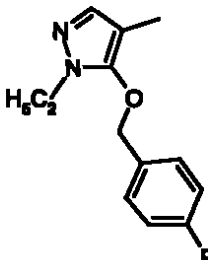
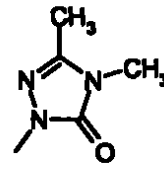
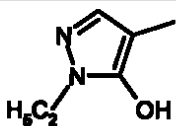
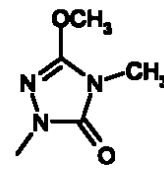


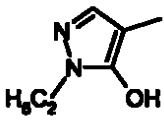
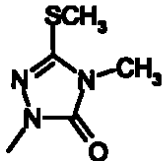
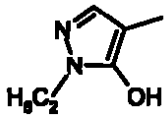
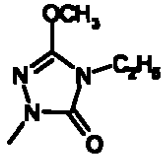
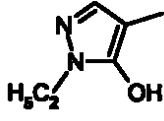
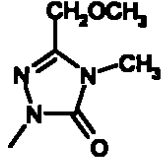
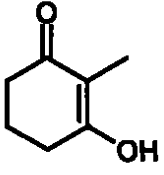
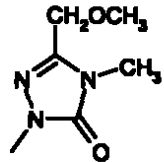
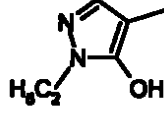
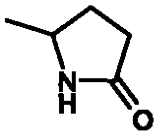
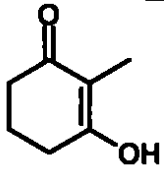
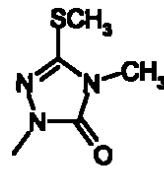
5

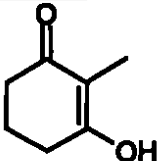
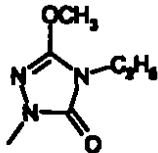
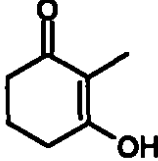
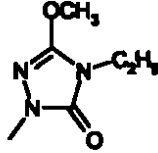
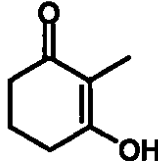
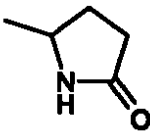
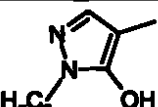
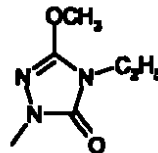
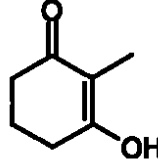
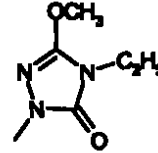
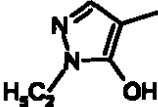
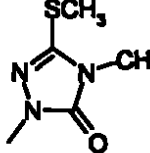
Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

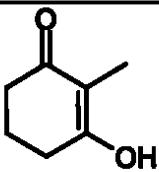
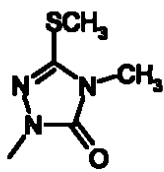
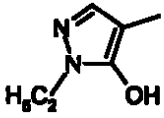
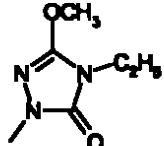
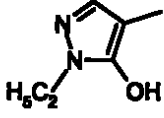
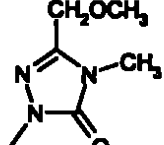
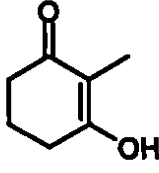
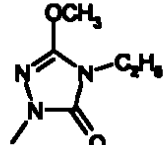
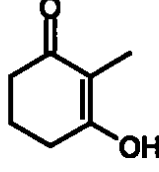
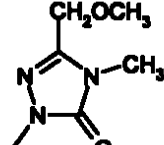
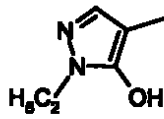
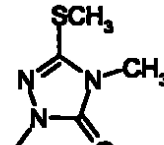
Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
3	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
4	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
5	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,52 ^{a)}

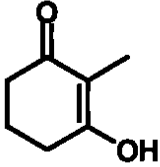
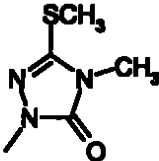
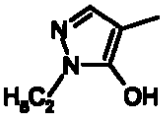
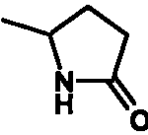
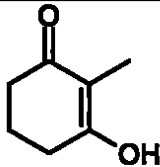
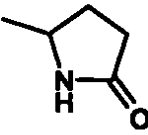
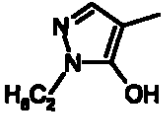
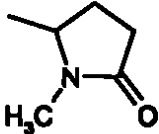
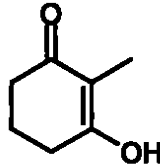
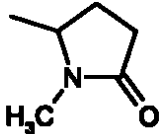
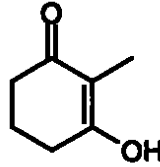
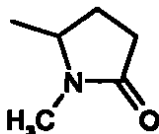
Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
6	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
7	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,68 ^{a)}
8	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,94 ^{a)}
9	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,58 ^{a)}
10	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,91 ^{a)}

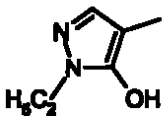
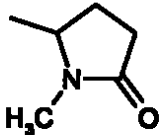
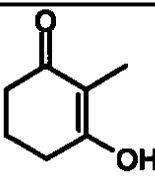
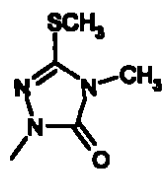
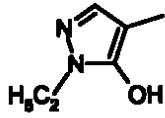
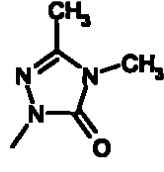
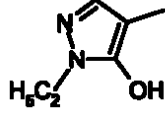
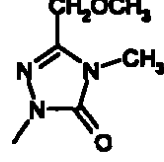
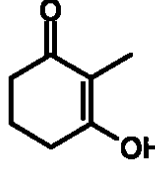
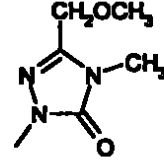
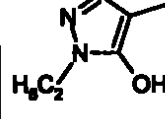
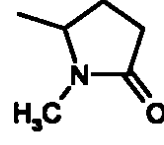
Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
11	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	logP = 1,65 ^{a)}
12	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,07 ^{a)}
13	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,44 ^{a)}
14	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}
15	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,69 ^{a)}

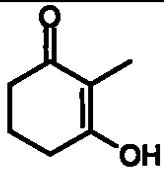
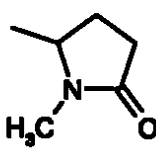
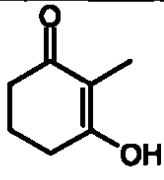
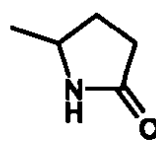
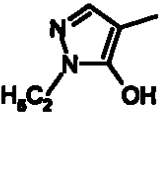
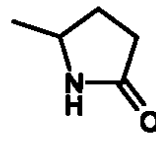
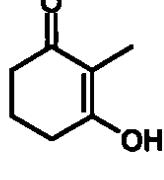
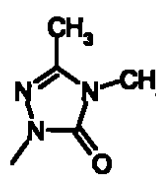
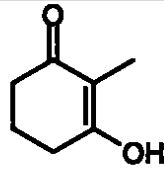
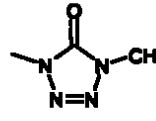
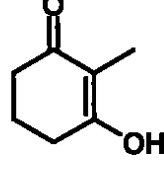
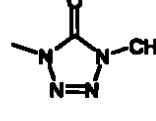
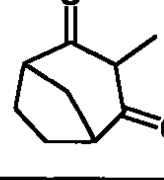
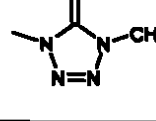
Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
16	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
17	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
18	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,62 ^{a)}
19	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,06 ^{a)}
20	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 1,60 ^{a)}
21	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,39 ^{a)}

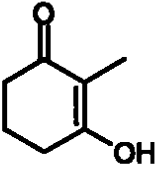
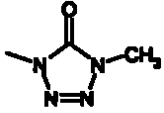
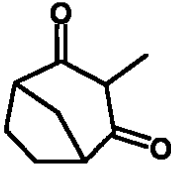
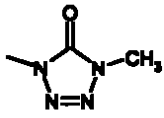
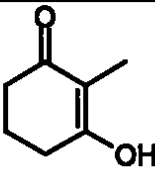
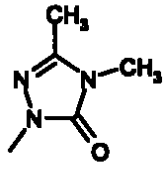
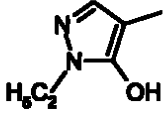
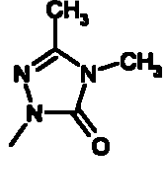
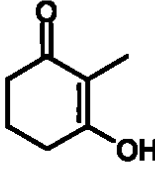
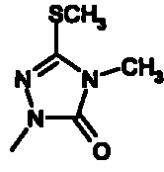
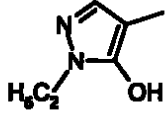
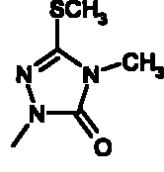
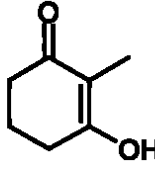
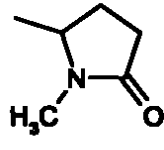
Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
22	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,16 ^{a)}
23	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,40 ^{a)}
24	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 1,98 ^{a)}
25	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,88 ^{a)}
26	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,15 ^{a)}
27	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,11 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
28	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}
29	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,12 ^{a)}
30	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,78 ^{a)}
31	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}
32	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
33	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,97 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
34	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,36 ^{a)}
35	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer) [α] _D ²⁰ = +2,3 logP = 1,67 ^{a)}
36	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 1,94 ^{a)}
37	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 1,85 ^{a)}
38	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 2,10 ^{a)}
39	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 2,12 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
40	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 1,67 ^{a)}
41	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 2,42 ^{a)}
42	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1,65 ^{a)}
43	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	
44	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}
45	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 1,68 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
46	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(S- Enantiomer) logP = 2,13 ^{a)}
47	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer)
48	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(S- Enantiomer)
49	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1,92 ^{a)}
50	CH ₂ CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	²⁰ n _D = 1,5970
51	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	²⁰ n _D = 1,5825
52	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	²⁰ n _D = 1,5790

Bsp.- Nr.	A	R ¹	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	Physikal. Daten
53	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	Fp.: 69°C
54	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	Fp.: 62°C
55	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
56	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
57	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
58	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
59	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	

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.

5

(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.

10

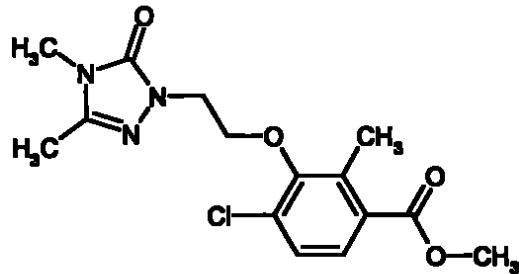
(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

15

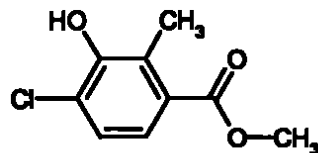
Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

20

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)**

5

Stufe 1

- 10 In eine siedende Lösung von 100 g (0,6 Mol) 3-Hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester und 0,4 ml Diisopropylamin in 800 ml 1,2-Dichlor-ethan leitet man innerhalb von 4 bis 6 Stunden 43 g (0,606 Mol) Chlorgas ein. Nach dem Abkühlen wäscht man die Lösung nach einander mit jeweils 200 ml 5 %iger Natriumhydrogensulfid-Lösung und mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung, trocknet die organische Phase über Magnesiumsulfat und entfernt das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum. Das als Rückstand erhaltene dunkelbraune Öl wird mit 30 ml Diethylether versetzt und zur Kristallisation auf 0° bis 4°C abgekühlt. Die ausgefallenen Kristalle werden durch Absaugen isoliert, mit wenig kaltem Diethylether gewaschen, und im Vakuum bei 30°C getrocknet.

20

Man erhält 46,6 g (39 % d. Theorie) 4-Chlor-3-hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester.

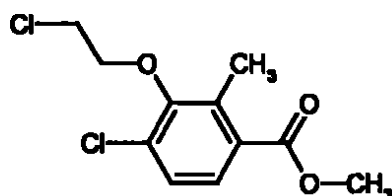
Log P: 2,14.

358

Verwendet man an Stelle von 3-Hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester den entsprechenden Ethylester, so erhält man nach dem gleichen Verfahren 4-Chlor-3-hydroxy-2-methyl-benzoesäure-ethylester.

5 Schmelzpunkt: 51°C

Stufe 2



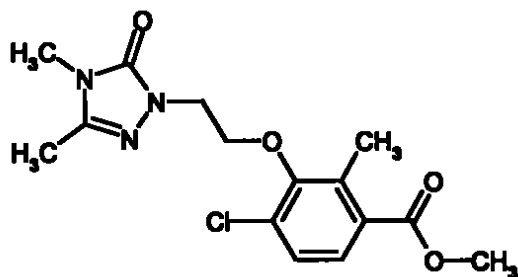
10

Zu einer Lösung von 25 g (0,125 Mol) 4-Chlor-3-hydroxy-2-methyl-benzoesäure-methylester in 400 ml Acetonitril gibt man nach einander 34,2 g (0,248 Mol) gepulvertes wasserfreies Kaliumcarbonat und 29,3 g (0,125 Mol) 2-Chlor-ethanol-p-toluolsulfonat. Man erhitzt ca. sieben Stunden auf 70°C, läßt das Reaktionsgemisch abkühlen und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 200 ml Dichlormethan und 300 ml Wasser gelöst. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

20

Man erhält 32,5 g (99 % der Theorie) 4-Chlor-3-(2-chlor-ethoxy)-2-methyl-benzoesäure-methylester als dunkles Öl.

Log P = 3,52.

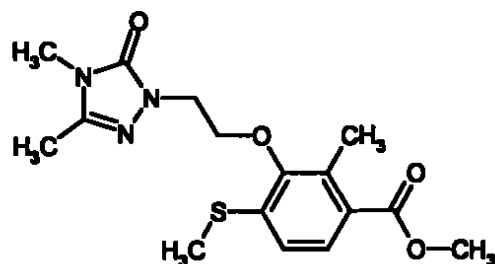
Stufe 3

- 5 Zu einer Lösung von 16,0 g (60,8 mMol) 4-Chlor-3-(2-chlor-ethoxy)-2-methylbenzoesäure-methylester in 70 ml Dimethylsulfoxid gibt man nacheinander 18,4 g (0,133 Mol) gepulvertes wasserfreies Kaliumcarbonat und 6,9 g (60,8 mMol) 3,4-Dimethyl-1,2,4-triazolin-5-on. Man erhitzt ca. sechs Stunden auf 90°C, lässt das Reaktionsgemisch abkühlen und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im
- 10 Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in 140 ml Dichlormethan und 60 ml Wasser gelöst. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und im Wasserstrahlvakuum eingeeengt. Der ölige Rückstand wird mit 25 ml Petrolether verrührt. Das hierbei kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert.

15

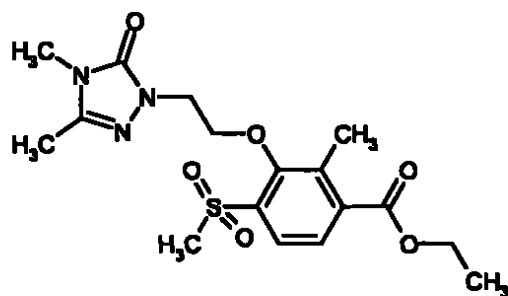
Man erhält 18,5 g (80 % der Theorie) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure-methylester.

Log P: 1,94.

Beispiel (II-2)

- 5 Zu einer Lösung von 12,4 g (36,5 mMol) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure-methylester. in 100 ml N,N-Dimethyl-formamid gibt man unter Eiskühlung 3,3 g (44,5 mMol) Natriummethylmercaptid. Man rührt ca. sechs Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in
- 10 300 ml Essigsäureethylester und 200 ml Wasser gelöst. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.
- 15 Man erhält 5,4 g (42 % der Theorie) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylthio-benzoesäure-methylester.

Log P = 1,89.

20 **Beispiel (II-3)**

5 Zu einer Lösung von 12,3 g (33,7 mMol) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylthio-benzoesäure-ethylester. in 40 ml Essigsäure gibt man 10 mg Ammoniummolybdat-Tetrahydrat und 17,3g (178 mMol) 35 %ige wäßrige Wasserstoffperoxid-Lösung. Man erwärmt die Reaktionsmischung ca. sechs Stunden auf 50° bis 60°C, verdünnt mit Wasser und extrahiert mit Essigsäureethylester. Die organische Phase wird abgetrennt, nacheinander mit Wasser, Natriumhydrogencarbonat-Lösung, Natriumthiosulfat-Lösung und abermals Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

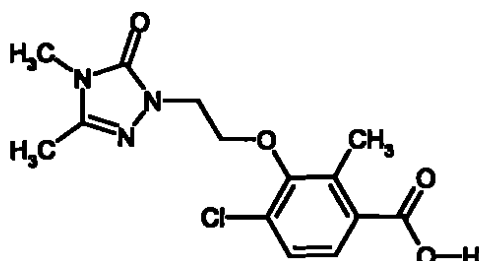
10

Man erhält 12,3 g (92 % der Theorie) 3-[2-(3',4'-Dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure-ethylester.

Log P = 1,76.

15

Beispiel (II-4)



20 Zu einer Lösung von 6,5 g (19,0 mMol) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure-methylester in 40 ml Ethanol gibt man 1,2 g (30mMol) eine Lösung von Natriumhydroxid in 20 ml Wasser. Man rührt die Lösung ca. 24 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C), und entfernt den größten Teil des Lösungsmittels im Wasserstrahlvakuum. Der Rückstand wird in

25 Wasser gelöst und mit Salzsäure angesäuert. Die entstehende Suspension wird mit Essigsäureethylester extrahiert, die organische Phase abgetrennt, mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert.

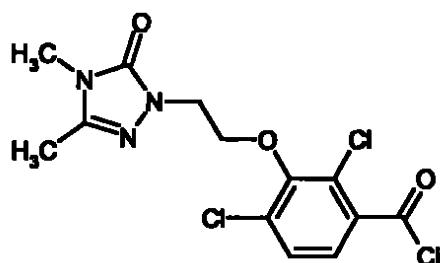
Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

5 Man erhält 5,9 g (95 % der Theorie) 4-Chlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-methyl-benzoesäure.

Log P = 1,37.

Beispiel (II-5)

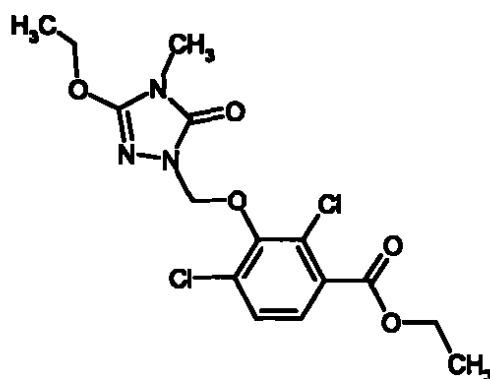
10



15 2,3 g (6,65 mMol) 2,4-Dichlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-benzoesäure werden in 10 ml Thionylchlorid ca. 1,5 Stunden auf 70°C erwärmt. Man läßt die Reaktionslösung abkühlen und entfernt das überschüssige Thionylchlorid unter vermindertem Druck.

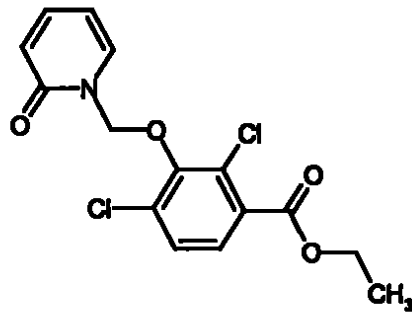
Man erhält 2,4 g (100 % der Theorie) 2,4-Dichlor-3-[2-(3',4'-dimethyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-ethoxy]-2-benzoesäurechlorid.

20 Log P = 1,24.

Beispiel (II-6)

- 5 g (21,3 mMol) 2,4-Dichlor-3-hydroxy-benzoessäure-ethylester werden in 200 ml Tetrahydrofuran gelöst und mit 3,68 g (21,3 mMol) 1-Hydroxymethyl-3-ethoxy-4-methyl-1,2,4-triazolin-5-on versetzt. Nach Zugabe von 5,58 g (21,3 mMol) Triphenylphosphin werden bei 0°C 4,4 g 85 %iges Diethyl-diazo-dicarboxylat zuge-
- 10 tropft. Die resultierende Lösung wird über Nacht geführt, im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und über Kieselgel filtriert (Essigsäureethylester/Hexan). Das Filtrat wird eingeeengt und mit Diethylether versetzt. Der sich abscheidende Feststoff wird abfiltriert und vom Filtrat das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.
- 15 Man erhält 6,8 g (82 % der Theorie) 3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoessäure-ethylester als zähes Öl.

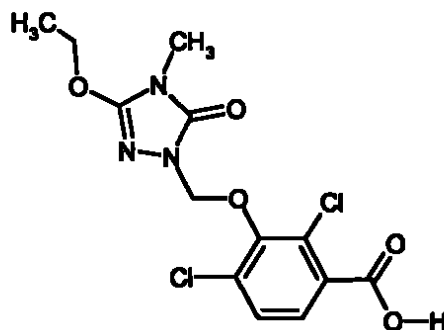
LogP = 2.77.

Beispiel (II-7)

- 5 2 g (8,5 mMol) 2,4-Dichlor-3-hydroxy-benzoesäure-ethylester werden in 30 ml Acetonitril gelöst und nacheinander mit 0,86 g (8,5 mMol) Triethylamin und 1,2 g (8,5 mMol) N-Chlormethyl-2-pyridon versetzt. Die resultierende Mischung wird 7 Stunden bei 60°C gerührt, mit Wasser versetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird abgetrennt, mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Lösungsmittel wird unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.
- 10

Man erhält 2,4 g (82 % der Theorie) 2,4-Dichlor-3-(1H-pyrid-2-on-1-yl)-methoxybenzoesäure-ethylester.

15

Beispiel (II-8)

- 20 6,4 g (16,3 mMol) 3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoesäure-ethylester werden in einem Gemisch aus 250 ml Cyclo-

hexan und 25 ml Ethylenglycol-monomethylether in Gegenwart von 0,91 g gepulvertem Kaliumhydroxid 15 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Es wird mit Wasser verdünnt und mit 2N Salzsäure angesäuert. Das ausgefallene Feststoff wird durch Absaugen isoliert.

5

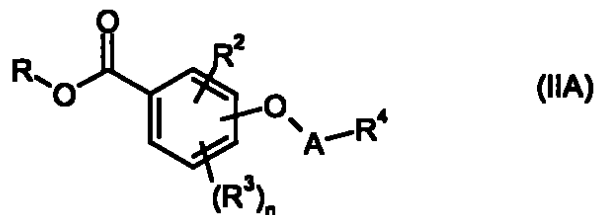
Man erhält 4,05 g (69 % der Theorie) 3- (3'-Ethoxy-4'-methyl-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-yl)-methoxy-2,4-dichlor-benzoesäure.

log P: 1,74.

10

Analog zu den Beispielen (II-1) bis (II-8) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (II) oder reaktionsfähige Derivate hiervon - vgl. Formel (IIA) - hergestellt werden,

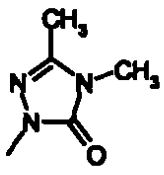
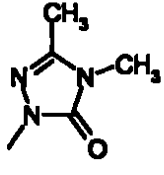
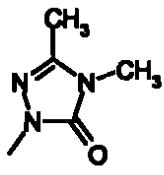
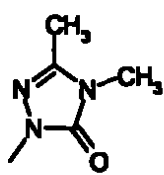
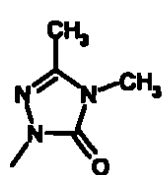
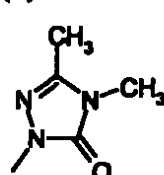
15

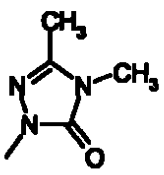
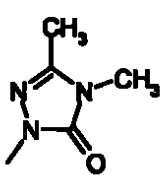
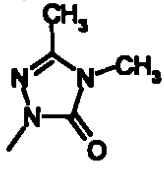
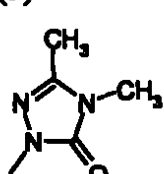
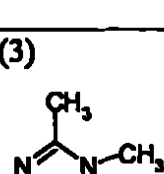
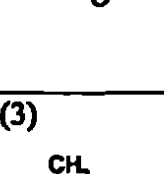


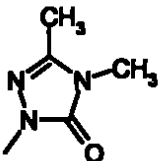
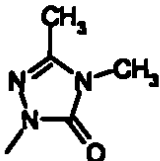
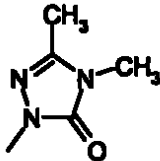
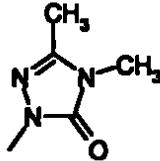
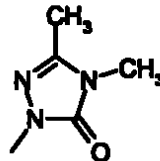
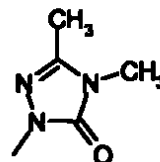
wobei

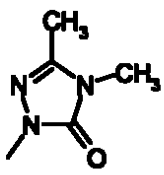
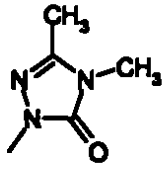
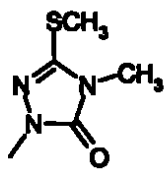
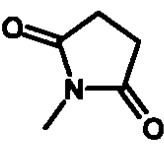
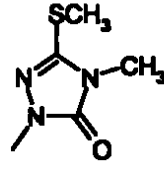
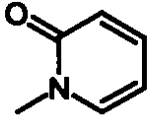
20 R eine der in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen hat.

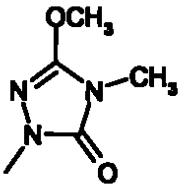
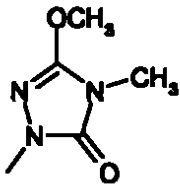
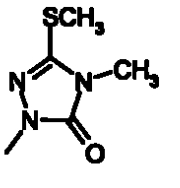
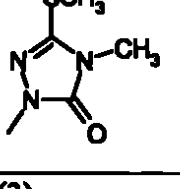
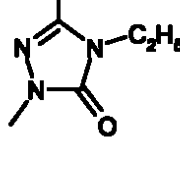
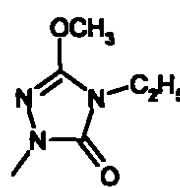
Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (II) bzw. (IIA)

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-9	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,25 ^{a)}
II-10	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,16 ^{a)}
II-11	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	CH ₃	logP = 1,48 ^{a)}
II-12	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,33 ^{a)}
II-13	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,92 ^{a)}
II-14	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,08 ^{a)}

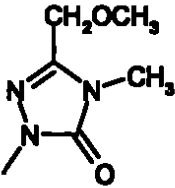
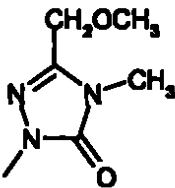
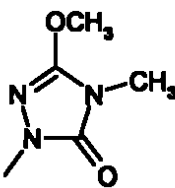
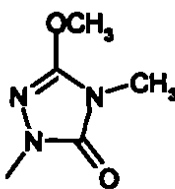
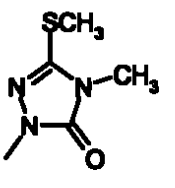
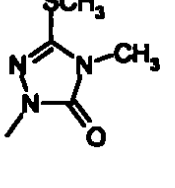
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-15	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,23 ^{a)}
II-16	CH ₂ CH ₂	(2) SCH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,13 ^{a)}
II-17	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,09 ^{a)}
II-18	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,27 ^{a)}
II-19	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	H	logP = 0,59 ^{a)}
II-20	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,72 ^{a)}

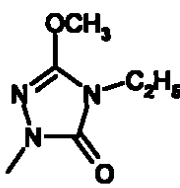
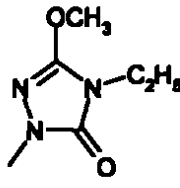
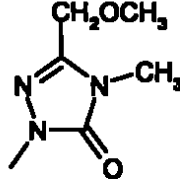
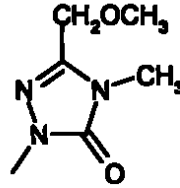
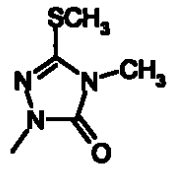
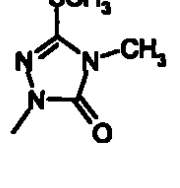
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-21	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,77 ^{a)}
II-22	CH ₂ CH ₂	(2) SO ₂ CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,46 ^{a)}
II-23	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,49 ^{a)}
II-24	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,95 ^{a)}
II-25	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,83 ^{a)}
II-26	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,34 ^{a)}

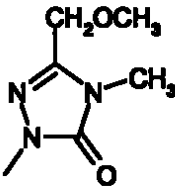
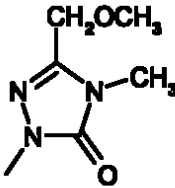
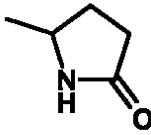
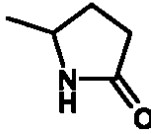
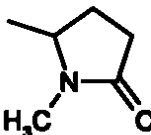
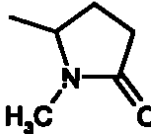
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-27	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,27 ^{a)}
II-28	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,37 ^{a)}
II-29	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,69 ^{a)}
II-30	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,13 ^{a)}
II-31	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,68 ^{a)}
II-32	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆), δ): 5,89 ppm (s, CH ₂)

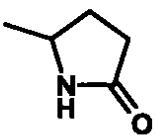
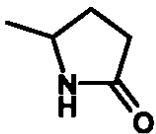
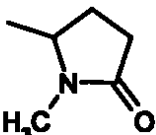
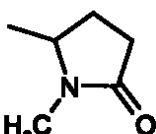
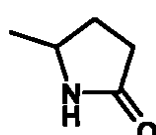
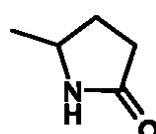
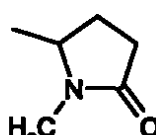
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-33	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,40 ^{a)}
II-34	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,52 ^{a)}
II-35	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,66 ^{a)}
II-36	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,72 ^{a)}
II-37	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,68 ^{a)}
II-38	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,73 ^{a)}

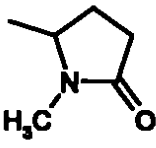
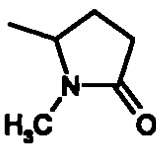
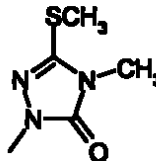
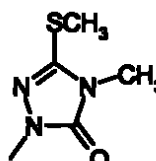
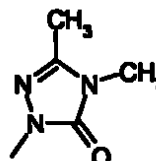
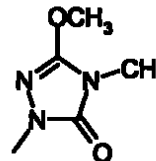
371

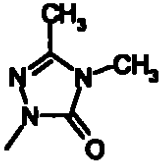
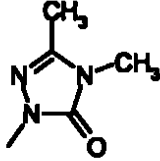
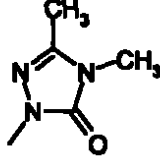
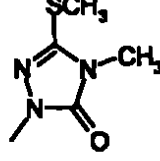
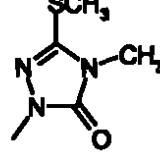
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-39	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,28 ^{a)}
II-40	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,45 ^{a)}
II-41	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,17 ^{a)}
II-42	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,78 ^{a)}
II-43	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,44 ^{a)}
II-44	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,75 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-45	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,46 ^{a)}
II-46	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,79 ^{a)}
II-47	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,06 ^{a)}
II-48	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,49 ^{a)}
II-49	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,59 ^{a)}
II-50	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,64 ^{a)}

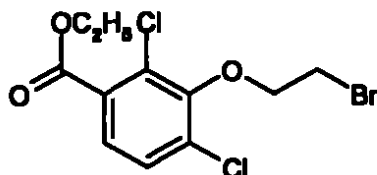
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-51	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,22 ^{a)}
II-52	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,37 ^{a)}
II-53	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(S- Enantiomer) logP = 2,17 ^{a)}
II-54	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(S- Enantiomer) logP = 1,31 ^{a)}
II-55	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(S- Enantiomer) logP = 2,35 ^{a)}
II-56	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(S- Enantiomer) logP = 1,44 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-57	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S- Enantiomer) logP = 1,95 ^{a)}
II-58	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(S- Enantiomer) logP = 1,39 ^{a)}
II-59	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S- Enantiomer) logP = 2,18 ^{a)}
II-60	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(S- Enantiomer) logP = 1,55 ^{a)}
II-61	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S- Enantiomer) logP = 2,15 ^{a)}
II-62	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(S- Enantiomer)
II-63	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(S- Enantiomer)

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-64	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	CH ₃	(S- Enantiomer) $n_D^{20} = -20,4$ $\log P = 2,01$ ^{a)}
II-65	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(S- Enantiomer) $\log P = 1,42$ ^{a)}
II-66	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	$\log P = 2,33$ ^{a)}
II-67	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	$\log P = 1,81$ ^{a)}
II-68	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	$\log P = 2,23$ ^{a)}
II-69	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	$\log P = 2,07$ ^{a)}

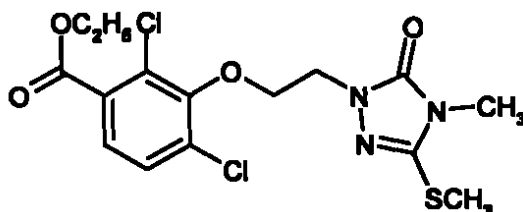
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ²	(Position) (R ³) _n	(Position OAR ⁴) R ⁴	R	Physikal. Daten
II-70	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	logP = 1,36 ^{a)}
II-71	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-72	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	
II-73	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-74	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	

Die in Tabelle 2 als Beispiel (II-35) aufgeführte Verbindung kann beispielsweise wie folgt hergestellt werden:

Beispiel (II-35)Stufe 1

- 5 Zu einer Lösung von 15 g (68 mMol) 2,4-Dichlor-3-hydroxy-benzoesäure-ethylester in 80 ml N,N-Dimethyl-formamid gibt man nach einander 19 g (137 mMol) Kaliumcarbonat (Pulver), 38,6 g (205 mMol) 1,2-Dibrom-ethan und 0,4 g Natriumiodid. Man erhitzt die Mischung 2 Stunden auf 80°C, lässt sie anschließend auf Raumtemperatur abkühlen und schüttelt sie dann mit 350 ml Diethylether. Die organische
- 10 Phase wird mit Wasser, mit 10 %iger Natronlauge und schließlich mit 10 %iger Salzsäure gewaschen, dann mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

- 15 Man erhält 22,2 g (95 % der Theorie) 2,4-Dichlor-3-(2-brom-ethoxy)-benzoesäure-ethylester als öligen Rückstand ($\log P = 3,98^b$).

Stufe 2

- 20 Zu einer Lösung von 18 g (93 mMol) 2,4-Dichlor-3-(2-brom-ethoxy)-benzoesäure-ethylester in 100 ml N,N-Dimethyl-formamid gibt man nach einander 14,6 g (106 mMol) Kaliumcarbonat (Pulver), 19,3 g (133 mMol) 3-Methylthio-4-methyl-1,2,4-triazolin-5-on und 0,5 g Natriumiodid. Man erhitzt die Mischung 4 Stunden auf 80°C, kühlt anschließend auf Raumtemperatur ab, schüttelt mit 400 ml Dichlormethan, wäscht die organische Phase mit Wasser, dann mit 10 %iger Natronlauge
- 25 und schließlich mit 10 %iger Salzsäure, trocknet dann mit Natriumsulfat und filtriert.

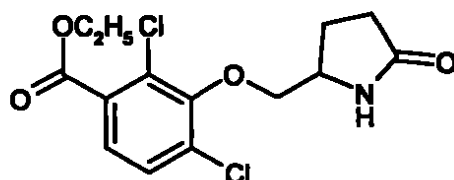
Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

5 Man erhält 17,7 g (82 % der Theorie) 2,4-Dichlor-3-[2-(3-methylthio-4-methyl-5-oxo-1,2,4-triazolin-1-yl)-ethoxy]-benzoesäure-ethylester als öligen Rückstand ($\log P = 2,66^a$).

Die in Tabelle 2 als Beispiel (II-61) aufgeführte Verbindung kann beispielsweise wie folgt hergestellt werden:

10

Beispiel (II-61)



15 Eine Mischung aus 2,0 g (8,5 mMol) 2,4-Dichlor-3-hydroxy-benzoesäure-ethylester, 3,6 g (12,75 mMol) (S)-(+)-5-(p-Tolylsulfonyloxymethyl)-pyrrolidin-2-on, 2,3 g (17 mMol) Kaliumcarbonat und 30 ml Acetonitril wird 13 Stunden bei 76°C geführt, nach Abkühlen auf Raumtemperatur mit Wasser auf etwa das doppelte Volumen verdünnt und mit Methylenchlorid geschüttelt. Die organische Phase wird mit gesättigter wässriger Natriumchlorid-Lösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

20

Man erhält 2,6 g (92 % der Theorie) (S)-2,4-Dichlor-3-[(2-oxo-pyrrolidin-5-yl)-methoxy]-benzoesäure-ethylester ($\log P = 2,14^a$).

379 in

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 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.

15 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.

20

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)

25 100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 und 11 bei weitgehend guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

30

Beispiel B

Post-emergence-Test

- 5 **Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton**
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man
 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die ange-
 gebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die ge-
 wünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von
 5-15 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.

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

Es bedeuten:

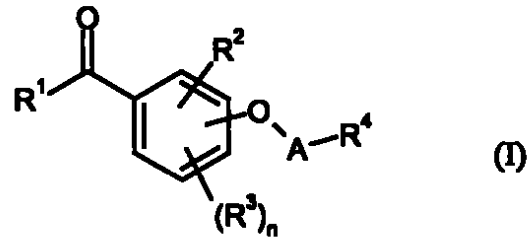
0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel
1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 und 13 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber
Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche:

1. Substituierte Arylketone der allgemeinen Formel (I)



5

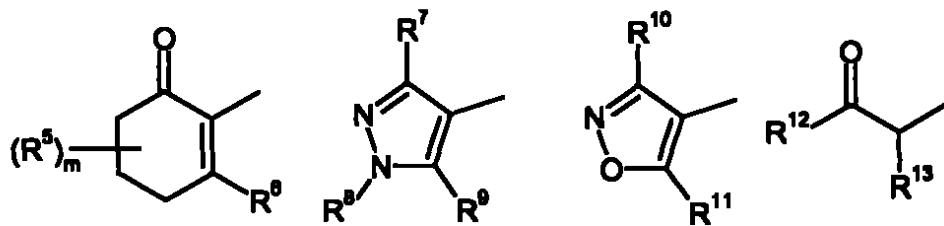
in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

10

A für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R¹ für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



15

wobei

m für die Zahlen 0 bis 6 steht,

20

R⁵ für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylthio oder Aryl steht, oder - für den Fall, daß m für 2 steht - gegebenenfalls auch zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Alkandiyl (Alkylen) steht,

- 5 **R⁶** für Hydroxy, Formyloxy, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Aryloxy, Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl steht,
- 10 **R⁷** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkoxycarbonyl oder Cycloalkyl steht,
- 15 **R⁸** für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,
- 20 **R⁹** für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder Arylsulfonyloxy steht,
- 25 **R¹⁰** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl steht,
- 30 **R¹¹** für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl steht,

- 5 R^{12} für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl steht, und
- R^{13} für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl steht,
- 10 R^2 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,
- 15 R^3 für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und
- 20 R^4 für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein oder zwei Sauerstoffatome oder ein oder zwei Schwefelatome, oder eine oder zwei SO-Gruppierungen oder eine oder zwei SO₂-Gruppierungen) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O)
- 25 und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,
- 30 - einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) -.

2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

n für die Zahlen 0 oder 1 steht,

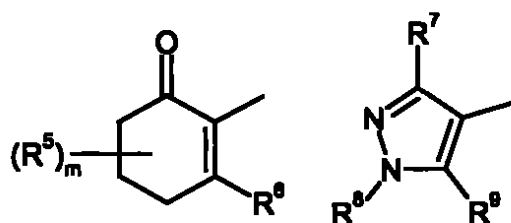
5

m für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

A für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10

R¹ für eine der nachstehenden Gruppierungen steht,



15

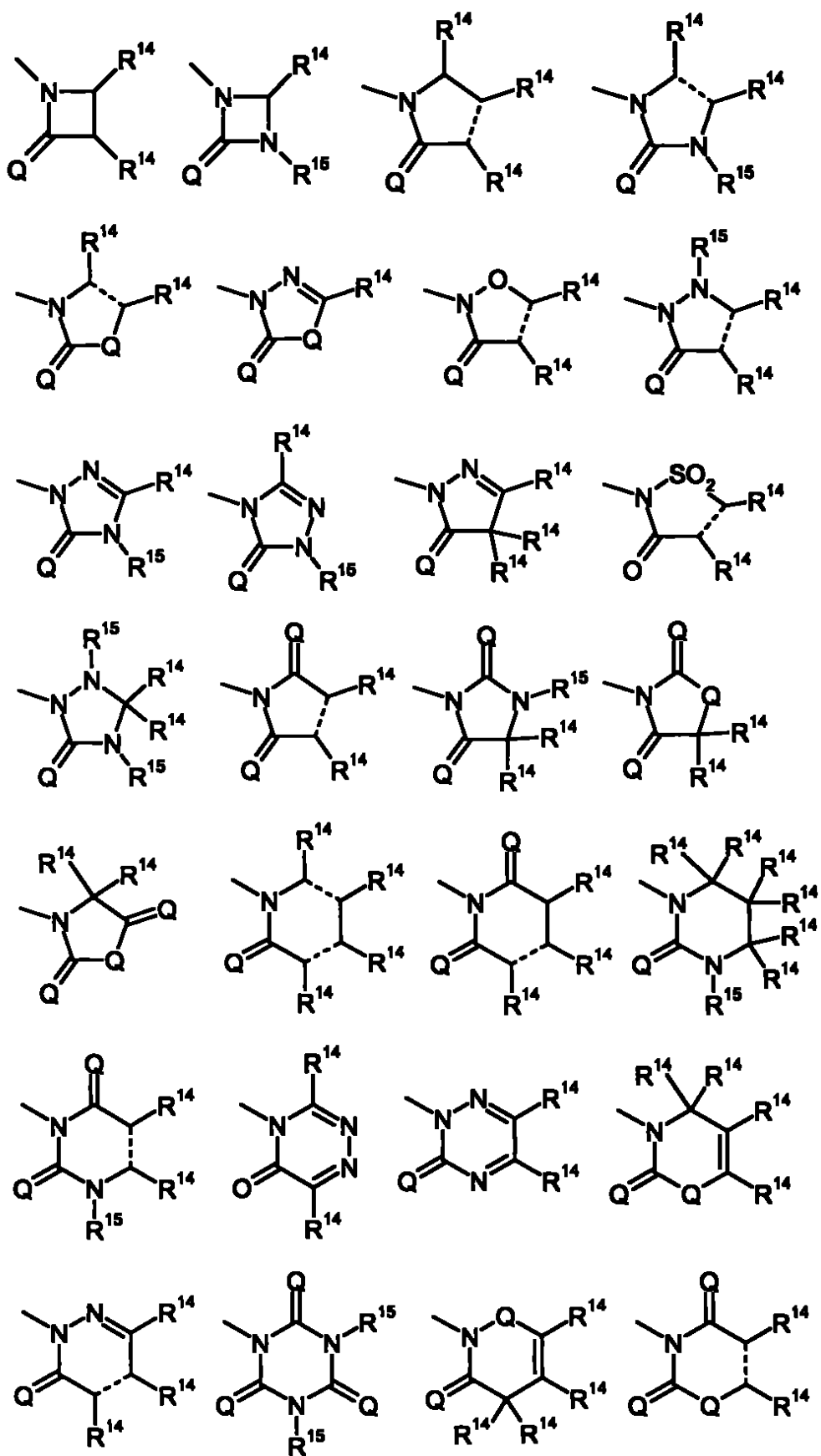
R² für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

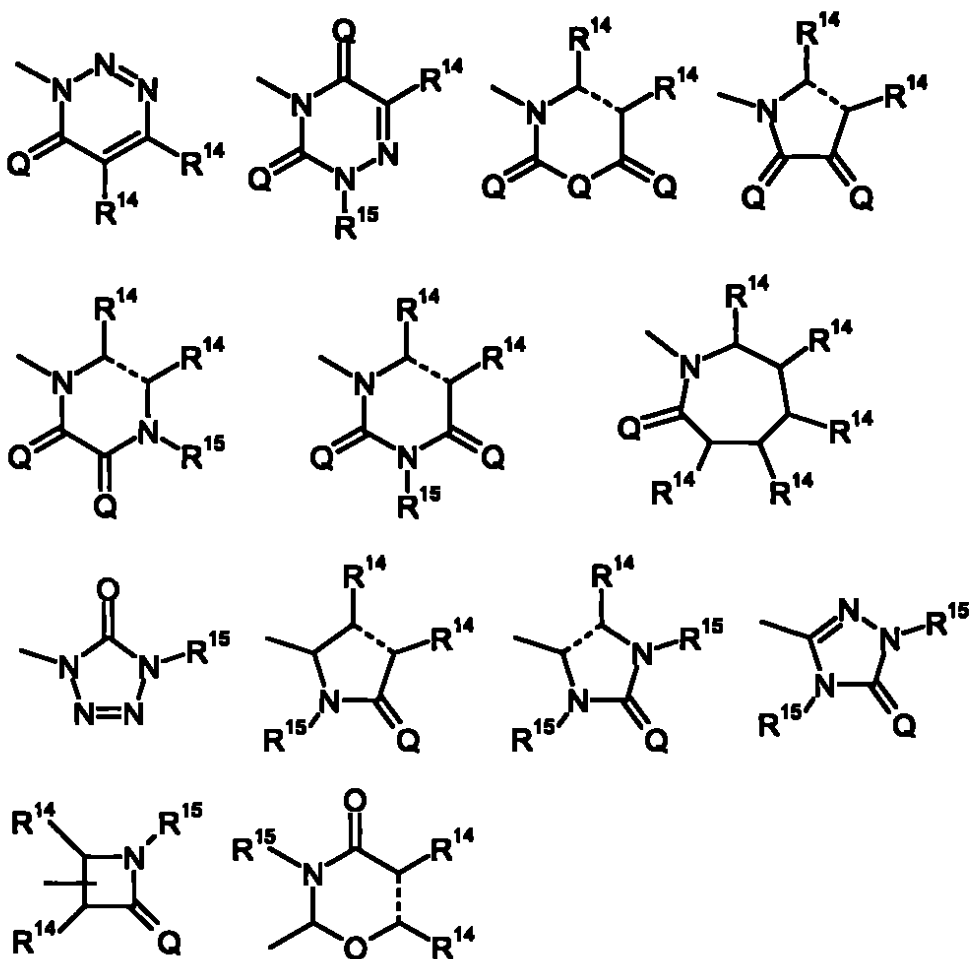
20

R³ für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

25

R⁴ für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht,





5

worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10

R^{14} für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch

15

- 5 Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio
oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den
Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch
Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio,
10 Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkyl-
alkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoff-
atomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Koh-
lenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch
Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl,
15 Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio
oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino
steht, oder – für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R¹⁴ und R¹⁴ sich
an einer Doppelbindung befinden – auch zusammen mit dem benach-
barten Rest R¹⁴ für eine Benzogruppierung steht, und
- 20 R¹⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Koh-
lenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder
C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkyl-
amino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in
den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen sub-
stituiertes Alkenyl, Alkynyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6
Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyl-
alkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in
25 den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoff-
atomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen,
C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl
steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R¹⁴ oder R¹⁵ für
gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Alkan-
30 diyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die einzelnen Reste R^{14} und R^{15} – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können,

- 5 R^5 für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch -
10 für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R^5 für Alkandiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- R^6 für Hydroxy, Formyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylthio,
Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyloxy,
15 Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy substituiertes Aryloxy,
20 Arylthio, Arylsulfinyl, Arylsulfonyl, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy, Arylsulfonyloxy, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylsulfinyl oder Arylalkylsulfonyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- 25 R^7 für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder
30 Alkoxy carbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-

gruppen, oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

5 **R⁸** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 10 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Aryl oder Arylalkyl mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

20 **R⁹** für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkoxy, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy oder Alkylsulfonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano oder Halogen substituiertes Alkenyloxy oder Alkynyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Arylalkoxy, Arylcarbonyloxy, Arylcarbonylalkoxy oder 25 Arylsulfonyloxy mit jeweils 6 oder 10 Kohlenstoffatomen in der Arylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

30 **R¹⁰** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy

substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

5 R^{11} für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

10 R^{12} für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und

15 R^{13} für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht.

20

3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass

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

25

A für Methylen, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Ethan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,2-diyl, Butan-1,3-diyl oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

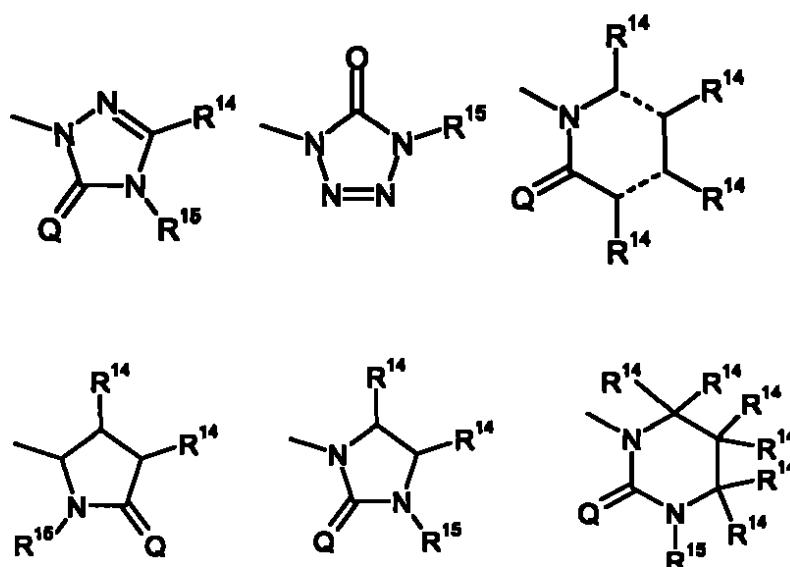
30

R^2 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor

5 und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für 10 Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

15 R^3 für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, 20 Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht, 25

R^4 für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht,



R⁵ für 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Methoxy substituiertes Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

R⁶ für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch

5 Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy, Phenylmethylthio, Phenylmethysulfinyl oder Phenylmethysulfonyl steht,

10 R⁷ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, 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, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, 15 Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

20 R⁸ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, 25 Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, 30

n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

5 **R⁹** für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy steht,

10

15

20 **R¹⁰** für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy 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, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl steht,

25

30 **R¹¹** für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-

Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

- 5 R^{12} für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
- 10 R^{13} für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl steht,
- 15
- 20 R^{14} für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methyl-
- 25
- 30 amino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-

propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino, Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung steht, und

R^{15} für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclo-

397 7

5 butylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils
gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-,
i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes
Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14}
oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl sub-
stituirtes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetra-
methylen) steht.

10 4. Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch
gekennzeichnet, dass

m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

15 A für Methylen oder Dimethylen steht,

20 R^2 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl,
Difluormethyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl,
Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methyl-
sulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy,
Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl,
Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

25 R^3 für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Difluor-
methyl, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy-
methyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonyl-
methyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methyl-
thio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethyl-
sulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

30 R^5 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes
Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-

Propylthio, für Phenyl, oder gegebenenfalls auch - für den Fall, daß m für 2 steht - zusammen mit einem zweiten Rest R⁵ für Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht,

5

R⁶ für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy, Phenylsulfonyloxy, Phenylmethoxy Phenylmethylthio, Phenylmethylsulfinyl oder Phenylmethylsulfonyl steht,

10

15

20

R⁷ für Wasserstoff, Cyano, 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, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,

25

30

R⁸ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl,

5 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht,

10 R⁹ für Hydroxy, Formyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, für Propenyloxy oder
15 Propinyloxy, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenylmethoxy, Benzoyloxy, Benzoylmethoxy oder Phenylsulfonyloxy steht,

20 R¹⁰ für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl steht,

30 R¹¹ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl,

400

oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl steht,

5 R¹² für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl steht,

10 R¹³ für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, 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 steht,

15

20 R¹⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylen-sulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl, Propenyloxy, Propenylthio oder Propenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropyloxy, Cyclopropylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy oder Cyclopropylmethylamino, oder für jeweils ge-

25

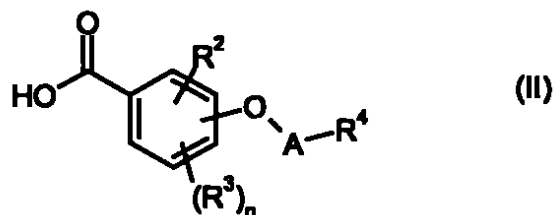
30

gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-propoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino, oder - für den Fall, dass zwei benachbarte Reste R^{14} und R^{14} sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^{14} auch für eine Benzogruppierung steht, und

R^{15} für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für Propenyl oder Propinyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl oder Cyclopropylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^{14} oder R^{15} für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht.

5. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass man

(a) substituierte Benzoesäuren der allgemeinen Formel (II)



in welcher

n, A, R², R³ und R⁴ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

- oder reaktionsfähige Derivate hiervon, wie z.B. entsprechende Säurehalogenide, Säurecyanide oder Ester -

5

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



10

in welcher

R¹ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat,

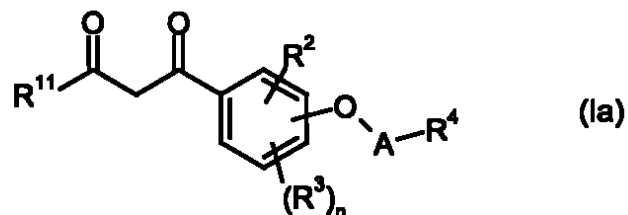
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder dass man

20

(b) substituierte Benzoylketone der allgemeinen Formel (Ia)



in welcher

25

n, A, R², R³, R⁴ und R¹¹ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

mit einem Orthoameisensäureester oder mit einem N,N-Dimethyl-formamid-acetal oder mit einem Cyanoameisensäureester oder mit Carbondisulfid und einem Alkylierungsmittel, und anschliessend mit Hydroxylamin oder einem Säureaddukt hiervon

5

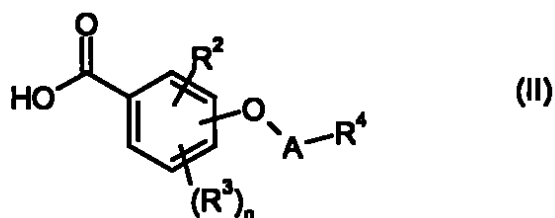
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

10

und gegebenenfalls im Anschluss an die Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) oder (b) an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise Substitutions-, Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt und/oder die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auf übliche Weise in salzartige Verbindungen überführt.

15

6. Verbindungen der Formel (II)



20

in welcher

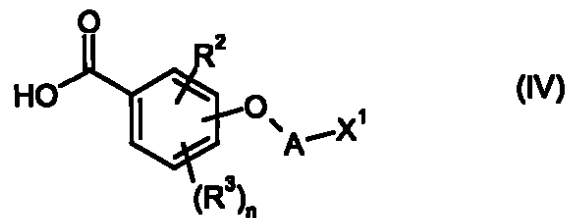
n , A , R^2 , R^3 und R^4 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

sowie deren reaktionsfähige Derivate.

25

7. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen der Formel (II) gemäß Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, dass man

(α) Verbindungen der Formel (IV)



5

in welcher

n , A , R^2 und R^3 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

X^1 für Halogen oder für Alkylsulfonyloxy steht,

10

- oder auch ihre Derivate -

mit heterocyclischen Verbindungen der allgemeinen Formel (V)

15



in welcher

R^4 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat,

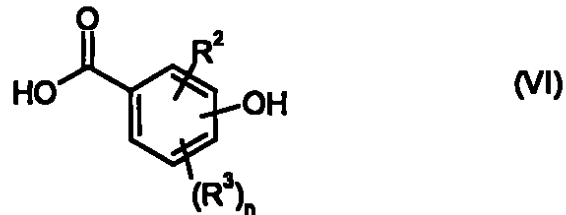
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels bei Temperaturen zwischen 10°C und 150°C umsetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt,

25

oder dass man

(β) Verbindungen der Formel (VI)



5

in welcher

n , R^2 und R^3 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

- oder auch ihre Derivate -

10

mit Hydroxyalkylheterocyclen der allgemeinen Formel (VII)



15

in welcher

A und R^4 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

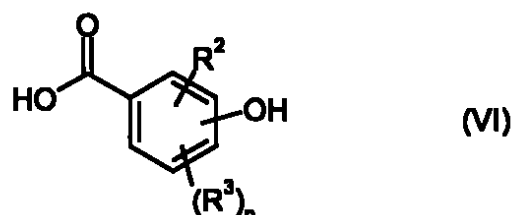
20

in Gegenwart von Kondensationshilfsmitteln und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels bei Temperaturen zwischen -20°C und $+50^\circ\text{C}$ umsetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt,

25

oder dass man

(γ) Verbindungen der Formel (VI)



5

in welcher

n , R^2 und R^3 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

- oder auch ihre Derivate -

10

mit Halogenalkylheterocyclen der allgemeinen Formel (VIII)



15

in welcher

A und R^4 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

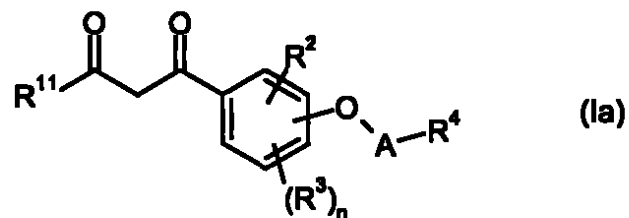
X^2 für Halogen, für Alkylsulfonyloxy oder für Arylsulfonyloxy steht,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C umsetzt und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise weitere Umwandlungsreaktionen durchführt.

25

8. Verbindungen der Formel (Ia)



5 in welcher

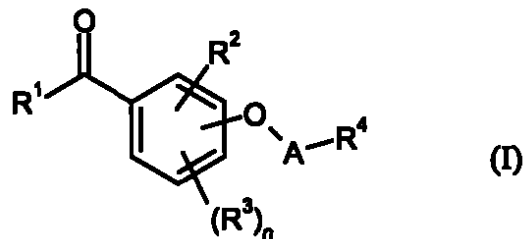
n, A, R², R³, R⁴ und R¹¹ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

9. Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4.
10. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 oder von Mitteln gemäß Anspruch 9 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen.
11. Verfahren zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man mindestens eine Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 oder Mittel gemäß Anspruch 9 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

Substituierte Arylketone

Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte Arylketone der allgemeinen Formel (I)

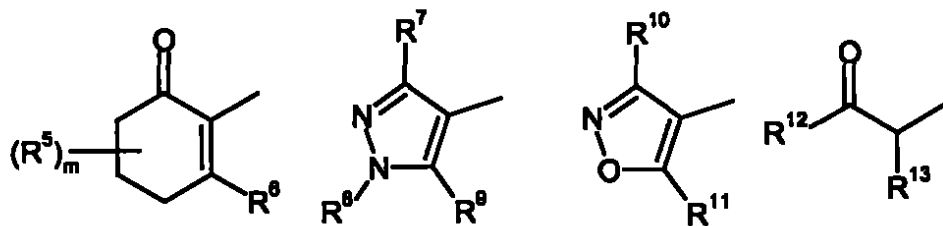


in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

A für Alkandiyl (Alkylen) steht,

R¹ für eine der nachstehenden Gruppierungen steht



wobei

m, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² und R¹³ eine der in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

R³ für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und

R⁴ für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht,

sowie Verfahren zu deren Herstellung, Zwischenprodukte und die Verwendung dieser Verbindungen als Herbizide.

TRADUCCION: Se traduce la carátula, la descripción y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Alemana No. 100 39 723.9 escrita en Alemán, para el invento denominado: **ARILCETONAS SUBSTITUIDAS**

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

(emblema)

CERTIFICADO DE PRIORIDAD REFERENTE A LA PRESENTACION DE UNA SOLICITUD DE PATENTE

Expediente No. : 100 39 723.9 ✓
Fecha de presentación : 14 DE AGOSTO DE 2000 ✓
Nombre del Solicitante : BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
Leverkusen/Alemania
NIHON BAYER AGROCHEM K.K.
Tokio/Japón :
Título del Invento : **ARILCETONAS SUBSTITUIDAS**
Clasificación : C07D, A01N

Las piezas anexas son una reproducción fiel y exacta de la documentación original de esta solicitud.

Munich, el día 13 de Noviembre de 2000
OFICINA ALEMANA DE PATENTES Y MARCA
El Presidente
Por Delegación

((firma ilegible))

Weihmayr

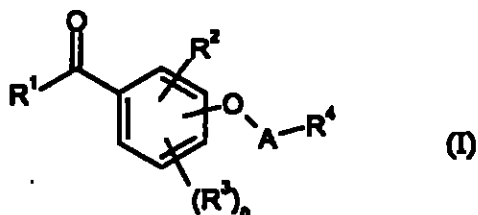
Cinta tricolor y Sello de Oblea

ARILCETONAS SUBSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas arilcetonas substituidas, a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se sabe ya que determinadas arilcetonas substituidas tienen propiedades herbicidas (véanse las EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, EP-A-352543, EP-A-418175, EP-A-487357, EP-A-527036, EP-A-527037, EP-A-560483, EP-A-609797, EP-A-609798, EP-A-625505, EP-A-625508, EP-A-636622, US-A-5804532, US-A-5834402, US-A-5846906, US-A-5863865, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328). El efecto de estos compuestos sin embargo no es satisfactorio desde todos los puntos de vista.

Se han encontrado ahora las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I)

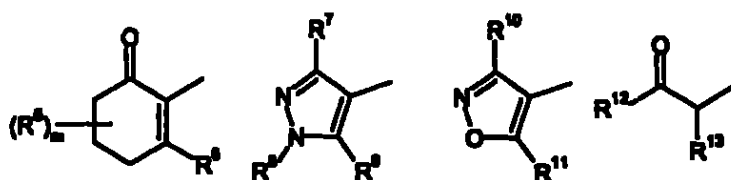


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquilenos),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

- m** significa los números 0 hasta 6,
- R⁴** significa halógeno o significa alquilo, alquiltio o arilo substituidos respectivamente en caso dado, o -en el caso en que m signifique 2- significa en caso dado también junto con un segundo resto R⁵ alcanodiilo (alquileo),
- R⁶** significa hidroxí, formiloxi, halógeno, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁷** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxycarbonilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁸** significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁹** significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹⁰** significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o

alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R¹¹ significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

R¹² significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R⁴ significa un agrupamiento heterocíclico, monocíclico o bicíclico, saturado o insaturado, con 4 a 12 miembros, en caso dado substituido, que contiene de 1 a 4 heteroátomos (hasta 4 átomos de nitrógeno y en caso dado -alternativa o adicionalmente- 1 o 2 átomos de oxígeno y 1 o 2 átomos de azufre, o uno o dos agrupamientos SO- o uno o dos agrupamientos SO₂-), y que contiene además de uno hasta tres grupos oxo (C=O) y/o grupos tioxo (C=S) como componentes del heterociclo,

-con inclusión de todas las formas tautómeras posibles de los compuestos de la fórmula general (I) y de las sales o bien aductos con ácido o con bases posibles de los compuestos de la fórmula general (I)-.

En las definiciones las cadenas hidrocarbonadas, tales como alquilo o

alcanodiilo -incluso en combinación con heteroátomos, como en el alcoxi- son respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los compuestos según la invención de la fórmula general (I) contienen en caso dado uno o varios átomos de carbono substituidos de manera asimétrica y por lo tanto pueden presentarse en diversas formas enantiómeras (formas con la configuración R y S) o bien diastereómeras. La invención se refiere tanto a las diversas formas posibles enantiómeras o bien estereoisómeras individuales de los compuestos de la fórmula general (I) así como también a las mezclas de estos compuestos estereoisómeros.

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

Preferentemente,

n significa los números 0 o 1.

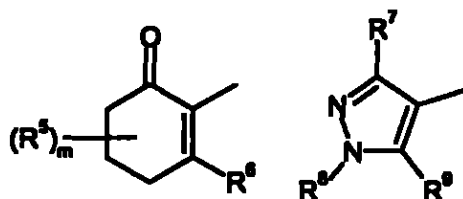
Preferentemente,

m significa los números 0, 1, 2, 3 o 4.

Preferentemente,

A significa alcanodiilo (alquilenos) con 1 a 6 átomos de carbono,

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



Preferentemente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo

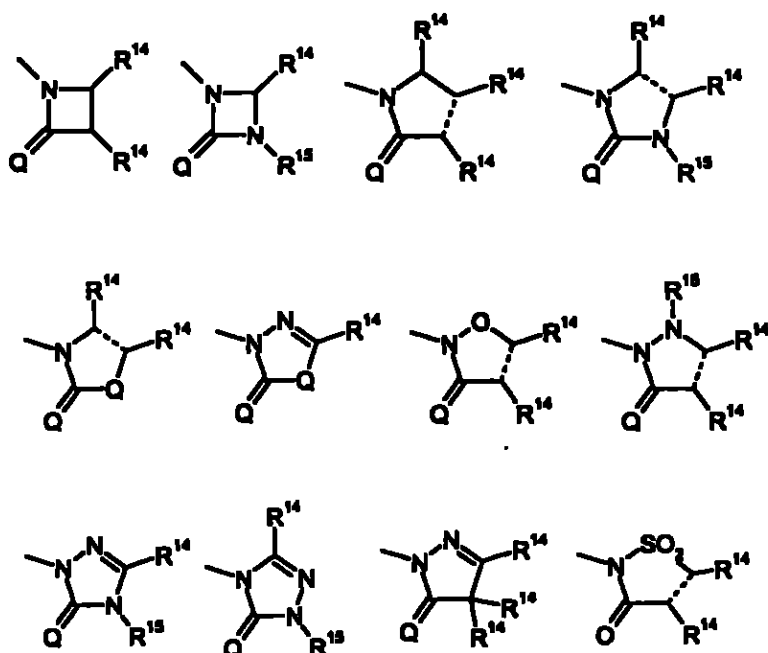
respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, sustituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

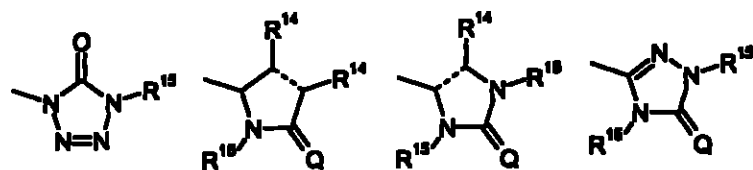
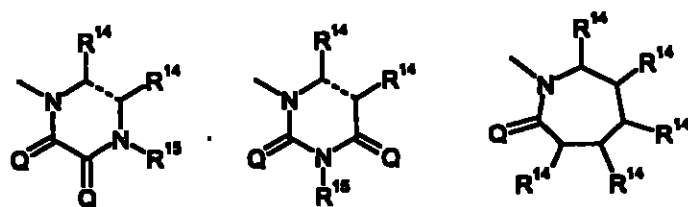
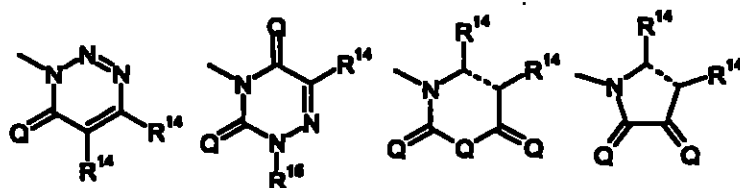
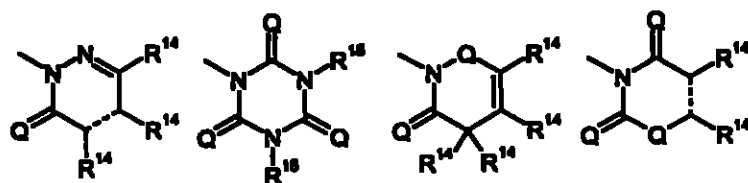
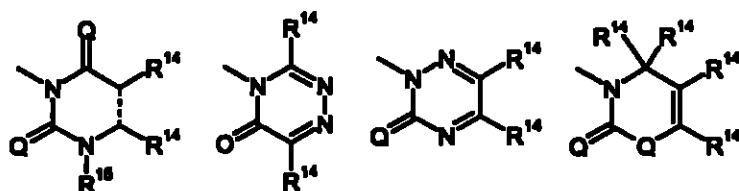
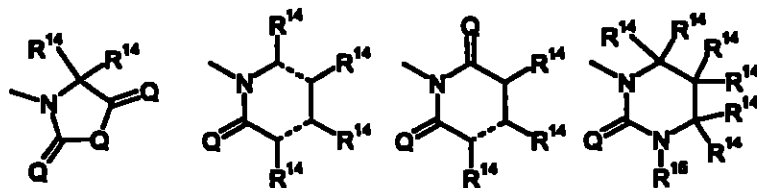
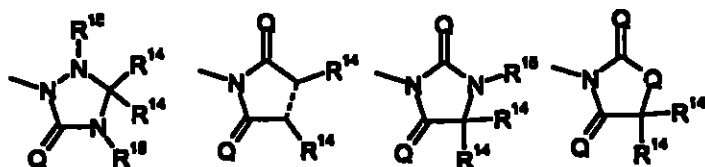
Preferentemente,

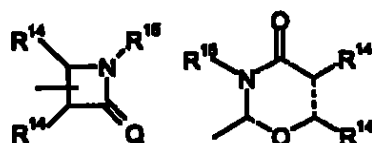
R^3 significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, sustituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R^4 significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes







siendo el enlace dibujado con trazos discontinuos respectivamente un enlace sencillo o un enlace doble,

Q significa oxígeno o azufre,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilamino o dialquilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que dos restos

contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa también junto con el resto R^{14} contiguo un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, alquilidenamino con hasta 4 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino o alcanoilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alquinilo o alqueniloxi respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa alcanodiilo con 3 hasta 5 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} —en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior.

Preferentemente,

R^5 significa halógeno, significa alquilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o en caso dado también

-en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R³ significa alcanodiilo (alquileno) con 2 hasta 6 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁶ . significa hidroxí, formiloxi, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alquéniloxi o alquíniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfo-niloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcóxicarbonilo respectivamente con 1 hasta 6 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 significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con

1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹⁰ . significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, o po alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹² significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos respecti-vamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

m significa los números 0, 1, 2 o 3.

De forma especialmente preferente,

A significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), etano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma especialmente preferente,

R² significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosulfo-nilo o dietilaminosulfonilo.

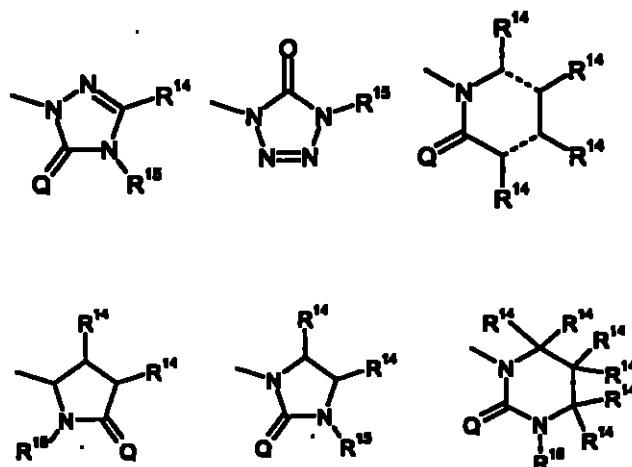
De forma especialmente preferente,

R³ significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-

propilsulfinilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilaminosul-fonilo o dietilaminosulfinilo.

De forma especialmente preferente,

R^4 significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes



De forma especialmente preferente,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo o por metoxi, o significa en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R^5 etano-1,2-diilo (dimetileno) propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma especialmente preferente,

R^6 significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfinilo,

etilsulfonilo, n- o i-propil-sulfonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilamino-carboniloxi, etil-aminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsul-foniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenoxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benciloxi, bencilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenil-metoxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtilo o por trifluórmtilo.

De forma especialmente preferente,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etil-sulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo 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 bromo, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

R⁸ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro,

por bromo, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexil-metilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi o por trifluórmtoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁹ significa hidroxí, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o t-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfonil-oxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi o por trifluórmtoxi.

De forma especialmente preferente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamóilo, tiocarbamóilo, flúor, cloro, bromo,

o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirol, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, meto-xicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma especialmente preferente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metil-sulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino o di-i-propilamino, significa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropil-amino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetoxi, ciclo-butilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilmetiltio, ciclo-butilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilmetilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por

428 33

etoxi, por n- o i-propoxi, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o - en el caso en que los restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo.

De forma especialmente preferente,

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i- o s-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo o propenilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

A significa metileno o dimetileno.

De forma muy especialmente preferente,

m significa los números 0, 1 o 2.

De forma muy especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluormetilo, trifluormetilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiommetilo, metilsulfinilmetilo, metilsulfonilmetilo, metoxi, etoxi,

difluor-metoxi, trifluormetoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsul-fonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

R³ . significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluormetilo, trifluormetilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiomatilo, metilsulfinilmetilo, metilsulfonilmetilo, metoxi, etoxi, difluormetoxi, trifluor-metoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsul-fonilo o dimetilaminosulfonilo.

De forma muy especialmente preferente,

R³ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa fenilo, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto **R³** significa etano-1,2-diilo (dimetileno), propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno).

De forma muy especialmente preferente,

R⁶ significa hidroxil, formiloxil, significa metoxil, etoxil, n- o i-propoxil, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsul-fonilo, acetiloxil, propioniloxil, n- o i-butirolil, metoxicarboniloxil, etoxicarboniloxil, n- o i-propoxicarboniloxil, metilaminocarboniloxil, etilaminocarboniloxil, n- o i-propilaminocarboniloxil, metilsulfoniloxil, etilsulfo-niloxil, n- o i-propilsulfoniloxil substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxil o por etoxil, significa propeniloxil o propiniloxil, o significa fenoxil, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benzoiloxil, benzoil-metoxil, fenilsulfoniloxil, fenilmetoxil, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluormetilo, por metoxil, por etoxil, por n- o i-propoxil, por

difluórmetoxi o por trifluórmetoxi.

De forma muy especialmente preferente,

- R⁷** significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

- R⁸** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmeto, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmetoxi o por trifluórmetoxi.

De forma muy especialmente preferente,

- R⁹** significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenil-sulfoniloxi substituidos respectivamente en

caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo.

De forma muy especialmente preferente,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o 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 substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, 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, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, propenilo, propeniltio o propenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclopropilo, ciclopropilamino, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi o ciclopropilmetiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, fenilo, feniltio, fenilamino, bencilo, bencilo, bencilo o bencil-amino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o -en el caso en que dos restos contiguos R¹⁴ y R¹⁴ se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R¹⁴ contiguo también un agrupamiento benzo.

De forma muy especialmente preferente,

R¹⁵ significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo, significa ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopropilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso

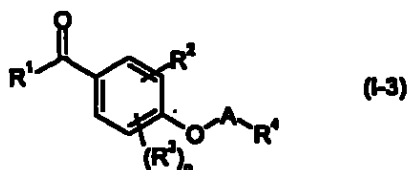
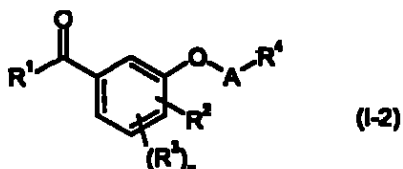
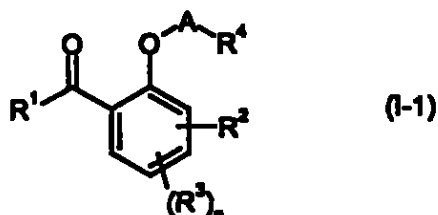
dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

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

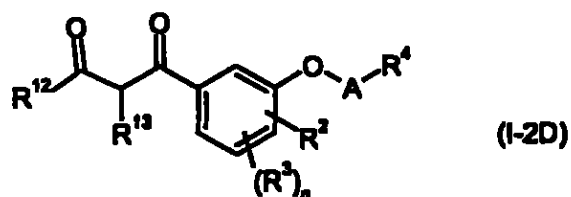
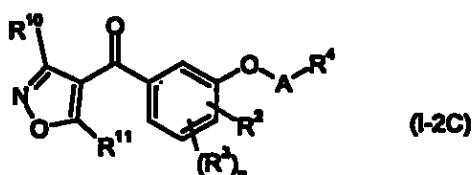
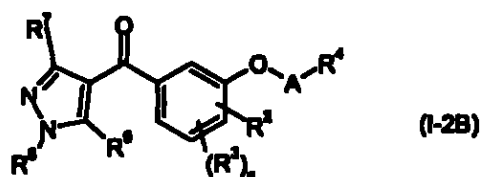
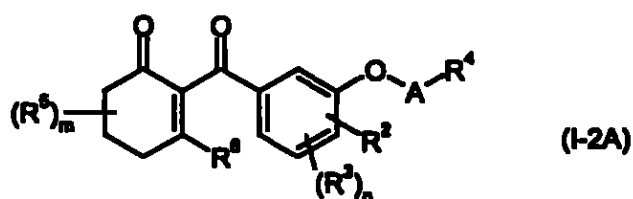
Según la invención son muy especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

Se señalarán especialmente los compuestos de las fórmulas generales (I-1) hasta (I-3):



en este caso n, A, R¹, R², R³ y R⁴ tienen respectivamente los significados mas preferentes.

Se señalarán de forma muy especial los compuestos de las fórmulas generales (I-2A) hasta (I-2D):



en este caso m, n, A, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ tienen respectivamente el significado mas preferente.

El objeto de la invención son también las sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio de

los compuestos de la fórmula (I), en la que preferentemente n , A , R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados indicados anteriormente como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes.

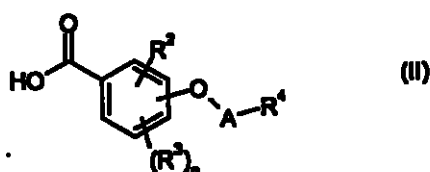
Las definiciones de los restos dadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los correspondientes productos de partida o productos intermedios necesarios para la obtención.

Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Las nuevas arilcetonas sustituidas de la fórmula general (I) se caracterizan por una actividad herbicida potente y selectiva.

Se obtienen las nuevas arilcetonas sustituidas de la fórmula general (I), si

(a) Se hacen reaccionar ácidos benzoicos sustituidos de la fórmula general (II)



en la que

n , A , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado anteriormente indicado,

-o derivados reactivos de los mismos, tal como por ejemplo los correspondientes halogenuros de acilo, cianuros de acilo o ésteres-
con compuestos de la fórmula general (III)



en la que

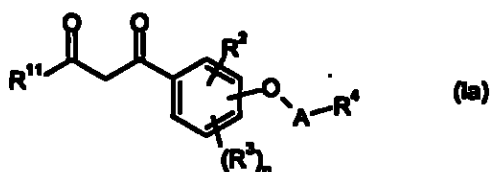
R^1 tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante, en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de un

diluyente,

o si

(b) se hacen reaccionar benzoilcetonas substituidas de la fórmula general (Ia)



en la que

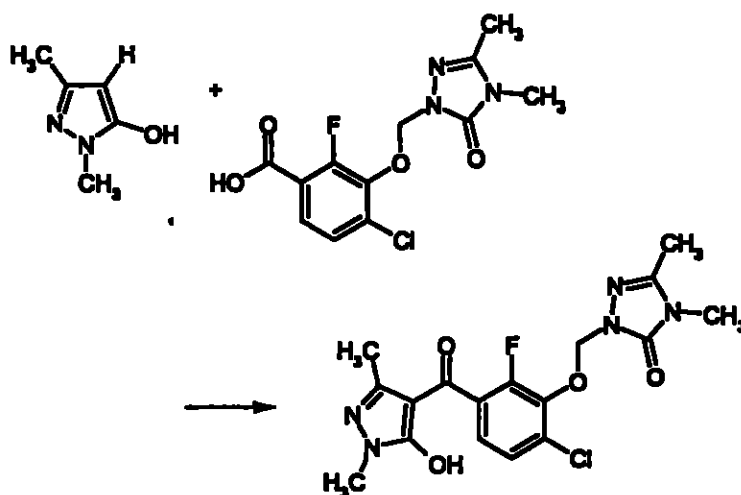
n, A, R², R³, R⁴ y R¹¹ tienen el significado anteriormente indicado,

con un éster del ácido ortofórmico o con un N,N-dimetil-formamida-acetal o con un éster del ácido cianofórmico o con disulfuro de carbono (carburo de azufre) y con un agente de alquilación, y a continuación con hidroxilamina o con un aducto con ácido de la misma,

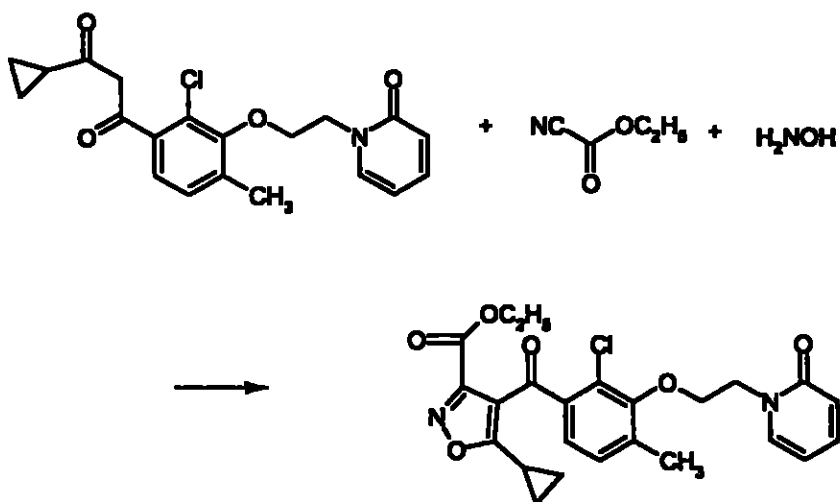
en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y en caso dado después de la realización de los procedimientos según la invención (a) o (b) se llevan a cabo en los compuestos, así obtenidos, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual, reacciones de substitución, de oxidación o de reducción y/o los compuestos de la fórmula general (I) se transforman de manera usual en los compuestos de tipo salino.

Si se emplean, por ejemplo, el ácido 4-cloro-3-[(3,4-dimetil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-metoxi]-2-flúor-benzoico y 1,3-dimetil-5-hidroxi-pira-zol como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Si se emplean, por ejemplo, la 1-[2-cloro-4-metil-3-[2-(2-oxo-1(2H)-piridinil)-etoxi]-fenil]-3-ciclopropil-1,3-propanodiona, cianoformiato de etilo e hidroxilamina como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



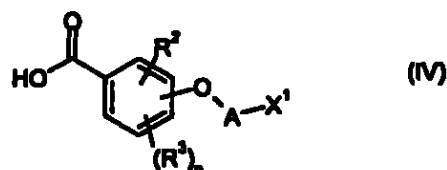
Los ácidos benzoicos substituidos a ser empleados como productos de partida en el procedimiento (a) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), n, A, R², R³ y R⁴ tienen preferentemente

aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para n , A , R^2 , R^3 y R^4 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

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 los nuevos ácidos benzoicos substituidos -o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo- si

(α) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (IV)



en la que

n , A , R^2 y R^3 tienen el significado anteriormente indicado y

X^1 significa halógeno (especialmente significa flúor, cloro o bromo) o significa alquilsulfoniloxi (especialmente metilsulfoniloxi o etilsulfoniloxi),

-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con compuestos heterocíclicos de la fórmula general (V)



en la que

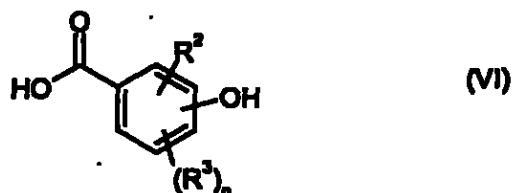
R^4 tiene el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, tal como por ejemplo carbonato de potasio, y, en caso dado, en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo acetona, butanona, acetonitrilo, N,N-dimetil-formamida o dimetilsulfóxido, a

temperaturas comprendidas entre 10°C y 150°C y, en caso dado, a continuación se llevan a cabo otras reacciones de transformación en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual (véanse los ejemplos de obtención),

o si

(β) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n, R² y R³ tienen el significado anteriormente indicado,

-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con hidroxialquilheterociclos de la fórmula general (VII)



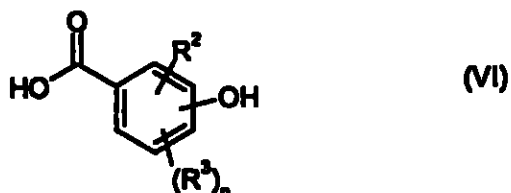
en la que

A y R⁴ tienen el significado anteriormente indicado,

en presencia de agentes auxiliares de la condensación, tales como por ejemplo azodicarboxilato de dietilo y trifenilfosfina, en caso dado en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo tetrahidrofurano, a temperaturas comprendidas entre -20°C y +50°C y, en caso dado, a continuación se llevan a cabo, en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual, otras reacciones de transformación (véanse los ejemplos de obtención),

o si

(γ) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado anteriormente indicado,

-o también sus derivados, tales como sus ésteres, especialmente los ésteres de metilo y de etilo-

con halógenoalquilheterociclos de la fórmula general (VIII)



en la que

A y R^4 tienen el significado anteriormente indicado y

X^2 significa halógeno (especialmente significa flúor, cloro o bromo), significa alquilsulfoniloxi (especialmente metilsulfoniloxi o etilsulfoniloxi), o significa arilsulfoniloxi (especialmente p-tolilsulfoniloxi),

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido, tal como por ejemplo carbonato de potasio o trietilamina y, en caso dado, en presencia de un diluyente tal como por ejemplo acetona, butanona, acetonitrilo, N,N-dimetil-formamida o dimetilsulfóxido, a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de transformación en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual (véanse los ejemplos de obtención).

Los compuestos a ser empleados además como productos de partida en el procedimiento (a) 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^1 tiene preferentemente aquel significado que ya ha sido citado anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para R^1 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula general (III) son compuestos orgánicos conocidos.

Las benzoilcetonas substituidas a ser empleadas como productos de partida en el procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por medio de la fórmula (Ia). En la fórmula general (Ia), n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente para n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula general (Ia) son compuestos nuevos, según la invención; éstos pueden prepararse según el procedimiento (a) de la invención.

El procedimiento (a) según la invención para la obtención de las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de un agente deshidratante. En este caso entran en consideración los productos químicos adecuados usuales para el enlazado del agua.

Como ejemplos a este respecto pueden citarse díciclohexilcarbodiimida y carbonil-bis-imidazol.

Se citará como agente deshidratante adecuado de forma especialmente buena la díciclohexilcarbodiimida.

El procedimiento (a) según la invención para la obtención de las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con

empleo de uno o varios agentes auxiliares de la reacción.

Como ejemplos a este respecto pueden citarse cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianhidrinacetona, 2-ciano-2-(trimetilsililo)-propano y cianuro de trimetilsililo.

Se citará como otro agente auxiliar de la reacción adecuado de una manera especialmente buena al cianuro de trimetilsililo.

El procedimiento (a) según la invención para la obtención de las nuevas arilcetonas substituidas de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de otro agente auxiliar de la reacción. Como otro agente auxiliar de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración en general compuestos orgánicos nitrogenados básicos, tales como por ejemplo trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, 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-diazabicyclo[2,2,2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU).

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de ésteres del ácido ortofórmico o con N,N-dimetil-formamido-acetales. Estos compuestos contienen pre-ferentemente grupos alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, especialmente metilo o etilo. Como ejemplos se citarán ortoformiato de trimetilo, ortoformiato de trietilo, N,N-dimetil-formamido-dimetilacetal y N,N-dimetil-formamido-dietil-acetal.

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de ésteres del ácido cianofórmico. Estos compuestos contienen preferentemente grupos alquilo con 1 a

4 átomos de carbono, especialmente metilo o etilo. Como ejemplos se citarán cianoformiato de metilo y cianoformiato de etilo.

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de (disulfuro de carbono) y (agentes de alquilación). Estos compuestos contienen preferentemente grupos alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono, especialmente metilo o etilo. Como ejemplos se citarán cloruro de metilo, bromuro de metilo, yoduro de metilo, sulfato de dimetilo, cloruro de etilo, bromuro de etilo, yoduro de etilo y sulfato de dietilo.

El procedimiento (b) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo con empleo de hidroxilamina o de un aducto con ácido de la misma. Como aducto con ácido preferente se citará el hidrocloreuro de la hidroxilamina.

Los procedimientos según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se llevan a cabo preferentemente con empleo de diluyentes. Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (b) según la invención entran en consideración 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; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetil-acetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido, alcoholes, tales como

metanol, etanol, n- o i-propanol, etilen-glicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmono-metiléter, dietilen-glicolmonoetiléter.

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (a) y (b) 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.

Los procedimientos (a) y (b) según la invención se llevan a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo los procedimientos 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 de los procedimientos (a) y (b) 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 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 compuestos de las fórmulas (IV), (V), (VI), (VII) y (VIII) a ser empleados como productos de partida en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (II), son compuestos orgánicos conocidos.

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 sustancias, 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-anales.

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 según la invención pueden emplearse también en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación para la lucha contra las plagas animales y contra las enfermedades fúngicas o bacterianas de las plantas. Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las

plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimientos con una o varias capas.

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 clorobenzenos, 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

448
0877-

y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutylcetona, o ciclohexa-nona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsul-fóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molidos, 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 polioxietilenados 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 fosfo-lípidos 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 ferrocianico 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 y/o con productos que mejoren la compatibilidad para con las plantas de cultivo ("protectores") conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque. También son posibles con agentes para combatir las malas hierbas, que contengan uno o varios herbicidas conocidos y un protector.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, BAS-622H, Bepflubutamid, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil(alilo), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinnethylin, 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, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclorprop(-P), 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,
 -metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazon(-
 sodio), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn,
 Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam,
 Flupropacil, Flupyrsulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone,
 Fluroxypyr(-butoxipropilo, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo),
 Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-
 isopropilamonio), Halosafen, Haloxypop(-etoxietilo, -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, Mecoprop,, Mefenacet,
 Mesosulfuron, 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, Picolinafen,
 Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Profluazol, Prometryn, Propachlor,
 Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Procarbazon(-sodio), Propyzamide,
 Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-etilo), Pyrazogyl, Pyrazolate,
 Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol,
 Pyriftalid, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac,
 Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo, -P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine,
 Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate,
 Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn,

Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin , Trifloxysulfuron, Triflusulfuron(-metilo), Tritosulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias 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.

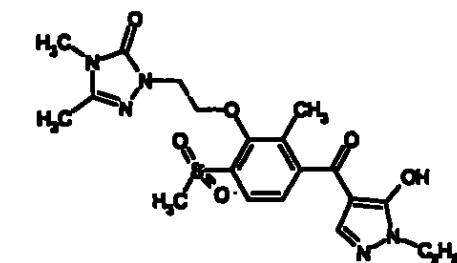
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. Fundamentalmente dependen 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 sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



»»

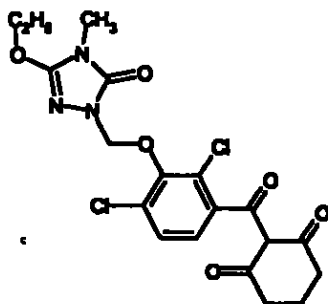
(Procedimiento (a)).

Se añaden a una solución de 1,1 g (2,7 mmoles) de cloruro de 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoilo en 20 ml de diclorometano, sucesivamente, 0,30 g (2,7 mmoles) de 1-etil-5-hidroxipirazol, 0,8 g (8,0 mmoles) de trietilamina y una gota de N,N-dimetil-formamida. Se agita la mezcla aproximadamente durante 24 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C), la solución de la reacción se lava sucesivamente con ácido clorhídrico 1N y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 30 ml de acetonitrilo y se combina, sucesivamente, bajo ligera refrigeración, con 0,28 g (3,3 mmoles) de 2-hidroxi-2-metil-propionitrilo y 1,4 g (14 mmoles) de trietilamina. Se agita durante otras 24 horas a temperatura ambiente, se elimina la parte principal del disolvente al vacío de la trompa de agua y el residuo se disuelve en diclorometano y ácido clorhídrico 1N. La fase orgánica se separa, se lava con agua y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 1,1 g (88 % de la teoría) del 4-{3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etiloxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoil}-1-etil-5-hidroxi-1H-pirazol en forma de residuo oleaginoso.

Log P: 1,23.

Ejemplo 2.



(Procedimiento (a)).

Se disuelven 1,95 g (5,4 mmoles) del ácido 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoico en 75 ml de acetonitrilo y se combinan con 0,61 g de 1,3-ciclohexanodiona (5,4 mmoles) así como con 1,33 g de dicitclohexilcarbodiimida (DCC, 1,2 equivalentes). Al cabo de 15 minutos de agitación a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) se añaden 1,5 ml de trietil-amina (2 equivalentes) y 0,29 ml de cianuro de trimetilsililo (0,4 equivalentes). Al cabo de 2 horas a temperatura ambiente se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua, el residuo se agita con solución acuosa al 10 % de carbonato de sodio y se separa por filtración. El filtrado se sacude con dietiléter y la fase acuosa se acidifica con ácido clorhídrico 2N. El producto precipitado se extrae varias veces con diclorometano, las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y se concentran por evaporación.

Se obtienen 1,3 g (53 % de la teoría) de la 2-[3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoil]-1,3-ciclohexanodiona en forma de resina viscosa.

Log P = 2.52.

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2 así como de acuerdo con la descripción general de los procedimientos de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

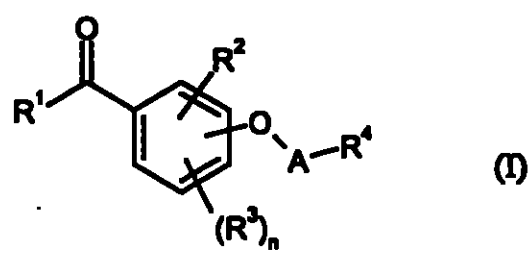
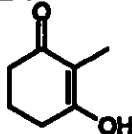
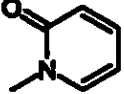
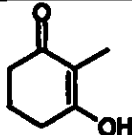
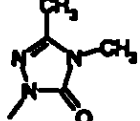
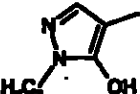
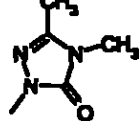
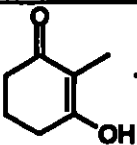
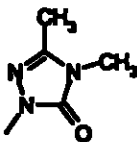
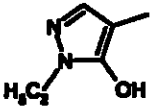
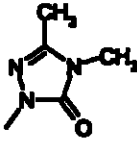
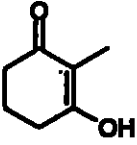
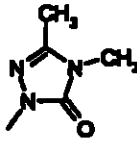
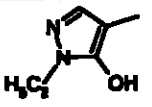
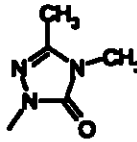
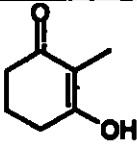
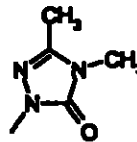
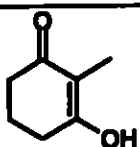
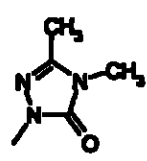
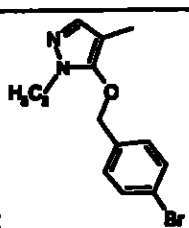
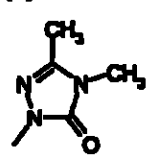
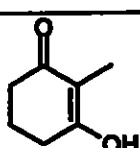
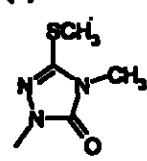
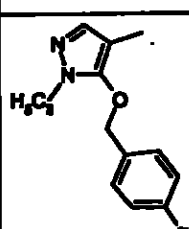
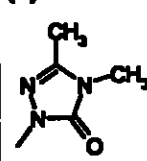
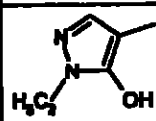
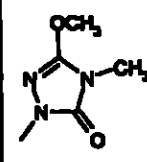
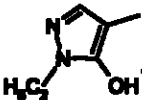
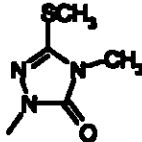
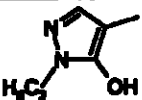
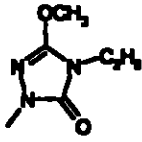
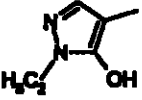
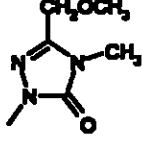
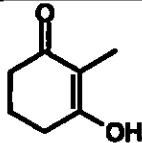
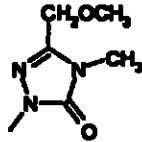
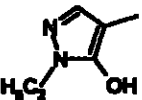
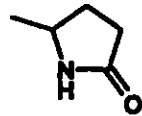
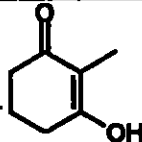
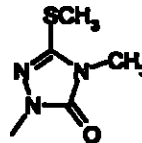


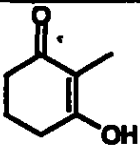
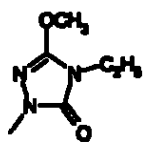
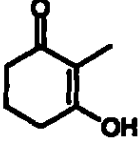
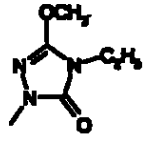
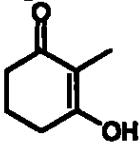
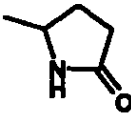
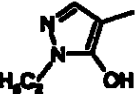
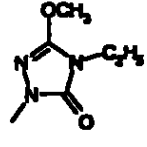
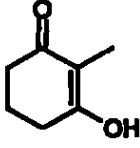
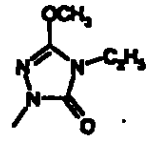
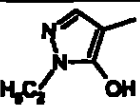
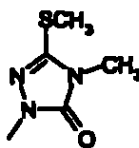
Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I)

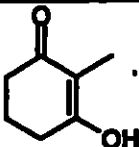
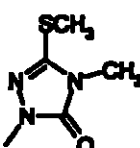
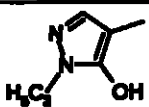
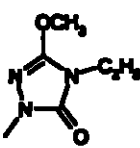
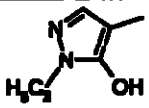
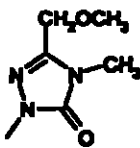
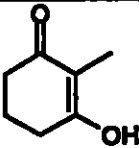
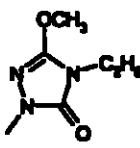
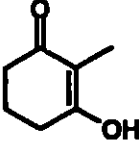
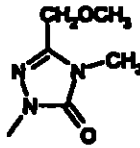
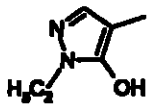
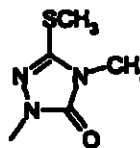
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
3	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
4	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
5	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,52 ^{a)}

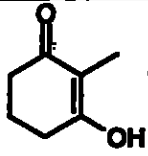
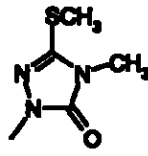
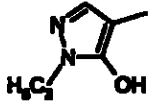
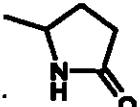
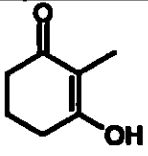
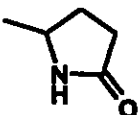
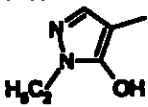
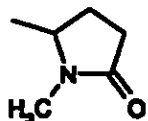
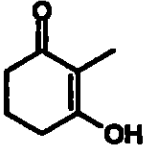
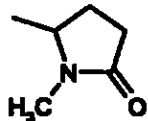
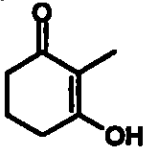
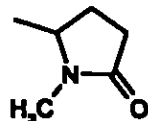
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
6	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{o)}
7	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,68 ^{o)}
8	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,94 ^{o)}
9	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,58 ^{o)}
10	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,91 ^{o)}

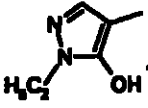
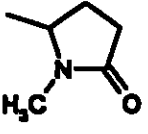
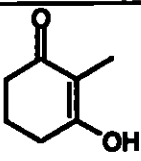
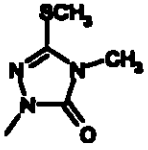
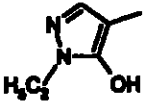
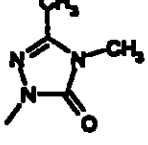
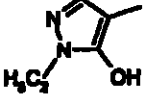
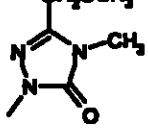
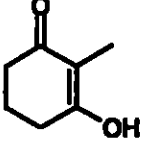
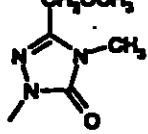
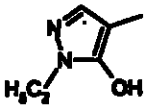
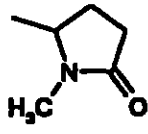
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
11	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	logP = 1,65 ^{a)}
12	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,07 ^{a)}
13	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,44 ^{a)}
14	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}
15	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,69 ^{a)}

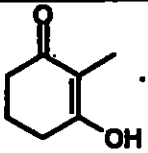
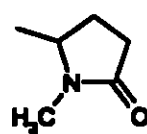
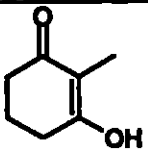
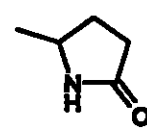
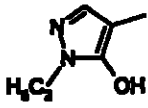
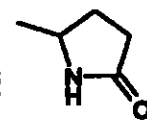
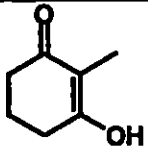
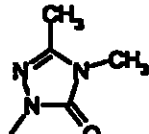
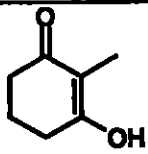
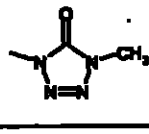
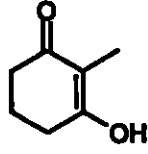
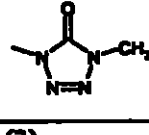
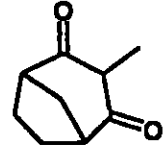
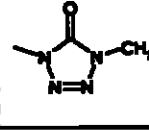
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
16	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,92 ^{a)}
17	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,93 ^{a)}
18	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 1,62 ^{a)}
19	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,06 ^{a)}
20	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,60 ^{a)}
21	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,39 ^{a)}

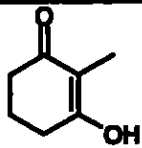
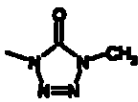
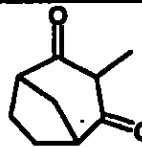
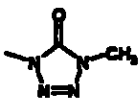
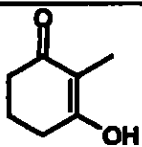
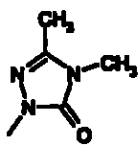
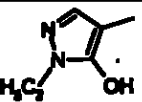
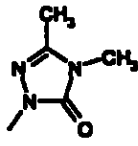
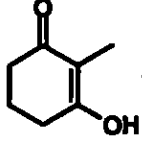
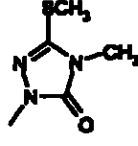
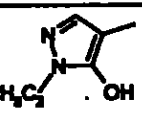
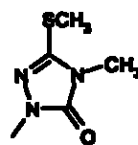
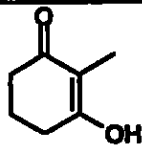
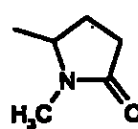
Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
22	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,16 ^{a)}
23	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,40 ^{a)}
24	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,98 ^{a)}
25	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,88 ^{a)}
26	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,15 ^{a)}
27	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,11 ^{a)}

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
28	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}
29	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,12 ^{a)}
30	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 1,78 ^{a)}
31	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}
32	CH ₂ CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	logP = 2,04 ^{a)}
33	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 1,97 ^{a)}

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
34	CH ₂ CH ₃		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,36 ^{a)}
35	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) [α] _D ²⁰ = +2,3 logP = 1,67 ^{a)}
36	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,94 ^{a)}
37	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,85 ^{a)}
38	CH ₂		(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,10 ^{a)}
39	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,12 ^{a)}

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
40	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,67 ^{a)}
41	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 2,42 ^{a)}
42	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1,65 ^{a)}
43	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	
44	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	logP = 2,05 ^{a)}
45	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,68 ^{a)}

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
46	CH ₂		(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 2,13 ^{a)}
47	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,95 ^{a)}
48	CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	(Enantióme- ro S) logP = 1,51 ^{a)}
49	CH ₂		(4) Cl	-	(2) 	logP = 1,92 ^{a)}
50	CH ₂ CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	²⁰ n _D = 1,5970
51	CH ₂ CH ₃		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	²⁰ n _D = 1,5825
52	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) Cl	(3) 	²⁰ n _D = 1,5790

Ej. n°	A	R ¹	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	Datos físicos
53	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	Fp.: 69°C
54	CH ₂ CH ₂		(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	Fp.: 62°C
55	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
56	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
57	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
58	CH ₂		(4) CF ₃	-	(2) 	
59	CH ₂		(2) Br	(4) Br	(3) 	(Enantióme- ro S)

La determinación de los valores logP indicados en la tabla 1 se lleva 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 valores de medición correspondientes se han marcado en la tabla 1 con ^a.

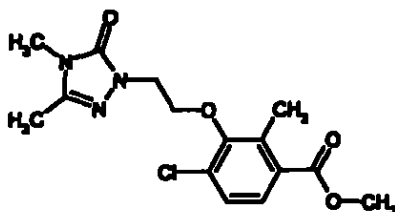
(b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución acuosa 0,01 molar de tampón de fosfato, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo -los valores de medición correspondientes se han marcado en la tabla 1 con ^b.

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

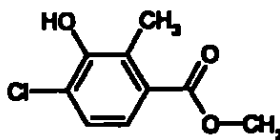
Los valores lambda máximos se determinaron por medio de los espectros UV desde 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

Productos de partida de la fórmula (II):

Ejemplo (II-1).



Primera etapa.



Se hace pasar a través de una solución a ebullición de 100 g (0,6 moles) de

3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo y 0,4 ml de diisopropilamina, en 800 ml de 1,2-dicloro-etano, en el transcurso de 4 hasta 6 horas, 43 g (0,606 moles) de cloro gaseoso. Tras la refrigeración se lava la solución sucesivamente con, respectivamente, 200 ml de solución al 5 % de bisulfito de sodio y con solución saturada de cloruro de sodio, se seca la fase orgánica sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente al vacío de la trompa de agua. El aceite de color pardo oscuro, obtenido como residuo, se combina con 30 ml de dietiléter y se refrigera a 0° hasta 4°C para la cristalización. Los cristales precipitados se aíslan mediante filtración por succión, se lavan con un poco de dietiléter frío y se secan en vacío a 30°C.

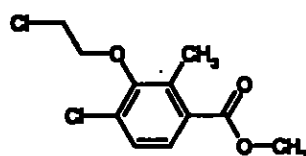
Se obtienen 46,6 g (39 % de la teoría) del 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo.

Log P: 2,14.

Si en lugar del 3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo se emplea el correspondiente éster de etilo, se obtendrá, según el mismo procedimiento, el 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de etilo.

Punto de fusión: 51°C.

Segunda etapa.



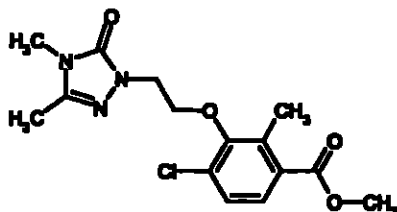
Se añaden a una solución de 25 g (0,125 moles) de 4-cloro-3-hidroxi-2-metil-benzoato de metilo, en 400 ml de acetonitrilo, sucesivamente, 34,2 g (0,248 moles) de carbonato de potasio anhidro en forma de polvo y 29,3 g (0,125 moles) de p-toluenosulfonato de 2-cloro-etanol. Se calienta aproximadamente durante 7 horas a 70°C, se deja refrigerar la mezcla de la reacción y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 200 ml

de diclorometano y 300 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 32,5 g (99 % de la teoría) del 4-cloro-3-(2-cloro-etoxi)-2-metil-benzoato de metilo en forma de aceite oscuro.

Log P = 3,52.

Tercera etapa.



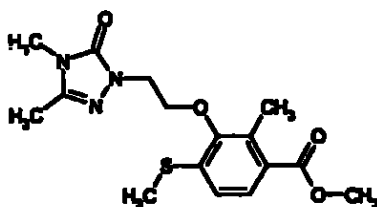
Se añaden a una solución de 16,0 g (60,8 mmoles) de 4-cloro-3-(2-cloro-etoxi)-2-metil-benzoato de metilo en 70 ml de dimetilsulfóxido, sucesivamente, 18,4 g (0,133 moles) de carbonato de potasio anhidro en forma de polvo y 6,9 g (60,8 mmoles) de 3,4-dimetil-1,2,4-triazolin-5-ona. Se calienta aproximadamente durante 6 horas a 90°C, se deja refrigerar la mezcla de la reacción y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 140 ml de diclorometano y 60 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua. El residuo oleaginoso se agita con 25 ml de éter de petróleo. El producto cristalino precipitado en este caso se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 18,5 g (80 % de la teoría) del 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo.

Log P: 1,94.

Ejemplo (II-2).

468 78

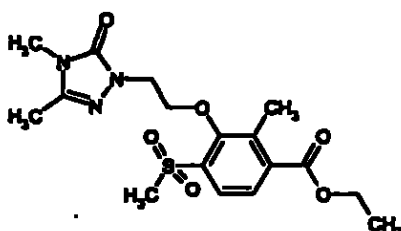


Se añaden a una solución de 12,4 g (36,5 mmoles) de 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo, en 100 ml de *N,N*-dimetil-formamida, bajo refrigeración con hielo, 3,3 g (44,5 mmoles) de metilmercáptido de sodio. Se agita durante aproximadamente 6 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en 300 ml de acetato de etilo y 200 ml de agua. La fase orgánica se separa, se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 5,4 g (42 % de la teoría) del 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metiltio-benzoato de metilo.

Log P = 1,89.

Ejemplo (II-3).



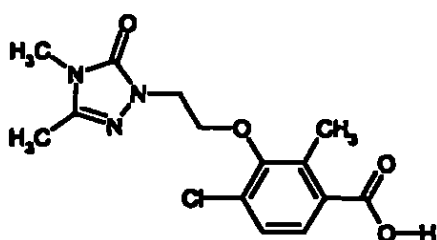
Se añaden a una solución de 12,3 g (33,7 mmoles) de 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metiltio-benzoato de etilo en 40 ml de ácido acético, 10 mg de tetrahidrato de molibdato de amonio y 17,3 g (178 mmoles) de solución acuosa al 35 % de peróxido de hidrógeno. La mezcla de la reacción se calienta durante aproximadamente 6 horas a 50°C hasta 60°C, se

diluye con agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa, se lava sucesivamente con agua, con solución de bicarbonato de sodio, con solución de tiosulfato de sodio y nuevamente con agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 12,3 g (92 % de la teoría) del 3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-4-metilsulfonil-benzoato de etilo.

Log P = 1,76.

Ejemplo (II-4).



Se añaden a una solución de 6,5 g (19,0 mmoles) de 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazol-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoato de metilo en 40 ml de etanol, 1,2 g (30 mmoles) de una solución de hidróxido de sodio en 20 ml de agua. La solución se agita durante aproximadamente 24 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C), y se elimina la mayor parte del disolvente al vacío de la trompa de agua. El residuo se disuelve en agua y se acidifica con ácido clorhídrico. La suspensión formada se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se separa, se lava con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra.

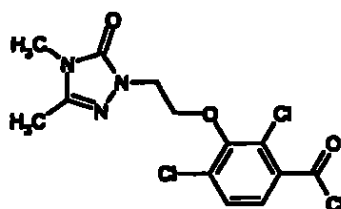
El disolvente se elimina cuidadosamente el filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 5,9 g (95 % de la teoría) del ácido 4-cloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-metil-benzoico.

470

Log P = 1,37.

Ejemplo (II-5).

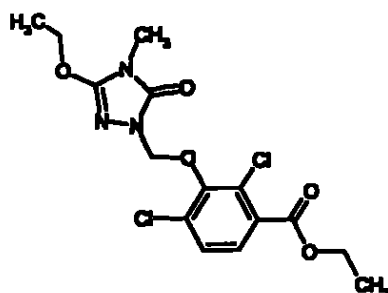


Se calientan 2,3 g (6,65 mmoles) del ácido 2,4-dicloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-benzoico, en 10 ml de cloruro de tionilo aproximadamente durante 1,5 horas a 70°C. Se deja refrigerar la solución de la reacción y se elimina el cloruro de tionilo en exceso bajo presión reducida.

Se obtienen 2,4 g (100 % de la teoría) del cloruro de 2,4-dicloro-3-[2-(3',4'-dimetil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-etoxi]-2-benzoilo.

Log P = 1,24.

Ejemplo (II-6).



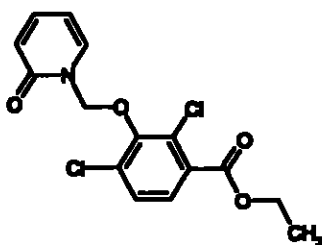
Se disuelven 5 g (21,3 mmoles) del 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo en 200 ml de tetrahidrofurano y se combinan con 3,68 g (21,3 mmoles) de 1-hidroxi-metil-3-etoxi-4-metil-1,2,4-triazolin-5-ona. Tras adición de 5,58 g (21,3 mmoles) de trifenilfosfina se añaden, gota a gota, a 0°C, 4,4 g de diazodicarboxilato de dietilo al 85 %. La solución resultante se agita durante la noche, se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y se filtra a través de gel de sílice (acetato de etilo/hexano). El filtrado se concentra por evaporación y se

combina con dietiléter. El producto sólido que se separa se recoge por filtración y el disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida.

Se obtienen 6,8 g (82 % de la teoría) del 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoato de etilo en forma de aceite viscoso.

Log P = 2.77.

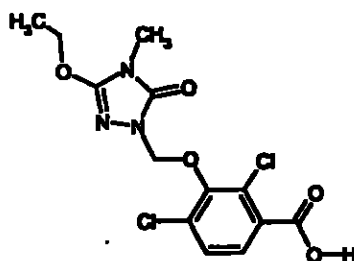
Ejemplo (II-7).



Se disuelven 2 g (8,5 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo en 30 ml de acetonitrilo y se combinan sucesivamente con 0,86 g (8,5 mmoles) de trietilamina y 1,2 g (8,5 mmoles) de N-clorometil-2-piridona. La mezcla resultante se agita durante 7 horas a 60°C, se combina con agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa, se lava con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio y se filtra. El disolvente se elimina por destilación cuidadosamente bajo presión reducida.

Se obtienen 2,4 g (82 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-(1H-pirid-2-on-1-il)-metoxi-benzoato de etilo.

Ejemplo (II-8).

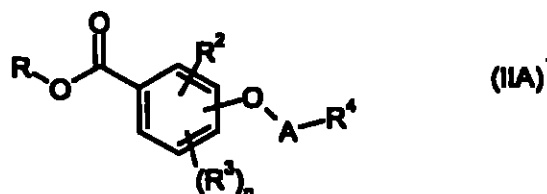


Se agitan 6,4 g (16,3 mmoles) del 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoato de etilo en una mezcla constituida por 250 ml de ciclohexano y 25 ml de etilenglicol-monometiléter en presencia de 0,91 g de hidróxido de potasio en polvo durante 15 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C). Se diluye con agua y se acidifica con ácido clorhídrico 2N. El producto sólido precipitado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 4,05 g (69 % de la teoría) del ácido 3-(3'-etoxi-4'-metil-1',2',4'-1H-triazolin-5'-on-1'-il)-metoxi-2,4-dicloro-benzoico.

log P: 1,74.

De manera análoga a la de los ejemplos (II-1) hasta (II-8) pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (II) o los derivados reactivos de los mismos -véase la fórmula (IIa)-, indicados en la tabla 2 siguiente,

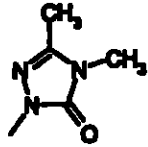
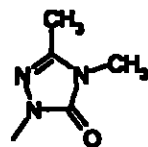
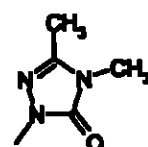
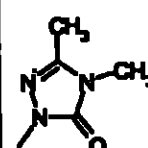
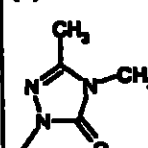
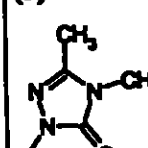


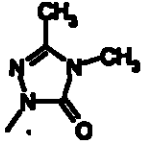
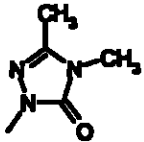
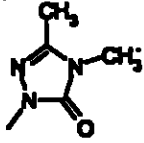
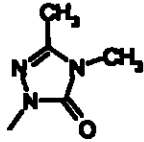
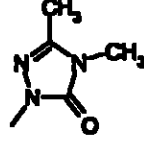
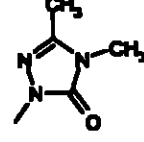
en la que

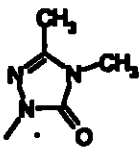
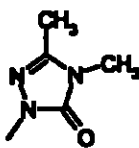
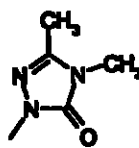
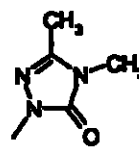
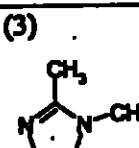
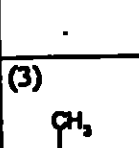
R tiene el significado indicado en la tabla siguiente.

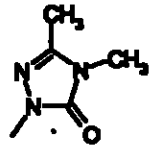
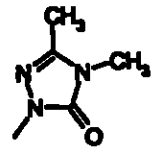
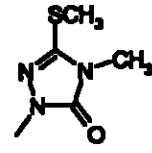
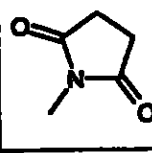
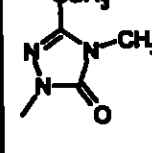
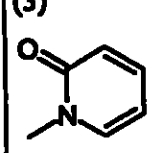
473

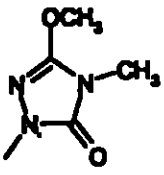
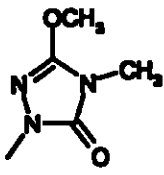
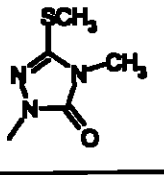
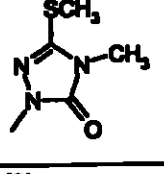
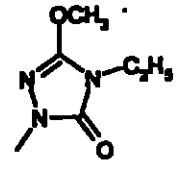
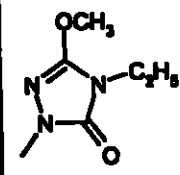
Tabla 2: Ejemplos de compuestos de la fórmula (II) o bien (IIA).

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ⁴) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-9	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,25 ^{a)}
II-10	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,16 ^{a)}
II-11	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	CH ₃	logP = 1,48 ^{a)}
II-12	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,33 ^{a)}
II-13	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,92 ^{a)}
II-14	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,08 ^{a)}

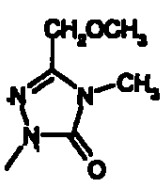
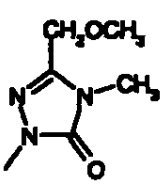
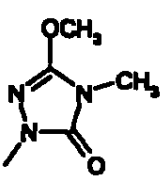
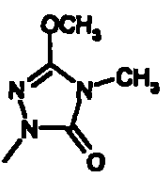
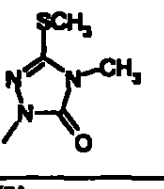
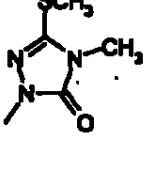
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-15	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,23 ^{a)}
II-16	CH ₂ CH ₂	(2) SCH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,13 ^{a)}
II-17	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,09 ^{a)}
II-18	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,27 ^{a)}
II-19	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	H	logP = 0,59 ^{a)}
II-20	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,72 ^{a)}

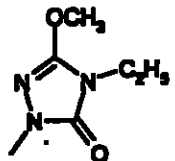
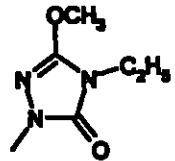
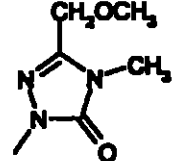
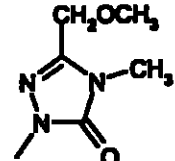
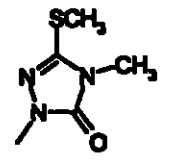
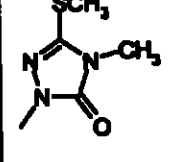
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-21	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,77 ^{a)}
II-22	CH ₂ CH ₂	(2) SO ₂ CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H	logP = 0,46 ^{a)}
II-23	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SOCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 1,49 ^{a)}
II-24	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,95 ^{a)}
II-25	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SO ₂ CH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 0,83 ^{a)}
II-26	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,34 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-27	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,27 ^{a)}
II-28	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H (xHCl)	logP = 1,37 ^{a)}
II-29	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,69 ^{a)}
II-30	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,13 ^{a)}
II-31	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,68 ^{a)}
II-32	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆), δ: 5,89 ppm (s, CH ₂)

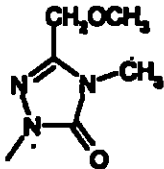
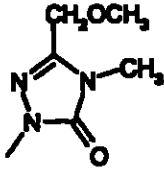
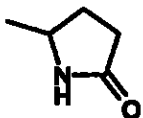
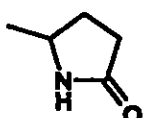
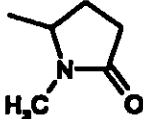
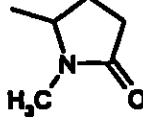
Ej. - n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-33	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,40 ^{a)}
II-34	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,52 ^{a)}
II-35	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,66 ^{a)}
II-36	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,72 ^{a)}
II-37	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,68 ^{a)}
II-38	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,73 ^{a)}

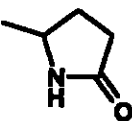
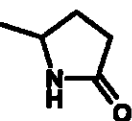
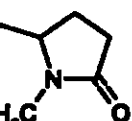
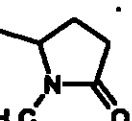
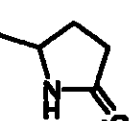
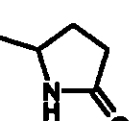
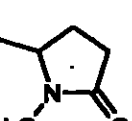
478

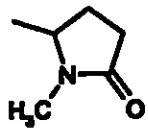
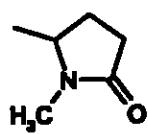
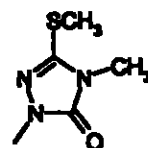
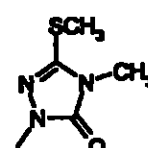
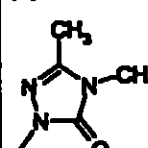
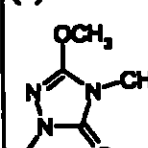
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-39	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,28 ^{a)}
II-40	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,45 ^{a)}
II-41	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,17 ^{a)}
II-42	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,78 ^{a)}
II-43	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,44 ^{a)}
II-44	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,75 ^{a)}

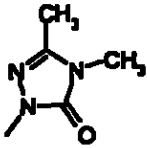
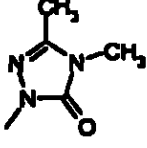
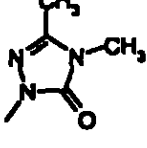
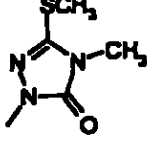
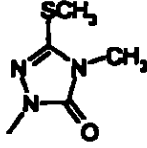
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-45	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,46 ^{a)}
II-46	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,79 ^{a)}
II-47	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	CH ₃	logP = 2,06 ^{a)}
II-48	CH ₂ CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	logP = 1,49 ^{a)}
II-49	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,59 ^{a)}
II-50	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,64 ^{a)}

480

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-51	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	logP = 2,22 ^{a)}
II-52	CH ₂ CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	logP = 1,37 ^{a)}
II-53	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,17 ^{a)}
II-54	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,31 ^{a)}
II-55	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,35 ^{a)}
II-56	CH ₂	(2) Cl	(4) SCH ₃	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,44 ^{a)}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-57	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 1,95 ^{a)}
II-58	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,39 ^{a)}
II-59	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,18 ^{a)}
II-60	CH ₂	(2) CH ₃	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,55 ^{a)}
II-61	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S) logP = 2,15 ^{a)}
II-62	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,28 ^{a)}
II-63	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	C ₂ H ₅	(Enantióme- ro S)

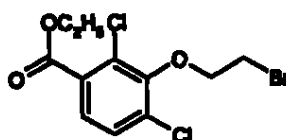
Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-64	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	CH ₃	(Enantióme- ro S) n _D ²⁰ = -20,4 logP = 2,01 ^{aj}
II-65	CH ₂	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	H	(Enantióme- ro S) logP = 1,42 ^{aj}
II-66	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	logP = 2,33 ^{aj}
II-67	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	logP = 1,81 ^{aj}
II-68	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	logP = 2,23 ^{aj}
II-69	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	CH ₃	logP = 2,07 ^{aj}

Ej. n°	A	(Posición) R ²	(Posición) (R ³) _n	(Posición OAR ⁴) R ⁴	R	Datos físicos
II-70	CH ₂	(4) Cl	-	(2) 	H	logP = 1,36 ^{a)}
II-71	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-72	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	
II-73	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	CH ₃	
II-74	CH ₂	(4) CF ₃	-	(2) 	H	

El compuesto indicado en la tabla 2 como ejemplo (II-35) puede prepararse, por ejemplo, de manera siguiente:

Ejemplo (II-35).

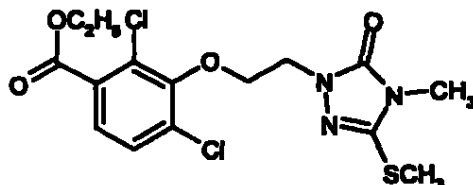
Primera etapa.



Se añaden a una solución de 15 g (68 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxibenzoato de etilo en 80 ml de N,N-dimetil-formamida, sucesivamente, 19 g (137 mmoles) de carbonato de potasio (polvo), 38,6 g (205 mmoles) de 1,2-dibromoetano y 0,4 g de yoduro de sodio. Se calienta la mezcla durante 2 horas a 80°C, a continuación se deja refrigerar hasta la temperatura ambiente y se sacude seguidamente con 350 ml de dietiléter. La fase orgánica se lava con agua, con lejía de hidróxido sódico al 10 % y finalmente con ácido clorhídrico al 10 %, a continuación se seca con sulfato de sodio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 22,2 g (95 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-(2-bromo-etoxi)benzoato de etilo en forma de residuo oleaginoso (log P = 3,98 ^u).

Segunda etapa.



Se añaden a una solución de 18 g (93 mmoles) del 2,4-dicloro-3-(2-bromo-etoxi)benzoato de etilo, en 100 ml de N,N-dimetil-formamida, sucesivamente 14,6 g (106 mmoles) de carbonato de potasio (polvo), 19,3 g (133 mmoles) de 3-metiltio-4-metil-1,2,4-triazol-5-ona y 0,5 g de yoduro de sodio. Se calienta la mezcla durante 4 horas a 80°C, y a continuación se refrigera hasta la temperatura ambiente, se sacude con 400 ml de diclorometano, la fase orgánica se lava con

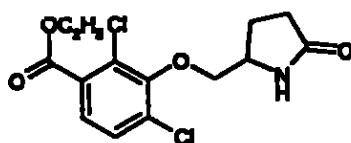
agua, a continuación con lejía de hidróxido sódico al 10 % y finalmente con ácido clorhídrico al 10 %, se seca a continuación con sulfato de sodio y se filtra.

El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por evaporación bajo presión reducida .

Se obtienen 17,7 g (82 % de la teoría) del 2,4-dicloro-3-[2-(3-metiltio-4-metil-5-oxo-1,2,4-triazolin-1-il)-etoxi]-benzoato de etilo en forma de residuo oleaginoso ($\log P = 2,66$ ^{4b}).

El compuesto indicado en la tabla 2 como ejemplo (II-61) puede prepararse, por ejemplo, de la manera siguiente:

Ejemplo (II-61).



Se agita durante 13 horas a 76°C, una mezcla constituida por 2,0 g (8,5 mmoles) de 2,4-dicloro-3-hidroxi-benzoato de etilo, 3,6 g (12,75 mmoles) de (S)-(+)-5-(p-toluenosulfoniloximetil)-pirrolidin-2-ona, 2,3 g (17 mmoles) de carbonato de potasio y 30 ml de acetonitrilo, tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se diluye con agua hasta un volumen aproximadamente dos veces mayor y se sacude con cloruro de metileno. La fase orgánica se lava con solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se seca con sulfato de sodio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 2,6 g (92 % de la teoría) del (S)-2,4-dicloro-3-[(2-oxo-pirrolidin-5-il)-metoxi]-benzoato de etilo ($\log P = 2,14$ ^{4b}).

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 semillas de las plantas de ensayo en terreno normal. 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 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 y 11 con una compatibilidad ampliamente buena frente a 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 concen-tración deseada.

Se pulverizan plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm 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:

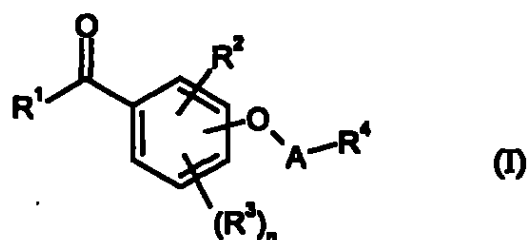
0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 y 13, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

REIVINDICACIONES

1.- Arilcetonas substituidas de la fórmula general (I)

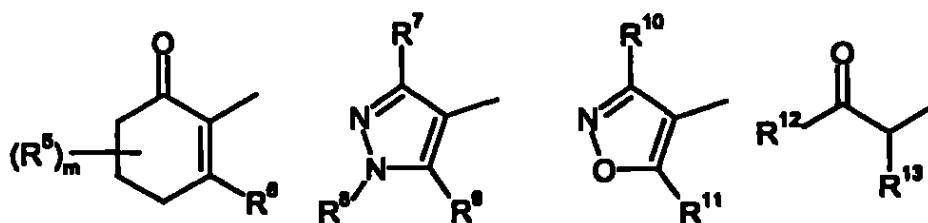


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileo),

R¹ significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m significa los números 0 hasta 6,

R⁵ significa halógeno o significa alquilo, alquiltio o arilo substituidos respectiva-mente en caso dado, o -en el caso en que m signifique 2- significa en caso dado también junto con un segundo resto R⁵ alcanodiilo (alquileo),

R⁶ significa hidroxí, formiloxí, halógeno, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsul-

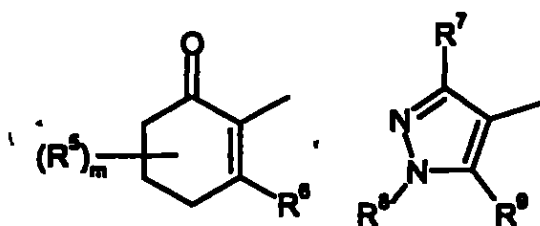
- finilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilamino-carboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfoniloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁷ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxicarbonilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁸ significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R⁹ significa hidroxilo, formiloxi, o significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, alquilsulfoniloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o arilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹¹ significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R¹² significa hidrógeno o significa alquilo o cicloalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,
- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R⁴** significa un agrupamiento heterocíclico, monocíclico o bicíclico, saturado o insaturado, con 4 a 12 miembros, en caso dado substituido, que contiene de 1 a 4 heteroátomos (hasta 4 átomos de nitrógeno y en caso dado -alternativa o adicionalmente- 1 o 2 átomos de oxígeno y 1 o 2 átomos de azufre, o uno o dos agrupamientos SO- o uno o dos agrupamientos SO₂-), y que contiene además de uno hasta tres grupos oxo (C=O) y/o grupos tioxo (C=S) como componentes del heterociclo,

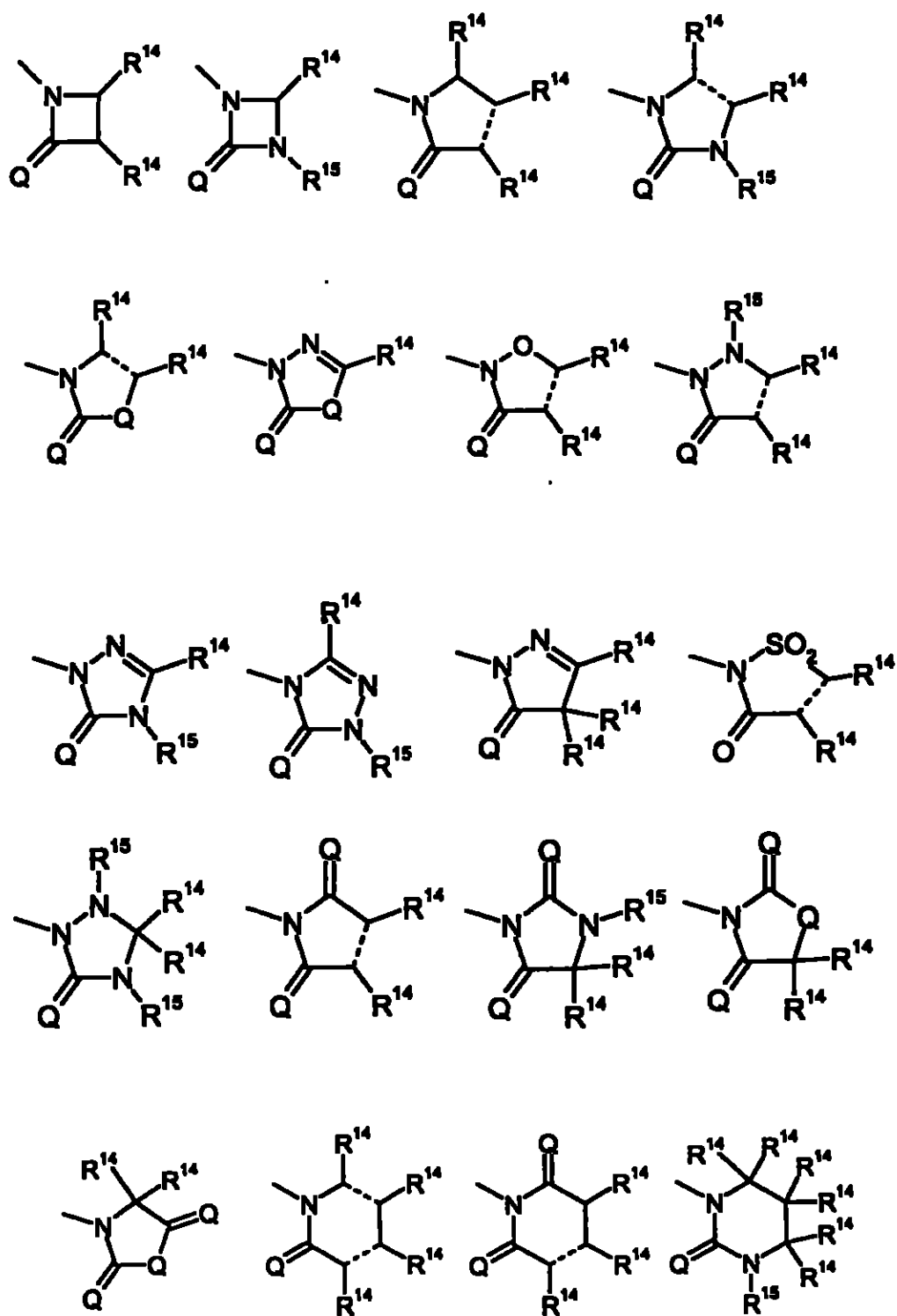
-con inclusión de todas las formas tautómeras posibles de los compuestos de la fórmula general (I) y de las sales o bien aductos con ácido o con bases posibles de los compuestos de la fórmula general (I)-.

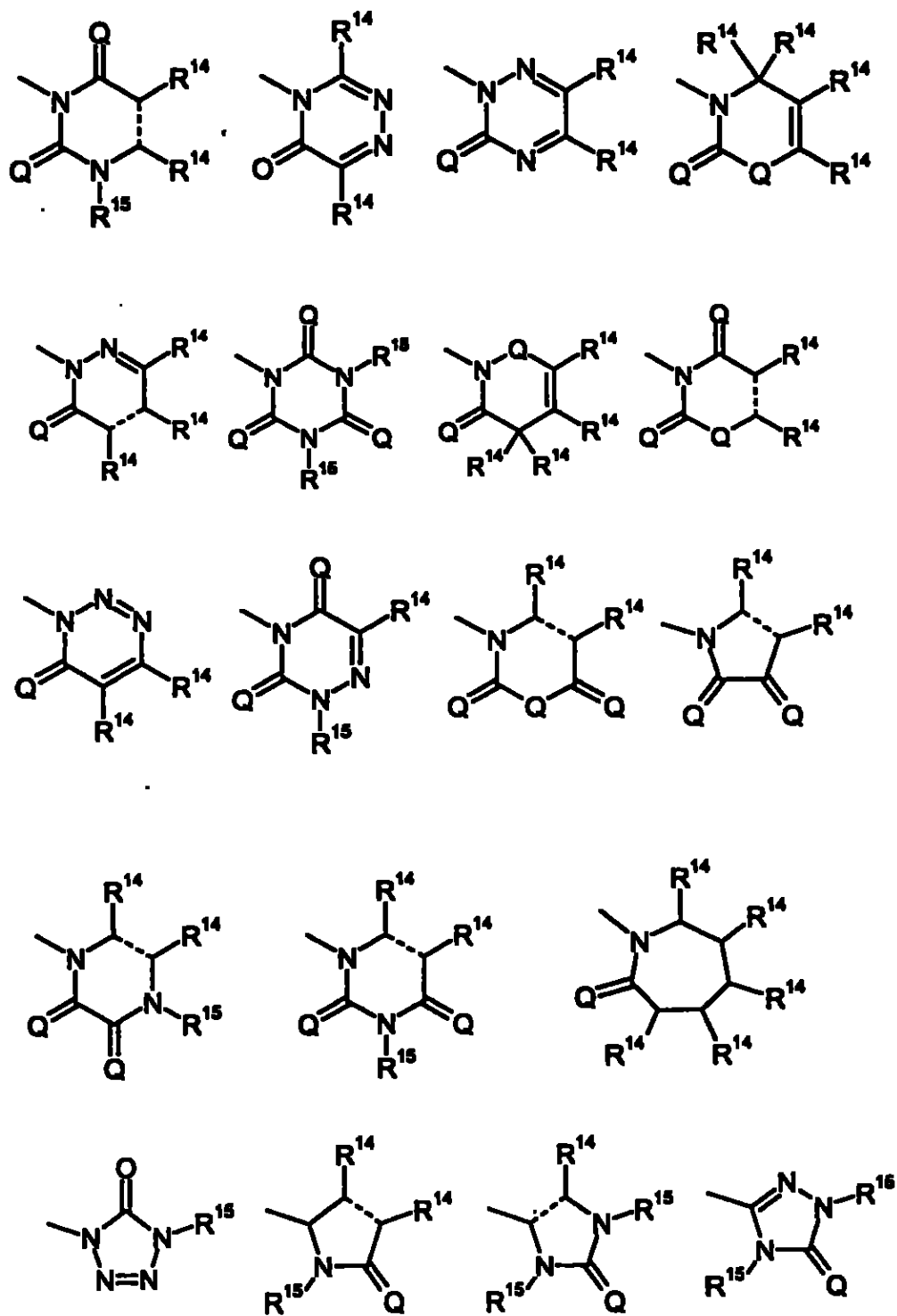
2.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizados porque

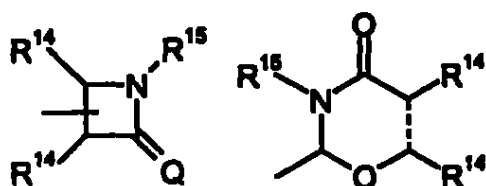
- n** significa los números 0 o 1,
- m** significa los números 0, 1, 2, 3 o 4,
- A** significa alcanodiilo (alquilenos) con 1 a 6 átomos de carbono,
- R¹** significa uno de los agrupamientos siguientes



- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo respectivamente con 1 a 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R⁴** significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes







siendo el enlace dibujado con trazos discontinuos respectivamente un enlace sencillo o un enlace doble,

Q significa oxígeno o azufre,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, halógeno, significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilamino o dialquilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alqueniltio o alquenilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquiloxi, cicloalquiltio, cicloalquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalquiltio o cicloalquilalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino

substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa también junto con el resto R^{14} contiguo un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxí, amino, alquilidenamino con hasta 4 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino o alcanoilamino respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alquinilo o alqueniloxi respectivamente con hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o bien alquinilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquilamino respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa alcanodiilo con 3 hasta 5 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

pudiendo tener los restos individuales R^{14} y R^{15} -en tanto en cuanto estén enlazados varios de ellos sobre el mismo agrupamiento heterocíclico- significados iguales o diferentes en el ámbito de la definición anterior,

R^5 significa halógeno, significa alquilo o alquiltio respectivamente con 1 hasta

6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R^2 significa alcanodiilo (alquilen) con 2 hasta 6 átomos de carbono,

R^6 significa hidroxi, formiloxi, o significa alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa ariloxi, ariltio, arilsulfinilo, arilsulfonilo, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi, arilsulfo-niloxi, arilalcoxi, arilalquiltio, arilalquilsulfinilo o arilalquilsulfonilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R^7 significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o alcoxicarbonilo respectivamente con 1 hasta 6 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 significa cicloalquilo con 3 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a hasta 4 átomos de carbono,

R⁸ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono substituido respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo respectivamente con 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, o significa arilo o arilalquilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁹ significa hidroxi, formiloxi, significa alcoxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniloxi, alquilaminocarboniloxi o alquilsulfoniloxi respectivamente con 1 hasta 6 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, significa alqueniloxi o alquiniloxi respectivamente con 2 hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, o por halógeno, o significa arilalcoxi, arilcarboniloxi, arilcarbonilalcoxi o

arilsulfonilo respectivamente con 6 o 10 átomos de carbono en los grupos arilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹⁰ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 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,

R¹¹ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R¹² significa hidrógeno, significa alquilo con 1 hasta 6 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 hasta 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, y

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente con 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por

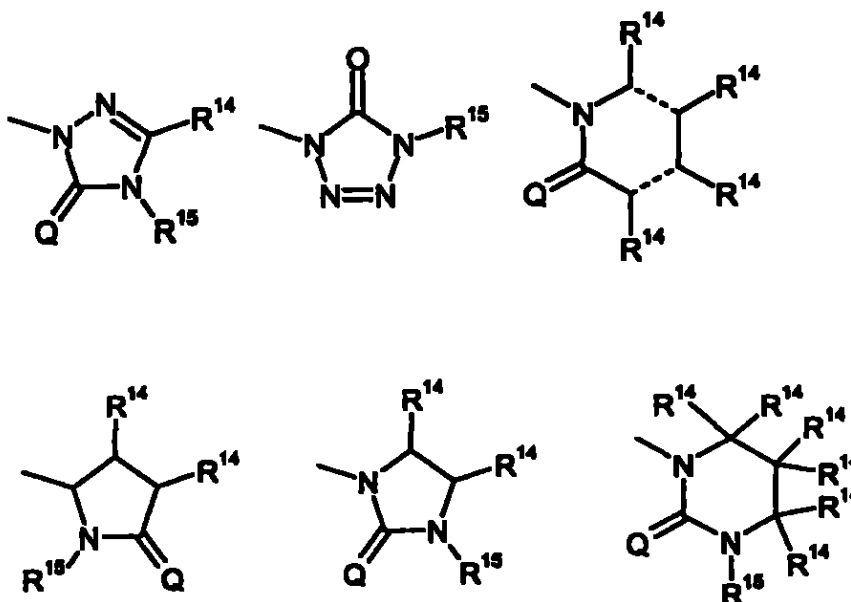
alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

3.- Compuestos de la fórmula (I) según las reivindicaciones 1 o 2, caracterizados porque

- m** significa los números 0, 1, 2 o 3,
- A** significa metileno, etano-1,2-diilo (dimetileno), etano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo o butano-1,4-diilo (tetrametileno),
- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilamino-sulfonilo o dietilaminosulfonilo,
- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi substituidos respectivamente en caso

dado por flúor y/o por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propil-sulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino, dietilamino, dimetilamino-sulfonilo o dietilaminosulfonilo,

R^4 significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes



R^5 significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa fenilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por metilo o por metoxi, o significa en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R^5 etano-1,2-diilo (dimetileno) propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno),

- R⁶** significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etil-aminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfo-niloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenoxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benciloxi, bencilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenil-metoxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,
- R⁷** significa hidrógeno, ciano, carbamilo, tiocarbamilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo 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 bromo, por métilo o por etilo,
- R⁸** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexil-metilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substi-tuidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,
- R⁹** significa hidroxí, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o t-butiroiloxi, metoxicarboniloxi, etoxi-carboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocar-boniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi o butiniloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa fenilmetoxi, benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substi-tuidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi,

por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmetoxi o por trifluórmetoxi,

R¹⁰ · significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

R¹¹ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹² significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclo-pentilo o ciclohexilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,

R¹³ significa hidrógeno, ciano, carbamoilo, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo,

etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,

R¹⁴ significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etil-sulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por n- o i-propilsulfinilo, por metil-sulfonilo, por etilsulfonilo, por n- o i-propilsulfonilo, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino o di-i-propilamino, significa etenilo, propenilo, butenilo, etinilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propenilamino o butenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, ciclopropil-metilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropil-metoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi, ciclopropilme-tiltio, ciclobutilmetiltio, ciclopentilmetiltio, ciclohexilmetiltio, ciclopropilme-tilamino, ciclobutilmetilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o

significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa pirrolidino, piperidino o morfolino, o -en el caso en que los restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i- o s-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo o propeniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

4.- Compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizados porque

m significa los números 0, 1 o 2,

A significa metileno o dimetileno,

- R²** significa hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiometilo, metilsulfinilmetilo, metilsulfonilmetilo, metoxi, etoxi, difluór-metoxi, trifluór-metoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsul-fonilo, etilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo,
- R³** significa nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, difluórmétilo, trifluórmétilo, diclorometilo, triclorometilo, metoximetilo, metiltiometilo, metilsulfinilmetilo, metilsulfonilmetilo, metoxi, etoxi, difluór-metoxi, trifluór-metoxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfo-nilo o dimetilaminosulfonilo,
- R⁵** significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa fenilo, o en caso dado también -en el caso en que m signifique 2- junto con un segundo resto R³ significa etano-1,2-diilo (dimetileno), propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno),
- R⁶** significa hidroxilo, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsul-fonilo, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxycarboniloxi, etoxycarboniloxi, n- o i-propoxycarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenoxi, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benzoiloxi, ben-zoilmetoxi, fenilsulfoniloxi, fenilmetoxi, fenilmetiltio, fenilmetilsulfinilo o fenilmetilsulfonilo substituidos respectivamente en caso

dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,

R⁷ significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metil-sulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R⁸ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, significa ciclopropilo substituído en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmétilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluórmétoxi o por trifluórmétoxi,

R⁹ significa hidroxi, formiloxi, significa metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, acetiloxi, propioniloxi, n- o i-butiroliloxi, metoxicarboniloxi, etoxicarboniloxi, n- o i-propoxicarboniloxi, metilaminocarboniloxi, etilaminocarboniloxi, n- o i-propilaminocarboniloxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propeniloxi o propiniloxi, o significa fenilmetoxi,

benzoiloxi, benzoilmetoxi o fenilsulfoniloxi substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por trifluórmtilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por difluór-metoxi o por trifluórmtiloxi,

- R¹⁰** significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirollo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R¹¹** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,
- R¹²** significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa ciclopropilo substituido en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo,
- R¹³** significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, o 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 substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi o por etoxi,
- R¹⁴** significa hidrógeno, hidroxí, mercapto, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo,

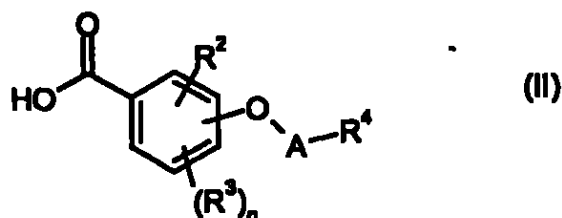
significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, 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, significa metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino, significa etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, propeniloxi, propeniltio o propenilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, significa ciclopropilo, ciclopropiloxi, ciclopropilamino, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi o ciclopropilmetiltio substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo, feniloxi, feniltio, fenilamino, bencilo, benciloxi, benciltio o bencilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, o -en el caso en que dos restos contiguos R^{14} y R^{14} se encuentren sobre un doble enlace- significa junto con el resto R^{14} contiguo también un agrupamiento benzo, y

R^{15} significa hidrógeno, hidroxilo, amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino o dimetilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo o propinilo, significa ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopropilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor y/o por cloro, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por

metoxi, por étoxi, por n- o i-propoxi, o junto con un resto contiguo R^{14} o R^{15} significa propano-1,3-diilo (trimetileno) o butano-1,4-diilo (tetrametileno) substituidos respectivamente en caso dado por metilo y/o por etilo.

5.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque

(a) se hacen reaccionar ácidos benzoicos substituidos de la fórmula general (II)



en la que

n , A , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o derivados reactivos de los mismos, tal como por ejemplo los correspondientes halogenuros de acilo, cianuros de acilo o ésteres-

con compuestos de la fórmula general (III)



en la que

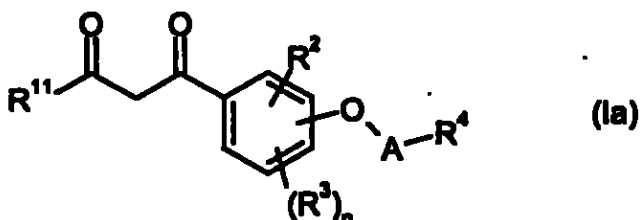
R^1 tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en caso dado en presencia de un agente deshidratante, en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque

(b) se hacen reaccionar benzoilcetonas substituidas de la fórmula general (Ia)

511 205



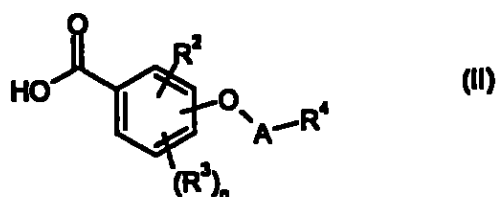
en la que

n , A , R^2 , R^3 , R^4 y R^{11} tienen el significado indicado en la reivindicación 1, con un éster del ácido ortofórmico o con un N,N-dimetil-formamida-acetal o con un éster del ácido cianofórmico o con disulfuro de carbono (carburo de azufre) y con un agente de alquilación, y a continuación con hidroxilamina o con un aducto con ácido de la misma,

en caso dado en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y en caso dado después de la realización de los procedimientos según la invención (a) o (b) se llevan a cabo en los compuestos, así obtenidos, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los sustituyentes, de manera usual, reacciones de sustitución, de oxidación o de reducción y/o los compuestos de la fórmula general (I) se transforman de manera usual en los compuestos de tipo salino.

6.- Compuestos de la fórmula (II)



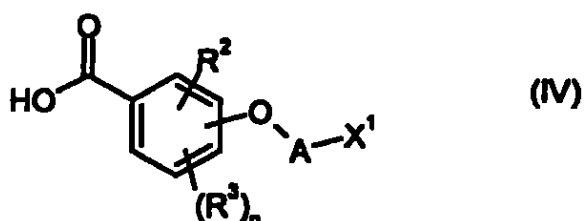
en la que

n , A , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

así como sus derivados reactivos.

7.- Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (II) según la reivindicación 6, caracterizado porque

(α) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (IV)



en la que

n, A, R² y R³ tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y

X¹ significa halógeno o significa alquilsulfonilo,

-o también sus derivados-

con compuestos heterocíclicos de la fórmula general (V)



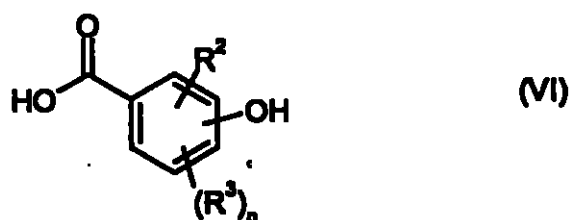
en la que

R⁴ tiene el significado indicado en la reivindicación 1,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, a temperaturas comprendidas entre 10°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de conversión en el ámbito de la definición de los substituyentes, en forma usual,

o porque

(β) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o también sus derivados-

con hidroxialquilheterociclos de la fórmula general (VII)



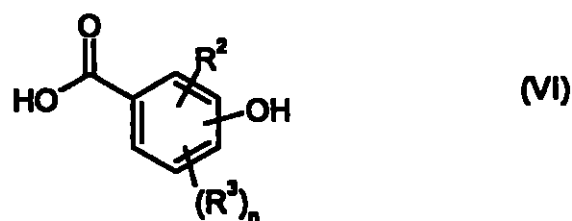
en la que

A y R^4 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

en presencia de agentes auxiliares de la condensación y, en caso dado, en presencia de un diluyente, a temperaturas comprendidas entre -20°C y $+50^{\circ}\text{C}$ y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de conversión en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual,

o porque

(y) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (VI)



en la que

n , R^2 y R^3 tienen el significado indicado en la reivindicación 1,

-o también sus derivados-

con halógenoalquilheterociclos de la fórmula general (VIII)



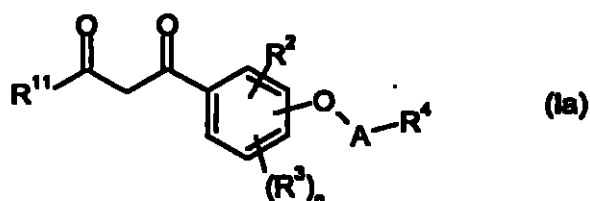
en la que

A y R⁴ tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y

X² significa halógeno, significa alquilsulfoniloxi o significa arilsulfoniloxi,

en caso dado en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C y en caso dado a continuación se llevan a cabo otras reacciones de conversión en el ámbito de la definición de los substituyentes, de manera usual.

8.- Compuestos de la fórmula (Ia)



en la que

n, A, R², R³, R⁴ y R¹¹ tienen el significado indicado en la reivindicación 1.

9.- Agentes caracterizados porque tienen un contenido en al menos un compuesto de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4.

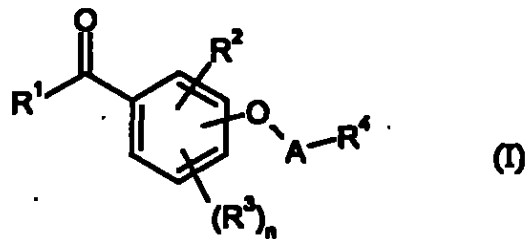
10.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4 o de agentes según la reivindicación 9 para la lucha contra las plantas indeseables.

11.- Procedimiento para la lucha contra las plantas indeseables, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 4 o agentes según la reivindicación 9.

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas arilcetonas sustituidas de la fórmula general

(I)

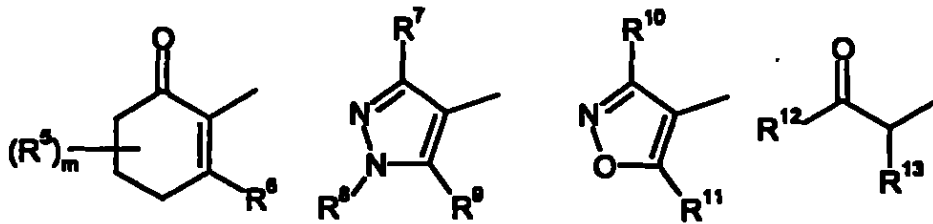


en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

A significa alcanodiilo (alquileno),

R^1 significa uno de los agrupamientos siguientes



donde

m, R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} tienen uno de los significados indicados en la descripción.

R^2 significa hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquilamino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado,

- R³** significa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilamino, dialquil-amino o dialquilaminosulfonilo substituidos respectivamente en caso dado, y
- R⁴** significa un agrupamiento heterocíclico con 4 hasta 12 miembros, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, substituido en caso dado,
- así como a procedimientos para su obtención, a productos intermedios y al empleo de estos compuestos como herbicidas.

518

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 01002013 00000000 Folios: 510
Fecha (AMD): 2001-01-16 17:03:05
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 74,514
FECHA : DICIEMBRE 4 DE 2000

CONSIGNACION

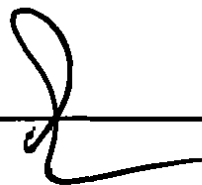
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2825227	30,085,500.00

CONCEPTO

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	608,000.00
	TOTAL :	\$ 608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

66 12513-801-001-7

STT
319

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

REQUISITOS MINIMOS PARA /

Radicación : 01002813 00000000

Folios: 510

Fecha (RUB): 2001-01-16 17:03:05

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAR

Dependencia: 0020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PATENTE DE INVENCION [/]

MODELO DE UTILIDAD []

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente [/]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [/]
- Descripción de la invención [/]
- Dibujos de ser estos pertinentes []
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas [/]

COMPLETA [/]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial. []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. []
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño. []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de trazado. []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. []
- Representación gráfica del esquema de trazado []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: _____

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



520 52

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

2020
Bogotá, D.C.

Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado

REFERENCIA:	Radicación No.	01-2813
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio No.	0966
	Folios	001

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica que:

- Debe allegar copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente otorgado por el inventor al solicitante o a su causante (art. 26-k, Dec 486/2000).
- Debe allegar comprobante de pago por exceso de 150 palabras del extracto de publicación.

En cumplimiento del artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le requiere para que dentro del término de dos (2) meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el artículo 8 de la Resolución Reglamentaria No. 210 del 15 de enero del 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 29 MAR. 2001.

202027/202022

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 382 2695
E-mail: Info@slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia