

Handwritten signature/initials.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PCT

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

06-89830

**SOLICITUD DE PATENTE DE
INVENCION**

TITULO. 4(4-TRIFLUOROMETILPIRAZOLIL) - PIRIMIDINAS SUSTITUIDAS

SOLICITANTE BAYER CROPSCIENCE GMBH

DIRECCIÓN. BRÜNINGSTRASSE 50, 65929 FRANKFURT ALEMANIA

APODERADO CARLOS R OLARTE

BOGOTÁ 07 de septiembre de 2006

P2006/000187

1. C010A
6x07
10 10-2006

**PETITORIO - FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD
PATENTE PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

SOLICITUD DE:

1

☒

Patente de Invención.

☐

Patente de Modelo de Utilidad.

☐

Capítulo I.

☒

Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: BAYER CROPSCIENCE GMBH

Dirección: Brüningstrasse 50, 65929
Frankfurt, Alemania.

Nacionalidad o Domicilio: ALEMANA

Lugar de Constitución: ALEMANIA

Teléfono: _____ **Fax:** _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ **NIT** ☐

C.E. ☐ **Otro** ☐

Cual _____

Número _____

**REPRESENTANTE
APODERADO**

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A,
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ **NIT** ☐

C.E. ☐ **Otro** ☐

Cual _____

Número 79782747Bta
TP 74.295

**INVENTOR (ES)
(72)**

Nombre: VER PÁGINA ADJUNTA

Dirección: VER PAGINA ADJUNTA

Nacionalidad o Domicilio: VER PAGINA ADJUNTA

3

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/002049

Fecha Febrero 26, 2005

Publicación Internacional No. WO 2005/089551

Fecha Septiembre 29, 2005

4

Título (54) 4-(4-TRIFLUOROMETILPIRAZOLIL)-PIRIMIDINAS SUSTITUIDAS

Clasificación Internacional (51) A01N 43/72, 43/48, C07D 417/14, 409/14,
405/14, 403/04, 403/14, 401/14.

Prioridad
SI ☒ **N** ☐

(33) País de Origen

DE

(32) Fecha

Marzo 10, 2004

(31) Número de Solicitud

10 2004 011 705.5

5

Comprobante de pago No. 06 - 68,379

Fecha Septiembre 6, 2006

10

ANEXOS

☒

Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.

☐

Declaraciones.

☒

Copia de la solicitud Internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).

☒

Traducción de la solicitud Internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).

☒

Copia del examen preliminar Internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).

☒

Traducción del examen preliminar Internacional efectuado por la IPEA.

☐

De ser el caso, copia del contrato de acceso.

☐

De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.

☐

De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.

☐

Arte final 12 x 12.

☐

De ser el caso, Información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.

☐

De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud Internacional.

☒

Otros. Búsqueda Internacional

11

FIGURA CARACTERÍSTICA:

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

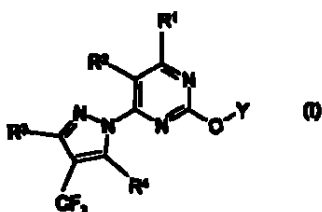
FIRMA:

C.C. 79.782.747 Btá T.P. 74.295

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

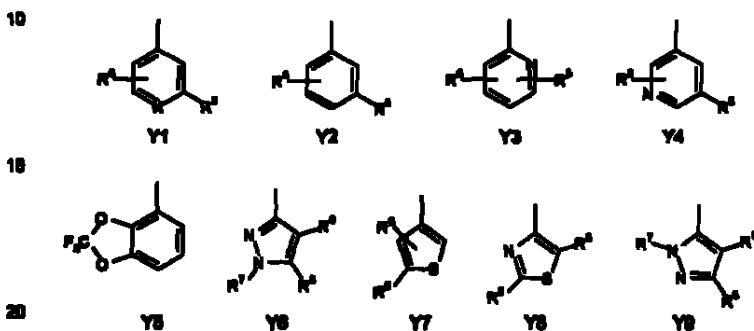
Reivindicaciones de patentes:

1. Compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales,



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

Y significa un radical seleccionado entre el conjunto formado por Y1 hasta Y8:



25 R^1 y R^2 significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, aleno, isociano, hidroxil, COOR^3 , COR^3 , CH_2OH , CH_2SH , CH_2NH_2 , NO_2 , CONH_2 , CONH_2 , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), halógeno-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alkoilquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$), halógeno-alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_4$), alquénilo ($\text{C}_2\text{-C}_4$), alquénil ($\text{C}_2\text{-C}_4$)-al, alquénil ($\text{C}_2\text{-C}_4$)-al, alquil ($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), $\text{S(O)}_n\text{R}^4$, alquil

(C₁-C₆)-sulfonil-alcilo (C₁-C₆), amina, alquil (C₁-C₆)-amina, alquil (C₁-C₆)-carbodiimino, alquil (C₁-C₆)-sulfonilamino o di-alcil (C₁-C₆)-amina,

o

R¹ y R² en común significan CH₂-CH₂-CH₂, CH₂-CH₂-CH₂-CH₂ o OCH₂-CH₂-CH₂O;

R² y R³ significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, cloro, alcilo (C₁-C₆), halógeno-alcilo (C₁-C₆), alcohol (C₁-C₆) o halógeno-alcohol (C₁-C₆);

10 R² significa halógeno, cloro, alcilo (C₁-C₆), halógeno-alcilo (C₁-C₆), alcohol (C₁-C₆), halógeno-alcohol (C₁-C₆), halógeno-alcil (C₁-C₆)-ilo, cicloalcilo (C₂-C₆), halógeno-cicloalcilo (C₂-C₆), SF₂, S(O)₂R², alqueno (C₂-C₆) o alqueno (C₂-C₆);

R² significa hidrógeno, halógeno, cloro, alcilo (C₁-C₆), halógeno-alcilo (C₁-C₆), alcohol (C₁-C₆), halógeno-alcohol (C₁-C₆) o S(O)₂R²;

15

R² significa alcilo (C₁-C₆);

R² significa hidrógeno, alcilo (C₁-C₆) o halógeno-alcilo (C₁-C₆);

20

R² significa hidrógeno o alcilo (C₁-C₆);

a significa 0, 1 o 2.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

25

R¹ y R² independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, cloro, alcohol, éster, amina, alcilo (C₁-C₆), halógeno-alcilo (C₁-C₆), o alcohol (C₁-C₆);

o

R¹ y R² significan en común CH₂CH₂CH₂;

30

R² y R³ independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, amina o nitrato;

Y significa un radical Y1, Y2, Y3, Y4, Y5, Y6 o Y8.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en los que

LISTA DE INVENT RES PCT/EP2005/002049

HOFFMANN, Michael, Gerhard
Jahnstrasse 6a, 65439 Flörsheim
Alemania
Nacionalidad: Alemana

HELMKE, Hendrik
Taunusstrasse 49, 65853 Liederbach
Alemania
Nacionalidad: Alemana

WILLMS, Lothar
Königsteiner Strasse 50,
65719 Hofheim
Alemania
Nacionalidad: Alemana

AULER, Thomas
Bonner Strasse 15,
65812 Bad Soden a. Ts.
Alemania
Nacionalidad: Alemana

KEHNE, Heinz
Itlsweg 7a,
65719 Hofheim
Alemania
Nacionalidad: Alemana

HILLS, Martin
Am Itzelgrund 5b,
65719 Hofheim
Alemania
Nacionalidad: Británica

FEUCHT, Dieter
Am Burggraben 7a,
65760 Eschborm
Alemania
Nacionalidad: Alemana

64

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-089830- -00000-0000
Fee: 2008-09-07 10:56:05 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYN
Eve: 379 FASENACIONALII
Act: 411 PRESENTACION Folios: 110

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 68,379
FECHA : SEPTIEMBRE 6 DE 2006

CONSIGNACION

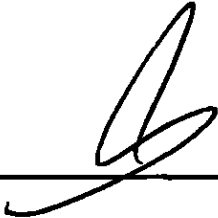
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ILARTE RAISBERR	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	52198870	04/09/2006	3,448,000.

CONCEPTO

CANT. CONTABILISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	
1	TRANITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	\$ 463,000.

SOM: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____





PCT

THE UNIVERSITY OF CHICAGO PRESS

c1nc2c(ncn2C3=C(C(=C(C3)C(F)(F)F)N=C4C(=N1)N=CN=C4O)C5=CC=CC=C5)C6=CC=CC=C6

(1)

WO 2005/089551 A1

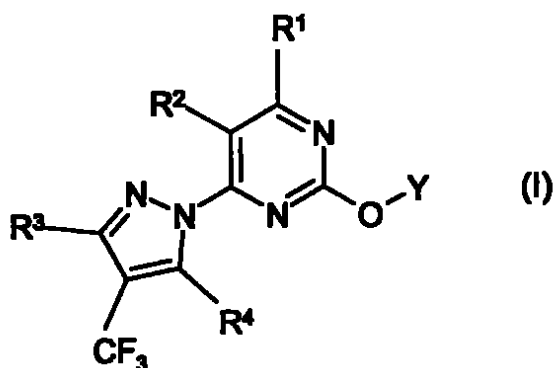
SUBSTITUIERTE 4-(4-TRIFLUORMETHYLPYRAZOLYL)-PYRIMIDINE ALS HERBIZIDE**Substituierte 4-(4-Trifluormethylpyrazolyl)-Pyrimidine**

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Herbizide, insbesondere das der Herbizide aus der Gruppe der Heteroaryl-Pyrazole zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

Aus verschiedenen Schriften ist bereits bekannt, daß bestimmte durch Azol-Reste, wie Pyrazolyl, Imidazolyl und Triazolyl, substituierte Pyridine und Pyrimidine herbizide Eigenschaften besitzen. So sind aus WO 99/28301 Pyridine und Pyrimidine bekannt, die in 2-Position einen Azol-Rest und in 4- bzw. 6-Position einen über ein Kohlenstoffatom gebundenen aromatischen oder heteroaromatischen Rest tragen. WO 98/40379 beschreibt Pyridine und Pyrimidine, die in 2-Position einen Azol-Rest und in 4- bzw. 6-Position einen über ein Sauerstoff-, Stickstoff- oder Schwefelatom gebundenen aromatischen oder heteroaromatischen Rest tragen. Der Azol-Rest in 2-Position kann durch verschiedene Reste substituiert sein. Diese Schrift offenbart verschiedene Substituenten für den Pyrazolylrest, die sich stets in 3-Position befinden. In ACS Symposium Series (2002), 800 (Synthesis and Chemistry of Agrochemicals), Seite 76, werden Pyrimidine, die den Azol-Rest in 4-Position tragen, als herbizid unwirksam offenbart. Diese Verbindungen sind zu den aus oben genannten Schriften bekannten Pyrimidin-Verbindungen regioisomer.

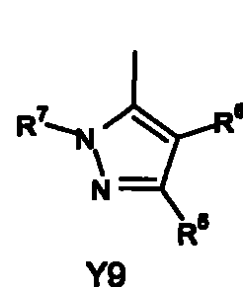
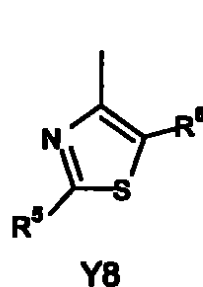
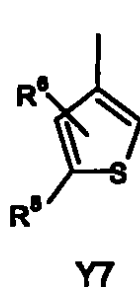
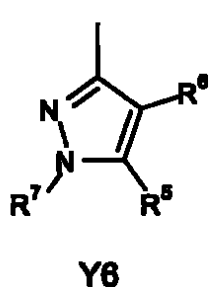
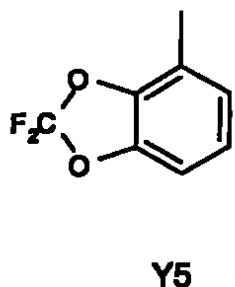
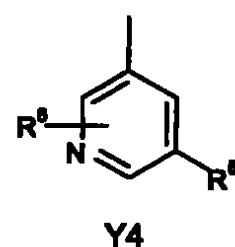
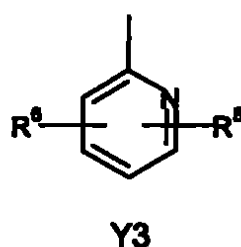
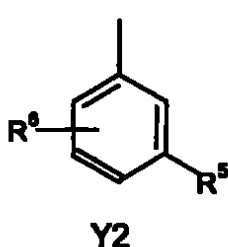
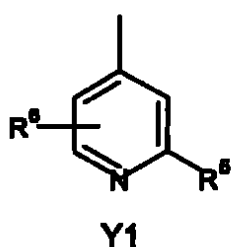
Die aus den vorstehend genannten Schriften bekannten Verbindungen zeigen jedoch häufig eine nicht ausreichende herbizide Wirksamkeit. Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist daher die Bereitstellung von herbizid wirksamen Verbindungen mit – gegenüber den im Stand der Technik offenbarten Verbindungen – verbesserten herbiziden Eigenschaften.

Es wurde nun gefunden, daß bestimmte 4-(4-Trifluormethylpyrazolyl)-Pyrimidine als Herbizide besonders gut geeignet sind. Ein Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel (I), deren N-Oxide und deren Salze,



worin die Reste und Indizes folgende Bedeutungen haben:

Y bedeutet einen Rest aus der Gruppe Y1 bis Y9:



R¹ und R² bedeuten unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Cyano, Isocyano, OH, COOR⁸, COR⁸, CH₂OH, CH₂SH, CH₂NH₂, NO₂, CSNH₂, CONH₂, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₂)-Alkoxy-(C₁-C₂)-alkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₃-C₄)-Alkenyloxy, (C₃-C₄)-Alkynyloxy, (C₁-C₂)-Alkylthio-(C₁-C₂)-alkyl, S(O)_nR⁸, (C₁-C₂)-

3

Alkylsulfonyl-(C₁-C₂)-alkyl, Amino, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₃)-Alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Alkylsulfonylamino oder Di-(C₁-C₄)-Alkylamino, oder

R¹ und R² gemeinsam bedeuten CH₂-CH₂-CH₂, CH₂-CH₂-CH₂-CH₂ oder OCH₂-CH₂-CH₂O;

R³ und R⁴ bedeuten unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy oder Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy;

R⁵ bedeutet Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkylthio, (C₃-C₅)-Cycloalkyl, Halogen-(C₃-C₅)-Cycloalkyl, SF₅, S(O)_nR⁶, (C₂-C₄)-Alkenyl oder (C₂-C₄)-Alkynyl;

R⁶ bedeutet Wasserstoff, Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy oder S(O)_nR⁶;

R⁷ bedeutet (C₁-C₄)-Alkyl;

R⁸ bedeutet Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl oder Halogen-(C₁-C₄)-alkyl;

R⁹ bedeutet Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl;

n bedeutet 0, 1 oder 2.

In Formel (I) und allen nachfolgenden Formeln können Alkyl-, Alkenyl- und Alkynylreste mit mehr als zwei beziehungsweise drei C-Atomen geradkettig oder verzweigt sein. Alkylreste bedeuten Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl. Alkenyl bedeutet demgemäß Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl sowie die verschiedenen Butenyl-Isomeren. Alkynyl bedeutet Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl sowie die verschiedenen Butinyl-Isomeren. Analog sind die Definitionen in ihren zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy und Alkylthio

zu verstehen. So steht Alkinyloxy beispielsweise für $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ und $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$.

Cycloalkyl bedeutet Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

Im Falle einer zwelfach substituierten Aminogruppe, wie Dialkylamino, können diese beiden Substituenten gleich oder verschieden sein.

Halogen bedeutet Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Halogenalkyl bedeutet durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor und/oder Brom, insbesondere durch Fluor oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, z.B. CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CF_3CF_2 , CH_2FCHCl , CCl_3 , CHCl_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; Halogenalkoxy ist z.B. OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$, OCH_2CF_3 und $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; entsprechendes gilt für andere durch Halogen substituierte Reste.

Die Verbindungen der Formel (I) können je nach Art und Verknüpfung der Substituenten als Stereoisomere vorliegen. Liegt beispielsweise eine Doppelbindung vor, können Diastereomere auftreten. Sind beispielsweise ein oder mehrere asymmetrische C-Atome vorhanden, so können Enantiomere und Diastereomere auftreten. Stereoisomere lassen sich aus den bei der Herstellung anfallenden Gemischen nach üblichen Trennmethoden, z.B. durch chromatographische Trennverfahren, erhalten. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft auch alle Stereoisomeren und deren Gemische, die von der allgemeinen Formel (I) umfaßt, jedoch nicht spezifisch definiert sind.

Verbindungen der Formel (I) können grundsätzlich N-Oxide bilden. N-Oxide können gemäß dem Fachmann bekannten Methoden durch Umsetzung mit oxidierenden Reagenzien wie Persäuren, Wasserstoffperoxid und Natriumperborat hergestellt werden. Solche Methoden sind beispielsweise in T.L. Gilchrist, Comprehensive

Organic Synthesis, Volume 7, Seiten 748 bis 750, S.V. Ley, Ed., Pergamon Press beschrieben.

Verbindungen der Formel (I) können grundsätzlich Salze bilden durch Addition mit

- a) Säuren wie Chlorwasserstoff, Bromwasserstoff, Salpetersäure, Phosphorsäure, Schwefelsäure, Essigsäure, Oxalsäure, oder
- b) Basen wie Pyridin, Ammoniak, Triethylamin, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid.

Bevorzugte Ausführungsformen der erfindungsgemäßen Verbindungen umfassen, soweit im Folgenden nicht anders vermerkt, stets auch die N-Oxide und Salze.

Als vorteilhaft haben sich Verbindungen der Formel (I) herausgestellt, worin R^1 und R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Formyl, Vinyl, (C_1-C_4) -Alkyl, Halogen- (C_1-C_4) -Alkyl, oder (C_1-C_4) -Alkoxy bedeuten;

oder

R^1 und R^2 gemeinsam $CH_2CH_2CH_2$ bedeuten;

R^3 und R^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Methyl oder Methoxy bedeuten;

Y einen Rest $Y1$, $Y2$, $Y3$, $Y6$, $Y7$, $Y8$ oder $Y9$ bedeutet,

und die anderen Substituenten und Indices jeweils die weiter oben genannten Bedeutungen haben.

Von näherem Interesse sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

R^1 Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, Trifluormethyl, Methoxy, Methyl oder Ethyl;

R^2 Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy,

oder

R^1 und R^2 gemeinsam $CH_2-CH_2-CH_2$;

R^3 und R^4 unabhängig voneinander Wasserstoff oder Methyl bedeuten,

und die anderen Substituenten und Indices jeweils die weiter oben genannten Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

R^5 Halogen, Cyano, Halogen-(C₁-C₂)-alkyl, Halogen-(C₁-C₂)-alkoxy oder Halogen-(C₁-C₂)-alkylthio bedeutet, und die anderen Substituenten und Indices jeweils die weiter oben genannten Bedeutungen haben.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin

R^2 und R^6 jeweils Wasserstoff bedeuten;

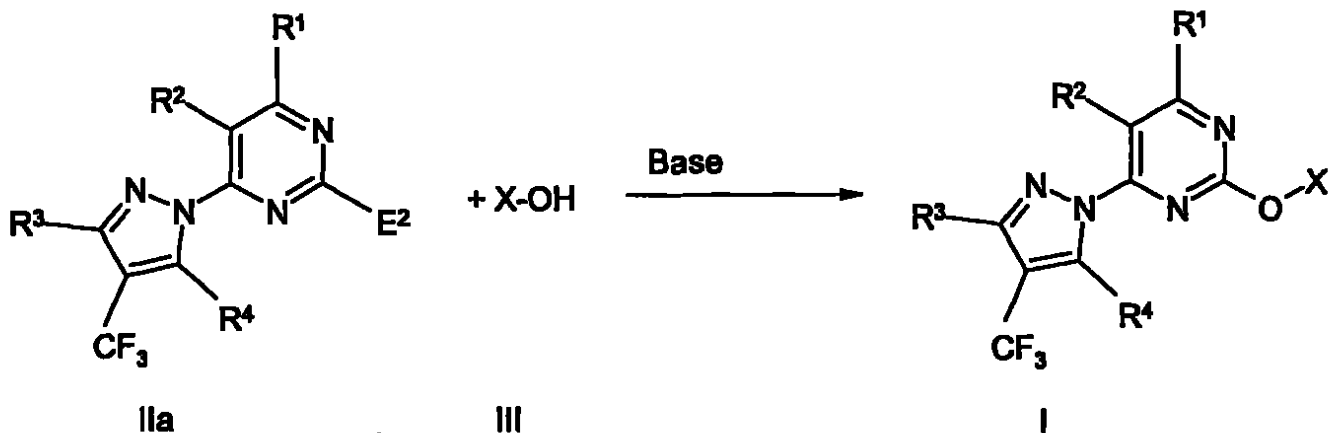
Y für Y1, Y2, Y7, Y8 oder Y9 steht, und die anderen Substituenten und Indices jeweils die weiter oben genannten Bedeutungen haben.

In allen nachfolgend genannten Formeln haben die Substituenten und Symbole, sofern nicht anders definiert, dieselbe Bedeutung wie unter Formel (I) beschrieben.

Erfindungsgemäße Verbindungen können beispielsweise nach den in den folgenden Schemata angegebenen Reaktionswegen hergestellt werden:

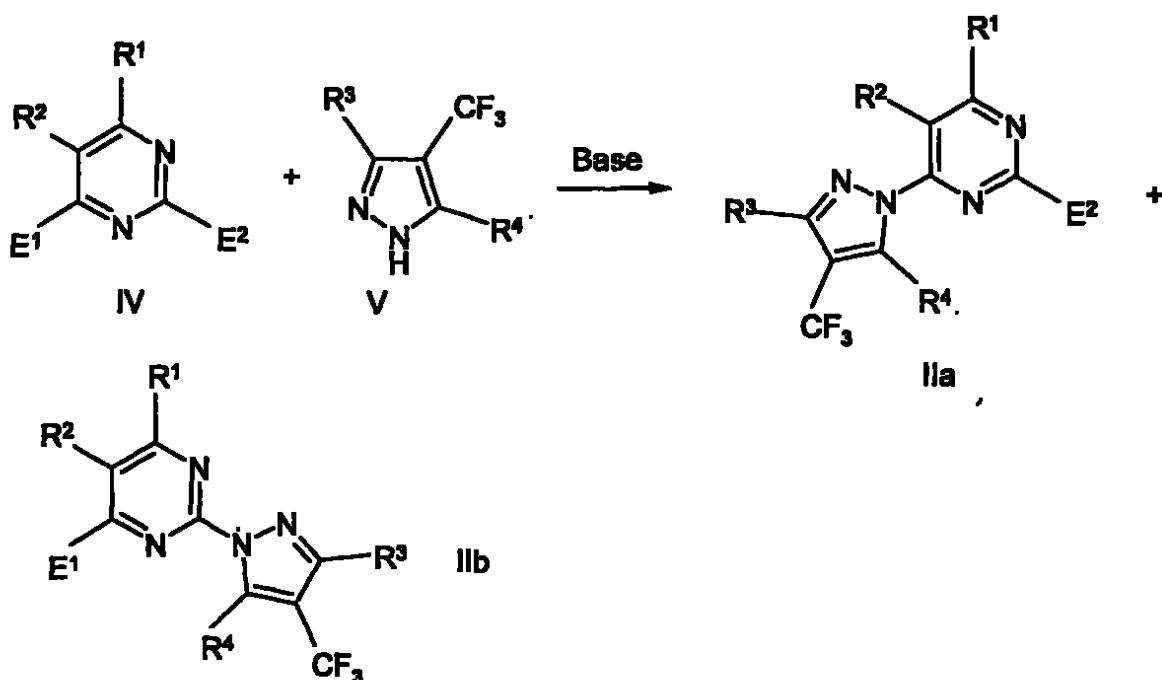
Gemäß Schema 1 können Verbindungen der Formel (I) durch basenkatalysierte nucleophile Substitutionsreaktionen von Hydroxyverbindungen der Formel (III) mit Pyrimidinen der Formel (IIa) hergestellt werden. In der Formel (IIa) steht E^2 für eine Fluchtgruppe wie Halogen, Methylsulfonyl oder Tosyl. Solche nucleophile Substitutionsreaktionen sind dem Fachmann bekannt.

Schema 1



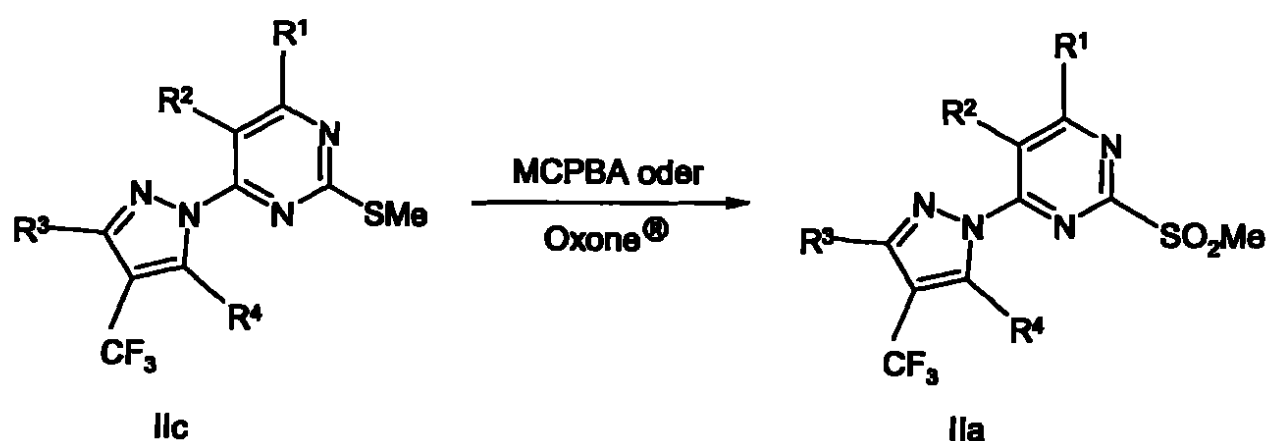
Verbindungen der Formel (IIa), in der E² für Halogen steht, können beispielsweise nach Schema 2 durch basenkatalysierte Substitutionsreaktionen von Pyrimidinen der Formel (IV), in der E¹ und E² für Halogen stehen, mit Pyrazolen der Formel (V) hergestellt werden. Dabei können auch die jeweiligen Regloisomere (IIb) entstehen, die beispielsweise durch chromatographische Aufarbeitung getrennt werden können. Solche Reaktionen sind dem Fachmann bekannt.

Schema 2



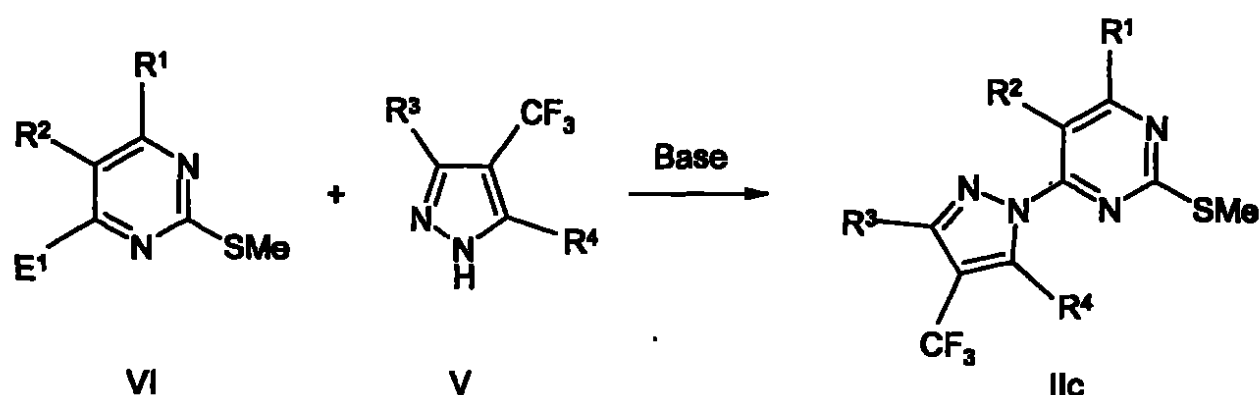
Verbindungen der Formel (IIa), in der E² für Methylsulfonyl steht, können beispielsweise nach Schema 3 durch Oxidation mit m-Chlorperbenzoesäure (MCPBA) oder Oxone[®] aus einer Verbindung der Formel (IIc) hergestellt werden. Solche Reaktionen sind dem Fachmann beispielsweise aus J. March, Advanced Organic Chemistry, John Wiley, New York, 2001, 5th Ed., Seiten 1541 bis 1542 bekannt.

Schema 3



Verbindungen der Formel (IIc) können beispielsweise nach Schema 4 durch basenkatalysierte Umsetzung von Pyrimidinen der Formel (VI), in der E¹ für eine Fluchtgruppe wie Halogen steht, mit Pyrazolen der Formel (V) hergestellt werden.

Schema 4

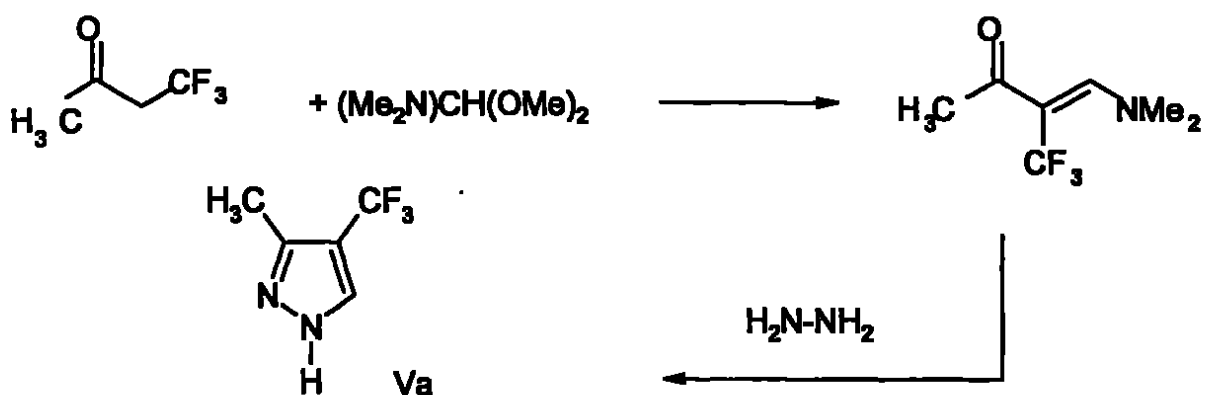


Verbindungen der Formel (VI), in der E¹ für eine Fluchtgruppe wie Halogen steht, können beispielsweise durch Umsetzung von 2-Thiomethyl-4-hydroxypyrimidinen mit

POCl_3 hergestellt werden. Solche dem Fachmann bekannten Methoden werden beispielsweise in Houben-Weyl, Methods of Organic Chemistry, Vol. E 9b, Part 1, 1998, Seiten 209 bis 210 beschrieben. Substituierte 2-Thiomethyl-4-hydroxypyrimidine können gemäß dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden, wie sie beispielsweise in Houben-Weyl, Methods of Organic Chemistry, Vol. E 9b, Part 1, 1998, Seiten 46, 47, 49 und 50 beschrieben sind. Pyrazole der Formel (V) können ebenfalls gemäß dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden. Die Herstellung von 4-Trifluormethylpyrazol ist beispielsweise in Tetrahedron Letters, 37, 1996, Seite 1829 bis 1830 beschrieben.

3-Methyl-4-trifluormethylpyrazol (Va) kann gemäß Schema 5 hergestellt werden.

Schema 5



Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es in der Regel unerheblich, ob die Substanzen im Vorsaats-, Vorauf- oder Nachaufverfahren ausgebracht werden. Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll. Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z.B. Avena,

Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria sowie Cyperusarten aus der annuellen Gruppe und auf seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt. Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z.B. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Sida, Matricaria und Abutilon auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex und Artemisia bei den perennierenden Unkräutern. Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Schadpflanzen wie z.B. Echinochloa, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus und Cyperus werden von den erfindungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft. Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab. Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird. Insbesondere zeigen die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hervorragende Wirkung gegen Amaranthus retroflexus, Avena sp., Echinochloa sp., Cyperus serotinus, Lolium multiflorum, Setaria viridis, Sagittaria pygmaea, Scirpus juncoides, Sinapis sp. und Stellaria media.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z.B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Insbesondere weisen sie eine ausgezeichnete Verträglichkeit in Weizen, Gerste, Mais, Reis und Sojabohne auf. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen oder in Zierpflanzungen.

Aufgrund ihrer herbiziden Eigenschaften können die Wirkstoffe auch zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z. B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.

Bevorzugt ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z. B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten. Vorzugsweise können die Verbindungen der Formel (I) als Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher vorkommenden Pflanzen modifizierte Eigenschaften aufweisen, bestehen beispielsweise in klassischen Züchtungsverfahren und der Erzeugung von Mutanten. Alternativ können neue Pflanzen mit veränderten Eigenschaften mit Hilfe gentechnischer Verfahren erzeugt werden (siehe z. B. EP-A-0221044, EP-A-0131624). Beschrieben wurden beispielsweise in mehreren Fällen

- gentechnische Veränderungen von Kulturpflanzen zwecks Modifikation der in den Pflanzen synthetisierten Stärke (z. B. WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),

- transgene Kulturpflanzen, welche gegen bestimmte Herbizide vom Typ Glufosinate (vgl. z. B. EP-A-0242236, EP-A-242246) oder Glyphosate (WO 92/00377) oder der Sulfonylhamstoffe (EP-A-0257993, US-A-5013659) resistent sind,
- transgene Kulturpflanzen, beispielsweise Baumwolle, mit der Fähigkeit *Bacillus thuringiensis*-Toxine (Bt-Toxine) zu produzieren, welche die Pflanzen gegen bestimmte Schädlinge resistent machen (EP-A-0142924, EP-A-0193259).
- transgene Kulturpflanzen mit modifizierter Fettsäurezusammensetzung (WO 91/13972).

Zahlreiche molekularbiologische Techniken, mit denen neue transgene Pflanzen mit veränderten Eigenschaften hergestellt werden können, sind im Prinzip bekannt; siehe z.B. Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2. Aufl. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; oder Winnacker "Gene und Klonen", VCH Weinheim 2. Auflage 1996 oder Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Für derartige gentechnische Manipulationen können Nucleinsäuremoleküle in Plasmide eingebracht werden, die eine Mutagenese oder eine Sequenzveränderung durch Rekombination von DNA-Sequenzen erlauben. Mit Hilfe der obengenannten Standardverfahren können z. B. Basenaustausche vorgenommen, Teilsequenzen entfernt oder natürliche oder synthetische Sequenzen hinzugefügt werden. Für die Verbindung der DNA-Fragmente untereinander können an die Fragmente Adaptoren oder Linker angesetzt werden.

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA, einer sense-RNA zur Erzielung eines Cosuppressionseffektes oder die Expression mindestens eines entsprechend konstruierten Ribozyms, das spezifisch Transkripte des obengenannten Genprodukts spaltet.

Hierzu können zum einen DNA-Moleküle verwendet werden, die die gesamte codierende Sequenz eines Genprodukts einschließlich eventuell vorhandener flankierender Sequenzen umfassen, als auch DNA-Moleküle, die nur Teile der codierenden Sequenz umfassen, wobei diese Teile lang genug sein müssen, um in den Zellen einen antisense-Effekt zu bewirken. Möglich ist auch die Verwendung von DNA-Sequenzen, die einen hohen Grad an Homologie zu den codierenden Sequenzen eines Genprodukts aufweisen, aber nicht vollkommen identisch sind.

Bei der Expression von Nucleinsäuremolekülen in Pflanzen kann das synthetisierte Protein in jedem beliebigen Kompartiment der pflanzlichen Zelle lokalisiert sein. Um aber die Lokalisation in einem bestimmten Kompartiment zu erreichen, kann z. B. die codierende Region mit DNA-Sequenzen verknüpft werden, die die Lokalisierung in einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige Sequenzen sind dem Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106).

Die transgenen Pflanzenzellen können nach bekannten Techniken zu ganzen Pflanzen regeneriert werden. Bei den transgenen Pflanzen kann es sich prinzipiell um Pflanzen jeder beliebigen Pflanzenspezies handeln, d.h. sowohl monokotyle als auch dikotyle Pflanzen.

So sind transgene Pflanzen erhältlich, die veränderte Eigenschaften durch Überexpression, Suppression oder Inhibierung homologer (= natürlicher) Gene oder Gensequenzen oder Expression heterologer (= fremder) Gene oder Gensequenzen aufweisen.

Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe in transgenen Kulturen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadpflanzen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes

Unkrautspektrum, das bekämpft werden kann, veränderte Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können, vorzugsweise gute Kombinierbarkeit mit den Herbiziden, gegenüber denen die transgene Kultur resistent ist, sowie Beeinflussung von Wuchs und Ertrag der transgenen Kulturpflanzen. Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen als Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in transgenen Kulturpflanzen.

Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Ein weiterer Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide Mittel, die Verbindungen der Formel (I) enthalten. Die Verbindungen der Formel (I) können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (SP), wasserlösliche Pulver (WP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapsel-suspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikro kapseln und Wachse.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Disperglermittel), z.B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykoethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, ligninsulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammernmühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen fein gemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden

ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können z.B. verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykoether, Fettalkoholpolyglykoether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z.B. Sorbitanfettsäure-ester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylen-sorbitanfettsäureester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise – gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln – granuliert werden.

Wasserdispersierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granullierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt.

Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulaten siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I). In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0,05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granullerhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergler-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösungsmittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden,

Fungiziden, sowie mit Safenem, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe einsetzbar, wie sie z.B. in Weed Research 26, 441-445 (1986) oder "The Pesticide Manual", 11th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1997 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als bekannte Herbizide, die mit den Verbindungen der Formel (I) kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (Anmerkung: Die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen, ggf. zusammen mit einer üblichen Codenummer bezeichnet):

acetochlor; acifluorfen; aclonifen; AKH 7088, d.h. $\text{[1-[5-[2-Chloro-4-(trifluoromethyl)-phenoxy]-2-nitrophenyl]-2-methoxyethylidene]-amino]-oxy]-essigsäure}$ und -essigsäuremethylester; alachlor; alloxydim; ametryn; amidosulfuron; amitrol; AMS, d.h. Ammoniumsulfamat; anilofos; asulam; atrazin; azimsulfurone (DPX-A8947); aziprotryn; barban; BAS 516 H, d.h. 5-Fluor-2-phenyl-4H-3,1-benzoxazin-4-on; benazolin; benfluralin; benfuresate; bensulfuron-methyl; bensulide; bentazone; benzofenap; benzofluor; benzoylprop-ethyl; benzthiazuron; bialaphos; bifenox; bromacil; bromobutide; bromofenoxim; bromoxynil; bromuron; buminafos; busoxinone; butachlor; butamifos; butenachlor; buthidazole; butralin; butylate; cafenstrole (CH-900); carbetamide; cafentrazone (ICI-A0051); CDAA, d.h. 2-Chlor-N,N-di-2-propenylacetamid; CDEC, d.h. Diethyldithiocarbaminsäure-2-chlorallylester; chlomethoxyfen; chloramben; chlorazifop-butyl, chlormesulon (ICI-A0051); chlorbromuron; chlorbufam; chlorfenac; chlorflurecol-methyl; chloridazon; chlormuron ethyl; chlomitrofen; chlorotoluron; chloroxuron; chlorpropham; chlorsulfuron; chlorthal-dimethyl; chlorthiamid; cinmethylin; cinosulfuron; clethodim; clodinafop und dessen Esterderivate (z.B. clodinafop-propargyl); clomeprop; cloproxydim; clopyralid; cumyluron (JC 940); cyanazine; cycloate; cyclosulfamuron (AC 104); cycloxydim; cycluron; cyhalofop und dessen Esterderivate (z.B. Butylester, DEH-112); cyperquat; cyprazine; cyprazole; daimuron; 2,4-DB; dalapon;

desmedipham; desmetryn; di-allate; dicamba; dichlobenil; dichlorprop; diclofop und dessen Ester wie diclofop-methyl; diethatyl; difenoxuron; difenzoquat; diflufenican; dimefuron; dimethachlor; dimethametryn; dimethenamid (SAN-582H); dimethazone; clomazon; dimethipin; dimetrasulfuron, dinitramine; dinoseb; dinoterb; diphenamid; dipropetryn; diquat; dithiopyr; diuron; DNOC; eglinazine-ethyl; EL 77, d.h. 5-Cyano-1-(1,1-dimethylethyl)-N-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamid; endothal; EPTC; esprocarb; ethalfuralin; ethametsulfuron-methyl; ethidimuron; ethiozin; ethofumesate; F5231, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid; ethoxyfen und dessen Ester (z.B. Ethylester, HN-252); etobenzanid (HW 52); fenoprop; fenoxan, fenoxaprop und fenoxaprop-P sowie deren Ester, z.B. fenoxaprop-P-ethyl und fenoxaprop-ethyl; fenoxydim; fenuron; flamprop-methyl; flazasulfuron; fluazifop und fluazifop-P und deren Ester, z.B. fluazifop-butyl und fluazifop-P-butyl; fluchloralin; flumetsulam; flumeturon; flumiclorac und dessen Ester (z.B. Pentylester, S-23031); flumioxazin (S-482); flumipropyn; flupoxam (KNW-739); fluorodifen; fluoroglycofen-ethyl; flupropacil (UBIC-4243); fluridone; flurochloridone; fluroxypyr; flurtamone; fomesafen; fosamine; furyloxyfen; glufosinate; glyphosate; halosafen; halosulfuron und dessen Ester (z.B. Methylester, NC-319); haloxyfop und dessen Ester, haloxyfop-P (= R-haloxyfop) und dessen Ester; hexazinone; imazapyr; imazamethabenz-methyl; imazaquin und Salze wie das Ammoniumsalz; loxynil; imazethamethapyr; imazethapyr; Imazosulfuron; isocarbamid; isopropalin; isoproturon; Isouron; isoxaben; isoxapyrifop; karbutilate; lactofen; lenacil; linuron; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidid; metamitron; metazachlor; metham; methabenzthiazuron; methazole; methoxyphenone; methylodymron; metabenzuron, methobenzuron; metobromuron; metolachlor; metosulam (XRD 511); metoxuron; metribuzin; metsulfuron-methyl; MH; molinate; monalide; monolinuron; monuron; monocarbamide dihydrogensulfate; MT 128, d.h. 6-Chlor-N-(3-chlor-2-propenyl)-5-methyl-N-phenyl-3-pyridazinamin; MT 5950, d.h. N-[3-Chlor-4-(1-methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid; naproanilide; napropamide; naptalam; NC 310, d.h. 4-(2,4-dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxypyrazol; neburon; nicosulfuron; nipyracllophen; nitratin; nitrofen; nitrofluorfen; norflurazon; orbencarb; oryzalin; oxadiargyl (RP-020630); oxadiazon; oxyfluorfen; paraquat; pebulate; pendimethalin; perfluidone; phenisopham;

phenmedipham; picloram; pinoxaden; piperophos; piributicarb; pirifenop-butyl; pretilachlor; primisulfuron-methyl; procyazine; prodiamine; profluralin; proglinazine-ethyl; prometon; prometryn; propachlor; propanil; propaquizafop und dessen Ester; propazine; propham; propisochlor; propyzamide; prosulfalin; prosulfocarb; prosulfuron (CGA-152005); prynachlor; pyraclostrobin; pyrazolate; pyrazon; pyrazosulfuron-ethyl; pyrazoxyfen; pyridate; pyriproxyfen (KIH-2031); pyroxyfop und dessen Ester (z.B. Propargylester); quinclorac; quinmerac; quinoxyfop und dessen Esterderivate, quizalofop und quizalofop-P und deren Esterderivate z.B. quizalofop-ethyl; quizalofop-P-terfuryl und -ethyl; renniduron; rimsulfuron (DPX-E 9636); S 275, d.h. 2-[4-Chlor-2-fluor-5-(2-propynyloxy)-phenyl]-4,5,6,7-tetrahydro-2H-Indazol; secbumeton; sethoxydim; siduron; simazine; simetryn; SN 106279, d.h. 2-[[7-[2-Chlor-4-(trifluor-methyl)-phenoxy]-2-naphthalenyl]-oxy]-propansäure und -methylester; sulfentrazone (FMC-97285, F-6285); sulfazuron; sulfometuron-methyl; sulfosate (ICI-A0224); TCA; tebutam (GCP-5544); tebuthiuron; terbacil; terbucarb; terbuchlor; terbumeton; terbuthylazine; terbutryn; TFH 450, d.h. N,N-Diethyl-3-[(2-ethyl-6-methylphenyl)-sulfonyl]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamid; thenylchlor (NSK-850); thiazafluron; thiazopyr (Mon-13200); thidiazimin (SN-24085); thiobencarb; thifensulfuron-methyl; tiocarbazil; trialkoxydim; tri-allate; trisulfuron; triazofenamide; tribenuron-methyl; triclopyr; tridiphenyl; trietazine; trifluralin; triflurosulfuron und Ester (z.B. Methylester, DPX-66037); trimeturon; tsitodef; vemolate; WL 110547, d.h. 5-Phenoxy-1-[3-(trifluormethyl)-phenyl]-1H-tetrazol; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 und KIH-2023.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt. Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B.

zwischen 0,001 und 1,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 und 750 g/ha.

Die nachstehenden Beispiele erläutern die Erfindung.

A. Chemische Beispiele

Herstellung von 6-Ethyl-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-(2-trifluormethylpyridin-4-yl-oxy)pyrimidin (Nr. 1.25):

Eine Mischung aus 0.4 g (1.25 mmol) 6-Ethyl-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-methylsulfonylpyrimidin, 0.2 g (1.25 mmol) 4-Hydroxy-2-trifluormethylpyridin und 0.345 g (2.5 mmol) K_2CO_3 in 20 ml Acetonitril wird 8 h unter Rückfluß gerührt und anschließend über Nacht bei RT stehen gelassen. Die Mischung wird auf 40 ml Wasser gegeben und viermal mit jeweils 20 ml CH_2Cl_2 extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Na_2SO_4 getrocknet und eingeeengt.

Chromatographische Reinigung an Kieselgel mit Heptan/Essigester (1:1) ergibt 0.33 g (65%) 6-Ethyl-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-(2-trifluormethylpyridin-4-yl-oxy)pyrimidin.

1H -NMR: δ [$CDCl_3$] 1.35 (t, 3H), 2.85 (q, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.70 (s, 2H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.70 (s, 1H).

Herstellung von 6-Methyl-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-(2-trifluormethylpyridin-4-yl-oxy)pyrimidin (Nr. 1.13):

Eine Mischung aus 0.63 g (2.4 mmol) 6-Methyl-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-chlorpyrimidin, 0.39 g (2.4 mmol) 4-Hydroxy-2-trifluormethylpyridin und 0.66 g (4.8 mmol) K_2CO_3 in 20 ml Acetonitril wird 8 h unter Rückfluß gerührt und anschließend über Nacht bei RT stehen gelassen. Die Mischung wird auf 40 ml Wasser gegeben und viermal mit jeweils 20 ml CH_2Cl_2 extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Na_2SO_4 getrocknet und eingeeengt.

Chromatographische Reinigung an Kieselgel mit Heptan/Essigester (7:3) ergibt 0.8 g (85%) 6-Methyl-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-(2-trifluormethylpyridin-4-yl-oxy)pyrimidin.

¹H-NMR: δ [CDCl₃] 2.60 (s, 3H), 7.43 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.80 (d, 1H).

Herstellung von 6-Methoxy-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-(1-methyl-3-trifluormethylpyrazol-5-yl-oxy)pyrimidin (Nr. 9.37):

Eine Mischung aus 0.35 g (1.09 mmol) 6-Methoxy-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-methylsulfonylpyrimidin, 0.18 g (1.09 mmol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-2-pyrazolin-5-on und 0.3 g (2.17 mmol) K₂CO₃ in 5 ml Acetonitril wird 8 h unter Rückfluß gerührt und anschließend über Nacht bei RT stehen gelassen. Die Mischung wird auf 40 ml Wasser gegeben und viermal mit jeweils 20 ml CH₂Cl₂ extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Na₂SO₄ getrocknet und eingeeengt. Chromatographische Reinigung an Kieselgel mit Heptan/Essigester (1:1) ergibt 0.38 g (82%) 6-Methoxy-4-(4-trifluormethyl-1H-1-pyrazolyl)-2-(1-methyl-3-trifluormethylpyrazol-5-yl-oxy)pyrimidin.

¹H-NMR: δ [CDCl₃] 3.85 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.24 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.65 (s, 1H).

Herstellung von 3-Methyl-4-trifluormethylpyrazol:

Eine Lösung aus 15 g (119 mmol) 4,4,4-Trifluorbutan-2-on und 28.3 g (238 mmol) N,N-Dimethylformamid dimethylacetal in 100 ml Toluol wird 8 h unter Rückfluß gerührt. Anschließend wird bis zur Trockene eingeeengt. Das Rohprodukt wird in 100 ml Ethanol aufgenommen, mit 18.45 ml Hydrazinhydrat versetzt, dann 8h unter Rückfluß gerührt und wieder eingeeengt. Chromatographische Reinigung an Kieselgel mit Heptan/Essigester (3:7) ergibt 5.4 g (31%) 3-Methyl-4-trifluormethylpyrazol.

¹H-NMR: δ [CDCl₃] 2.40 (s, 3H), 7.75 (s, 1H).

Die in nachfolgenden Tabellen aufgeführten Beispiele wurden analog oben genannten Methoden hergestellt beziehungsweise sind analog den oben genannten Methoden erhältlich.

12
19

Die hier verwendeten Abkürzungen bedeuten:

- Et = Ethyl
- OEt = Ethoxy
- Me = Methyl
- OMe = Methoxy
- EE = Essigester
- Fp. = Festpunkt
- R^f = Retentionswert
- i-Pr = iso-Propyl
- n-Pr = n-Propyl
- RT = Raumtemperatur

Tabelle 1: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

Y = Y1 R⁶ = H

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
1.1	H	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 7.43 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (d, 1H), 8.78 (s, 1H) 8.80 (d, 1H)
1.2	H	H	Me	H	CF ₃	
1.3	H	H	H	Me	CF ₃	
1.4	H	H	H	H	Cl	
1.5	H	H	Me	H	Cl	
1.6	H	H	H	Me	Cl	
1.7	H	H	H	H	CN	
1.8	H	H	Me	H	CN	
1.9	H	H	H	Me	CN	
1.10	H	H	H	H	OCF ₂ H	
1.11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.13	Me	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 7.43 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
1.14	Me	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.45 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 7.40 (dd, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.78 (d, 1H)
1.15	Me	H	H	Me	CF ₃	
1.16	Me	H	H	H	Cl	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 7.16 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.17	Me	H	Me	H	Cl	
1.18	Me	H	H	Me	Cl	
1.19	Me	H	H	H	CN	
1.20	Me	H	Me	H	CN	
1.21	Me	H	H	Me	CN	
1.22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 6.82 (d, 1H), 7.03 (dd, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.25	Et	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.35 (t, 3H), 2.85 (q, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.70 (s, 2H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.26	Et	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.84 (q, 2H), 7.41 (dd, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.78 (d, 1H)
1.27	Et	H	H	Me	CF ₃	
1.28	Et	H	H	H	Cl	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.40 (t, 3H), 2.92 (q, 2H), 7.23 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.88 (s, 1H)
1.29	Et	H	Me	H	Cl	
1.30	Et	H	H	Me	Cl	
1.31	Et	H	H	H	CN	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
1.32	Et	H	Me	H	CN	
1.33	Et	H	H	Me	CN	
1.34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	
1.35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.37	OMe	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 4.00 (s, 3H), 7.15 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.38	OMe	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.40 (s, 1H), 3.98 (s, 3H), 7.08 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.39	OMe	H	H	Me	CF ₃	
1.40	OMe	H	H	H	Cl	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 4.00 (s, 3H), 7.13 (s, 1H), 7.18 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.60 (s, 1H)
1.41	OMe	H	Me	H	Cl	
1.42	OMe	H	H	Me	Cl	
1.43	OMe	H	H	H	CN	
1.44	OMe	H	Me	H	CN	
1.45	OMe	H	H	Me	CN	
1.46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 4.00 (s, 3H), 6.85 (d, 1H), 7.05 (dd, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.60 (s, 1H)
1.47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.49	Cl	H	H	H	CF ₃	
1.50	Cl	H	Me	H	CF ₃	
1.51	Cl	H	H	Me	CF ₃	
1.52	Cl	H	H	H	Cl	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
1.53	Cl	H	Me	H	Cl	
1.54	Cl	H	H	Me	Cl	
1.55	Cl	H	H	H	CN	
1.56	Cl	H	Me	H	CN	
1.57	Cl	H	H	Me	CN	
1.58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	
1.59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.61	CN	H	H	H	CF ₃	
1.62	CN	H	Me	H	CF ₃	
1.63	CN	H	H	Me	CF ₃	
1.64	CN	H	H	H	Cl	
1.65	CN	H	Me	H	Cl	
1.66	CN	H	H	Me	Cl	
1.67	CN	H	H	H	CN	
1.68	CN	H	Me	H	CN	
1.69	CN	H	H	Me	CN	
1.70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	
1.71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.73	H	H	H	H	CF ₂ H	
1.74	Me	H	Me	H	CF ₂ H	
1.75	Me	H	H	Me	CF ₂ H	
1.76	Me	H	H	H	CF ₂ H	
1.77	Et	H	H	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.88 (q, 2H), 6.70 (t, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.72 (d, 1H)

19
11

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
1.78	Et	H	Me	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.84 (q, 2H), 8.70 (t, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.70 (d, 1H)
1.79	Et	H	H	Me	CF ₂ H	
1.80	OMe	H	H	H	CF ₂ H	
1.81	OMe	H	Me	H	CF ₂ H	
1.82	OMe	H	H	Me	CF ₂ H	
1.83	OH	H	H	H	CF ₃	
1.84	OH	H	Me	H	CF ₃	
1.85	OH	H	H	Me	CF ₃	
1.86	OH	H	H	H	OCF ₂ H	
1.87	OH	H	Me	H	OCF ₂ H	
1.88	OH	H	H	Me	OCF ₂ H	
1.89	OH	H	H	H	CF ₂ H	
1.90	OH	H	Me	H	CF ₂ H	
1.91	OH	H	H	Me	CF ₂ H	
1.92	n-Pr	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.00 (t, 3H), 1.80 (m, 2H), 2.80 (t, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.93	n-Pr	H	H	H	Cl	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.00 (t, 3H), 1.80 (m, 2H), 2.80 (t, 2H), 7.18 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.94	CF ₃	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 7.50 (dd, 1H), 7.72 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.83 (d, 1H)
1.95	CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.25 (m, 2H), 3.05 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 7.40 (dd, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.78 (s, 1H)

Tabelle 2: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

Y = Y2

R² = H

R⁶ = H

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
2.1	H	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 7.42 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.85 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
2.2	H	H	Me	H	CF ₃	H	
2.3	H	H	H	Me	CF ₃	H	
2.4	H	H	H	H	Cl	H	
2.5	H	H	Me	H	Cl	H	
2.6	H	H	H	Me	Cl	H	
2.7	H	H	H	H	CN	H	
2.8	H	H	Me	H	CN	H	
2.9	H	H	H	Me	CN	H	
2.10	H	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2.11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2.12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2.13	Me	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 7.28 (s, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.60 (m, 3H), 7.95 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
2.14	Me	H	Me	H	CF ₃	H	
2.15	Me	H	H	Me	CF ₃	H	
2.16	Me	H	H	H	Cl	H	
2.17	Me	H	Me	H	Cl	H	
2.18	Me	H	H	Me	Cl	H	
2.19	Me	H	H	H	CN	H	
2.20	Me	H	Me	H	CN	H	

20
22

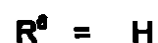
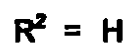
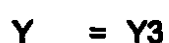
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
2.21	Me	H	H	Me	CN	H	
2.22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2.23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2.24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2.25	Et	H	H	H	CF ₃	H	
2.26	Et	H	Me	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.30 (t, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.80 (q, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.58 (m, 3H), 8.50 (s, 1H)
2.27	Et	H	H	Me	CF ₃	H	
2.28	Et	H	H	H	Cl	H	
2.29	Et	H	Me	H	Cl	H	
2.30	Et	H	H	Me	Cl	H	
2.31	Et	H	H	H	CN	H	
2.32	Et	H	Me	H	CN	H	
2.33	Et	H	H	Me	CN	H	
2.34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2.35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2.36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2.37	OMe	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 3.85 (s, 3H), 6.97 (s, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.50 (m, 3H), 7.80 (s, 1H), 8.44 (s, 1H)
2.38	OMe	H	Me	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.40 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 7.00 (s, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.56 (m, 3H), 8.43 (s, 1H)
2.39	OMe	H	H	Me	CF ₃	H	
2.40	OMe	H	H	H	Cl	H	
2.41	OMe	H	Me	H	Cl	H	
2.42	OMe	H	H	Me	Cl	H	
2.43	OMe	H	H	H	CN	H	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
2.44	OMe	H	Me	H	CN	H	
2.45	OMe	H	H	Me	CN	H	
2.46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2.47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2.48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2.49	Cl	H	H	H	CF ₃	H	
2.50	Cl	H	Me	H	CF ₃	H	
2.51	Cl	H	H	Me	CF ₃	H	
2.52	Cl	H	H	H	Cl	H	
2.53	Cl	H	Me	H	Cl	H	
2.54	Cl	H	H	Me	Cl	H	
2.55	Cl	H	H	H	CN	H	
2.56	Cl	H	Me	H	CN	H	
2.57	Cl	H	H	Me	CN	H	
2.58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2.59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2.60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2.61	CN	H	H	H	CF ₃	H	
2.62	CN	H	Me	H	CF ₃	H	
2.63	CN	H	H	Me	CF ₃	H	
2.64	CN	H	H	H	Cl	H	
2.65	CN	H	Me	H	Cl	H	
2.66	CN	H	H	Me	Cl	H	
2.67	CN	H	H	H	CN	H	
2.68	CN	H	Me	H	CN	H	
2.69	CN	H	H	Me	CN	H	
2.70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	H	

24
23

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
2.71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2.72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2.73	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 7.45 (m, 1H), 7.60 (m, 3H), 7.70 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.63 (s, 1H)
2.74	n-Pr	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.00 (t, 3H), 2.80 (m, 2H), 2.78 (t, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.58 (m, 3H), 7.95 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
2.75	n-Pr	H	H	H	CF ₃	4-F	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.00 (t, 3H), 2.80 (m, 2H), 2.76 (t, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.63 (s, 1H)
2.76	Et	H	H	H	CF ₃	4-F	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.30 (t, 3H), 2.80 (q, 4H), 7.30 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.94 (s, 1H)
2.77	Et	H	Me	H	CF ₃	4-F	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.30 (t, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.80 (q, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.55 (s, 1H)
2.78	CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	H	CF ₃	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.20 (m, 2H), 3.00 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.55 (m, 3H), 7.92 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)

Tabelle 3: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

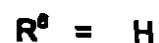
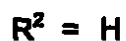
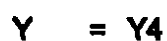


Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
3.1	H	H	H	CF ₃	
3.2	H	Me	H	CF ₃	
3.3	H	H	Me	CF ₃	
3.4	H	H	H	Cl	
3.5	H	Me	H	Cl	
3.6	H	H	Me	Cl	
3.7	H	H	H	CN	
3.8	H	Me	H	CN	
3.9	H	H	Me	CN	
3.10	H	H	H	OCF ₂ H	
3.11	H	Me	H	OCF ₂ H	
3.12	H	H	Me	OCF ₂ H	
3.13	Me	H	H	CF ₃	
3.14	Me	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.55 (s, 3H), 7.35 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.03 (dd, 1H), 8.82 (s, 1H)
3.15	Me	H	Me	CF ₃	
3.16	Me	H	H	Cl	
3.17	Me	Me	H	Cl	
3.18	Me	H	Me	Cl	
3.19	Me	H	H	CN	
3.20	Me	Me	H	CN	
3.21	Me	H	Me	CN	
3.22	Me	H	H	OCF ₂ H	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
3.23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
3.24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
3.25	Et	H	H	CF ₃	
3.26	Et	Me	H	CF ₃	
3.27	Et	H	Me	CF ₃	
3.28	Et	H	H	Cl	
3.29	Et	Me	H	Cl	
3.30	Et	H	Me	Cl	
3.31	Et	H	H	CN	
3.32	Et	Me	H	CN	
3.33	Et	H	Me	CN	
3.34	Et	H	H	OCF ₂ H	
3.35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
3.36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
3.37	OMe	H	H	CF ₃	
3.38	OMe	Me	H	CF ₃	
3.39	OMe	H	Me	CF ₃	
3.40	OMe	H	H	Cl	
3.41	OMe	Me	H	Cl	
3.42	OMe	H	Me	Cl	
3.43	OMe	H	H	CN	
3.44	OMe	Me	H	CN	
3.45	OMe	H	Me	CN	
3.46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
3.47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
3.48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
3.49	Cl	H	H	CF ₃	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
3.50	Cl	Me	H	CF ₃	
3.51	Cl	H	Me	CF ₃	
3.52	Cl	H	H	Cl	
3.53	Cl	Me	H	Cl	
3.54	Cl	H	Me	Cl	
3.55	Cl	H	H	CN	
3.56	Cl	Me	H	CN	
3.57	Cl	H	Me	CN	
3.58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
3.59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	
3.60	Cl	H	Me	OCF ₂ H	
3.61	CN	H	H	CF ₃	
3.62	CN	Me	H	CF ₃	
3.63	CN	H	Me	CF ₃	
3.64	CN	H	H	Cl	
3.65	CN	Me	H	Cl	
3.66	CN	H	Me	Cl	
3.67	CN	H	H	CN	
3.68	CN	Me	H	CN	
3.69	CN	H	Me	CN	
3.70	CN	H	H	OCF ₂ H	
3.71	CN	Me	H	OCF ₂ H	
3.72	CN	H	Me	OCF ₂ H	

Tabelle 4: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:



Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
4.1	H	H	H	CF ₃	
4.2	H	Me	H	CF ₃	
4.3	H	H	Me	CF ₃	
4.4	H	H	H	Cl	
4.5	H	Me	H	Cl	
4.6	H	H	Me	Cl	
4.7	H	H	H	CN	
4.8	H	Me	H	CN	
4.9	H	H	Me	CN	
4.10	H	H	H	OCF ₂ H	
4.11	H	Me	H	OCF ₂ H	
4.12	H	H	Me	OCF ₂ H	
4.13	Me	H	H	CF ₃	
4.14	Me	Me	H	CF ₃	
4.15	Me	H	Me	CF ₃	
4.16	Me	H	H	Cl	
4.17	Me	Me	H	Cl	
4.18	Me	H	Me	Cl	
4.19	Me	H	H	CN	
4.20	Me	Me	H	CN	
4.21	Me	H	Me	CN	
4.22	Me	H	H	OCF ₂ H	
4.23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
4.24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
4.25	Et	H	H	CF ₃	
4.26	Et	Me	H	CF ₃	
4.27	Et	H	Me	CF ₃	
4.28	Et	H	H	Cl	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
4.29	Et	Me	H	Cl	
4.30	Et	H	Me	Cl	
4.31	Et	H	H	CN	
4.32	Et	Me	H	CN	
4.33	Et	H	Me	CN	
4.34	Et	H	H	OCF ₂ H	
4.35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
4.36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
4.37	OMe	H	H	CF ₃	
4.38	OMe	Me	H	CF ₃	
4.39	OMe	H	Me	CF ₃	
4.40	OMe	H	H	Cl	
4.41	OMe	Me	H	Cl	
4.42	OMe	H	Me	Cl	
4.43	OMe	H	H	CN	
4.44	OMe	Me	H	CN	
4.45	OMe	H	Me	CN	
4.46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
4.47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
4.48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
4.49	Cl	H	H	CF ₃	
4.50	Cl	Me	H	CF ₃	
4.51	Cl	H	Me	CF ₃	
4.52	Cl	H	H	Cl	
4.53	Cl	Me	H	Cl	
4.54	Cl	H	Me	Cl	
4.55	Cl	H	H	CN	
4.56	Cl	Me	H	CN	
4.57	Cl	H	Me	CN	
4.58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
4.59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	
4.60	Cl	H	Me	OCF ₂ H	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
4.61	CN	H	H	CF ₃	
4.62	CN	Me	H	CF ₃	
4.63	CN	H	Me	CF ₃	
4.64	CN	H	H	Cl	
4.65	CN	Me	H	Cl	
4.66	CN	H	Me	Cl	
4.67	CN	H	H	CN	
4.68	CN	Me	H	CN	
4.69	CN	H	Me	CN	
4.70	CN	H	H	OCF ₂ H	
4.71	CN	Me	H	OCF ₂ H	
4.72	CN	H	Me	OCF ₂ H	

Tabelle 5: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

Y = Y5 R² = H

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	Physikal. Daten
5.1	H	H	H	
5.2	H	Me	H	
5.3	H	H	Me	
5.4	H	H	H	
5.5	H	Me	H	
5.6	H	H	Me	
5.7	H	H	H	
5.8	H	Me	H	
5.9	H	H	Me	
5.10	H	H	H	
5.11	H	Me	H	
5.12	H	H	Me	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	Physikal. Daten
5.13	Me	H	H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.58 (s, 3H), 7.03 (m, 2H), 7.15 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.62 (s, 1H)
5.14	Me	Me	H	
5.15	Me	H	Me	
5.16	Me	H	H	
5.17	Me	Me	H	
5.18	Me	H	Me	
5.19	Me	H	H	
5.20	Me	Me	H	
5.21	Me	H	Me	
5.22	Me	H	H	
5.23	Me	Me	H	
5.24	Me	H	Me	
5.25	Et	H	H	
5.26	Et	Me	H	
5.27	Et	H	Me	
5.28	Et	H	H	
5.29	Et	Me	H	
5.30	Et	H	Me	
5.31	Et	H	H	
5.32	Et	Me	H	
5.33	Et	H	Me	
5.34	Et	H	H	
5.35	Et	Me	H	
5.36	Et	H	Me	
5.37	OMe	H	H	
5.38	OMe	Me	H	
5.39	OMe	H	Me	
5.40	OMe	H	H	
5.41	OMe	Me	H	
5.42	OMe	H	Me	
5.43	OMe	H	H	

25
27

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	Physikal. Daten
5.44	OMe	Me	H	
5.45	OMe	H	Me	
5.46	OMe	H	H	
5.47	OMe	Me	H	
5.48	OMe	H	Me	
5.49	Cl	H	H	
5.50	Cl	Me	H	
5.51	Cl	H	Me	
5.52	Cl	H	H	
5.53	Cl	Me	H	
5.54	Cl	H	Me	
5.55	Cl	H	H	
5.56	Cl	Me	H	
5.57	Cl	H	Me	
5.58	Cl	H	H	
5.59	Cl	Me	H	
5.60	Cl	H	Me	
5.61	CN	H	H	
5.62	CN	Me	H	
5.63	CN	H	Me	
5.64	CN	H	H	
5.65	CN	Me	H	
5.66	CN	H	Me	
5.67	CN	H	H	
5.68	CN	Me	H	
5.69	CN	H	Me	
5.70	CN	H	H	
5.71	CN	Me	H	
5.72	CN	H	Me	

Tabelle 6: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

$Y = Y6$ $R^2, R^6 = H$ $R^7 = Et$

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
6.1	H	H	H	CF ₃	
6.2	H	Me	H	CF ₃	
6.3	H	H	Me	CF ₃	
6.4	H	H	H	Cl	
6.5	H	Me	H	Cl	
6.6	H	H	Me	Cl	
6.7	H	H	H	CN	
6.8	H	Me	H	CN	
6.9	H	H	Me	CN	
6.10	H	H	H	OCF ₂ H	
6.11	H	Me	H	OCF ₂ H	
6.12	H	H	Me	OCF ₂ H	
6.13	Me	H	H	CF ₃	
6.14	Me	Me	H	CF ₃	
6.15	Me	H	Me	CF ₃	
6.16	Me	H	H	Cl	
6.17	Me	Me	H	Cl	
6.18	Me	H	Me	Cl	
6.19	Me	H	H	CN	
6.20	Me	Me	H	CN	
6.21	Me	H	Me	CN	
6.22	Me	H	H	OCF ₂ H	
6.23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
6.24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
6.25	Et	H	H	CF ₃	
6.26	Et	Me	H	CF ₃	
6.27	Et	H	Me	CF ₃	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
6.28	Et	H	H	Cl	
6.29	Et	Me	H	Cl	
6.30	Et	H	Me	Cl	
6.31	Et	H	H	CN	
6.32	Et	Me	H	CN	
6.33	Et	H	Me	CN	
6.34	Et	H	H	OCF ₂ H	
6.35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
6.36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
6.37	OMe	H	H	CF ₃	
6.38	OMe	Me	H	CF ₃	
6.39	OMe	H	Me	CF ₃	
6.40	OMe	H	H	Cl	
6.41	OMe	Me	H	Cl	
6.42	OMe	H	Me	Cl	
6.43	OMe	H	H	CN	
6.44	OMe	Me	H	CN	
6.45	OMe	H	Me	CN	
6.46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
6.47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
6.48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
6.49	Cl	H	H	CF ₃	
6.50	Cl	Me	H	CF ₃	
6.51	Cl	H	Me	CF ₃	
6.52	Cl	H	H	Cl	
6.53	Cl	Me	H	Cl	
6.54	Cl	H	Me	Cl	
6.55	Cl	H	H	CN	
6.56	Cl	Me	H	CN	
6.57	Cl	H	Me	CN	
6.58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
6.59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
6.60	Cl	H	Me	OCF ₂ H	
6.61	CN	H	H	CF ₃	
6.62	CN	Me	H	CF ₃	
6.63	CN	H	Me	CF ₃	
6.64	CN	H	H	Cl	
6.65	CN	Me	H	Cl	
6.66	CN	H	Me	Cl	
6.67	CN	H	H	CN	
6.68	CN	Me	H	CN	
6.69	CN	H	Me	CN	
6.70	CN	H	H	OCF ₂ H	
6.71	CN	Me	H	OCF ₂ H	
6.72	CN	H	Me	OCF ₂ H	
6.73	Me	H	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.50 (t, 3H, 2.58 (s, 3H), 4.25 (q, 2H), 6.25 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)

Tabelle 7: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

Y = Y7 R⁶ = H

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
7.1	H	H	H	H	CF ₃	
7.2	H	H	Me	H	CF ₃	
7.3	H	H	H	Me	CF ₃	
7.4	H	H	H	H	Cl	
7.5	H	H	Me	H	Cl	
7.6	H	H	H	Me	Cl	
7.7	H	H	H	H	CN	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
7.8	H	H	Me	H	CN	
7.9	H	H	H	Me	CN	
7.10	H	H	H	H	OCF ₂ H	
7.11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	
7.12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	
7.13	Me	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.45 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)
7.14	Me	H	Me	H	CF ₃	
7.15	Me	H	H	Me	CF ₃	
7.16	Me	H	H	H	Cl	
7.17	Me	H	Me	H	Cl	
7.18	Me	H	H	Me	Cl	
7.19	Me	H	H	H	CN	
7.20	Me	H	Me	H	CN	
7.21	Me	H	H	Me	CN	
7.22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	
7.23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	
7.24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	
7.25	Et	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.87 (q, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)
7.26	Et	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.43 (s, 2H), 2.83 (q, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.46 (m, 1H), 7.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
7.27	Et	H	H	Me	CF ₃	
7.28	Et	H	H	H	Cl	
7.29	Et	H	Me	H	Cl	
7.30	Et	H	H	Me	Cl	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
7.31	Et	H	H	H	CN	
7.32	Et	H	Me	H	CN	
7.33	Et	H	H	Me	CN	
7.34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	
7.35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	
7.36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	
7.37	OMe	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 4.00 (s, 3H), 7.05 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.90 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
7.38	OMe	H	Me	H	CF ₃	
7.39	OMe	H	H	Me	CF ₃	
7.40	OMe	H	H	H	Cl	
7.41	OMe	H	Me	H	Cl	
7.42	OMe	H	H	Me	Cl	
7.43	OMe	H	H	H	CN	
7.44	OMe	H	Me	H	CN	
7.45	OMe	H	H	Me	CN	
7.46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	
7.47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	
7.48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	
7.49	Cl	H	H	H	CF ₃	
7.50	Cl	H	Me	H	CF ₃	
7.51	Cl	H	H	Me	CF ₃	
7.52	Cl	H	H	H	Cl	
7.53	Cl	H	Me	H	Cl	
7.54	Cl	H	H	Me	Cl	
7.55	Cl	H	H	H	CN	
7.56	Cl	H	Me	H	CN	

22
30

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
7.57	Cl	H	H	Me	CN	
7.58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	
7.59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	
7.60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	
7.61	CN	H	H	H	CF ₃	
7.62	CN	H	Me	H	CF ₃	
7.63	CN	H	H	Me	CF ₃	
7.64	CN	H	H	H	Cl	
7.65	CN	H	Me	H	Cl	
7.66	CN	H	H	Me	Cl	
7.67	CN	H	H	H	CN	
7.68	CN	H	Me	H	CN	
7.69	CN	H	H	Me	CN	
7.70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	
7.71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	
7.72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	
7.73	n-Pr	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.00 (t, 3H), 2.43 (s, 1H), 2.80 (t, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.46 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 8.72 (s, 1H)
7.74	CH ₂ CH ₂ CH ₂			Me	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.20 (m, 2H), 3.06 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.97 (s, 1H), 8.73 (s, 1H)

Tabelle 8: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

Y = Y8 R² = H R⁶ = H

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
8.1	H	H	H	CF ₃	
8.2	H	Me	H	CF ₃	
8.3	H	H	Me	CF ₃	
8.4	H	H	H	Cl	
8.5	H	Me	H	Cl	
8.6	H	H	Me	Cl	
8.7	H	H	H	CN	
8.8	H	Me	H	CN	
8.9	H	H	Me	CN	
8.10	H	H	H	OCF ₂ H	
8.11	H	Me	H	OCF ₂ H	
8.12	H	H	Me	OCF ₂ H	
8.13	Me	H	H	CF ₃	
8.14	Me	Me	H	CF ₃	
8.15	Me	H	Me	CF ₃	
8.16	Me	H	H	Cl	
8.17	Me	Me	H	Cl	
8.18	Me	H	Me	Cl	
8.19	Me	H	H	CN	
8.20	Me	Me	H	CN	
8.21	Me	H	Me	CN	
8.22	Me	H	H	OCF ₂ H	
8.23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
8.24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
8.25	Et	H	H	CF ₃	
8.26	Et	Me	H	CF ₃	
8.27	Et	H	Me	CF ₃	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
8.28	Et	H	H	Cl	
8.29	Et	Me	H	Cl	
8.30	Et	H	Me	Cl	
8.31	Et	H	H	CN	
8.32	Et	Me	H	CN	
8.33	Et	H	Me	CN	
8.34	Et	H	H	OCF ₂ H	
8.35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
8.36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
8.37	OMe	H	H	CF ₃	
8.38	OMe	Me	H	CF ₃	
8.39	OMe	H	Me	CF ₃	
8.40	OMe	H	H	Cl	
8.41	OMe	Me	H	Cl	
8.42	OMe	H	Me	Cl	
8.43	OMe	H	H	CN	
8.44	OMe	Me	H	CN	
8.45	OMe	H	Me	CN	
8.46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
8.47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
8.48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
8.49	Cl	H	H	CF ₃	
8.50	Cl	Me	H	CF ₃	
8.51	Cl	H	Me	CF ₃	
8.52	Cl	H	H	Cl	
8.53	Cl	Me	H	Cl	
8.54	Cl	H	Me	Cl	
8.55	Cl	H	H	CN	
8.56	Cl	Me	H	CN	
8.57	Cl	H	Me	CN	
8.58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
8.59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
8.60	Cl	H	Me	OCF ₂ H	
8.61	CN	H	H	CF ₃	
8.62	CN	Me	H	CF ₃	
8.63	CN	H	Me	CF ₃	
8.64	CN	H	H	Cl	
8.65	CN	Me	H	Cl	
8.66	CN	H	Me	Cl	
8.67	CN	H	H	CN	
8.68	CN	Me	H	CN	
8.69	CN	H	Me	CN	
8.70	CN	H	H	OCF ₂ H	
8.71	CN	Me	H	OCF ₂ H	
8.72	CN	H	Me	OCF ₂ H	

Tabelle 9: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

$$Y = Y_9$$
$$R^d = H$$
$$R^7 = \text{Me}$$

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
9.1	H	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 3.85 (s, 3H), 6.46 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.80 (s, 1H)
9.2	H	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.45 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
9.3	H	H	H	Me	CF ₃	
9.4	H	H	H	H	Cl	
9.5	H	H	Me	H	Cl	
9.6	H	H	H	Me	Cl	
9.7	H	H	H	H	CN	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
9.8	H	H	Me	H	CN	
9.9	H	H	H	Me	CN	
9.10	H	H	H	H	OCF ₂ H	
9.11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	
9.12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	
9.13	Me	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.47 (s, 1H), 7.95 (d, 1H), 8.75 (d, 1H)
9.14	Me	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.40 (s, 3H), 2.60 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
9.15	Me	H	H	Me	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.52 (s, 3H), 2.60 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 6.35 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.82 (s, 1H)
9.16	Me	H	H	H	Cl	
9.17	Me	H	Me	H	Cl	
9.18	Me	H	H	Me	Cl	
9.19	Me	H	H	H	CN	
9.20	Me	H	Me	H	CN	
9.21	Me	H	H	Me	CN	
9.22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	
9.23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	
9.24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	
9.25	Et	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 3.86 (s, 3H), 6.47 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)
9.26	Et	H	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.34 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.80 (q, 2H), 3.95 (s, 3H), 6.50 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
9.27	Et	H	H	Me	CF ₃	
9.28	Et	H	H	H	Cl	
9.29	Et	H	Me	H	Cl	
9.30	Et	H	H	Me	Cl	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
9.31	Et	H	H	H	CN	
9.32	Et	H	Me	H	CN	
9.33	Et	H	H	Me	CN	
9.34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	
9.35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	
9.36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	
9.37	OMe	H	H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 3.85 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.85 (s, 1H)
9.38	OMe	H	Me	H	CF ₃	
9.39	OMe	H	H	Me	CF ₃	
9.40	OMe	H	H	H	Cl	
9.41	OMe	H	Me	H	Cl	
9.42	OMe	H	H	Me	Cl	
9.43	OMe	H	H	H	CN	
9.44	OMe	H	Me	H	CN	
9.45	OMe	H	H	Me	CN	
9.46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	
9.47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	
9.48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	
9.49	Cl	H	H	H	CF ₃	
9.50	Cl	H	Me	H	CF ₃	
9.51	Cl	H	H	Me	CF ₃	
9.52	Cl	H	H	H	Cl	
9.53	Cl	H	Me	H	Cl	
9.54	Cl	H	H	Me	Cl	
9.55	Cl	H	H	H	CN	
9.56	Cl	H	Me	H	CN	
9.57	Cl	H	H	Me	CN	
9.58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	
9.59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	
9.60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	

34
33

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Physikal. Daten
9.61	CN	H	H	H	CF ₃	
9.62	CN	H	Me	H	CF ₃	
9.63	CN	H	H	Me	CF ₃	
9.64	CN	H	H	H	Cl	
9.65	CN	H	Me	H	Cl	
9.66	CN	H	H	Me	Cl	
9.67	CN	H	H	H	CN	
9.68	CN	H	Me	H	CN	
9.69	CN	H	H	Me	CN	
9.70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	
9.71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	
9.72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	
9.73	H	Et	H	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 3.82 (s, 3H), 6.40 (s, 1H), 6.63 (t, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)
9.74	H	Et	Me	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.35 (t, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.85 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 6.40 (s, 1H), 6.61 (t, 1H), 7.60 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
9.75	H	H	H	H	o-Pr	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 0.75 (m, 2H), 0.93 (m, 2H), 1.93 (m, 1H), 3.68 (s, 3H), 5.80 (s, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.68 (d, 1H), 8.00 (s, 1H)
9.76	H	Me	H	H	o-Pr	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 0.75 (m, 2H), 0.92 (m, 2H), 1.92 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 5.80 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)
9.77	CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.20 (m, 2H), 3.05 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 3.97 (s, 3H), 6.50 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

Tabelle 10: Erfindungsgemäße Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin die Substituenten und Symbole folgende Bedeutungen haben:

Y = Y9 R², R⁴, R⁶ = H R⁷ = Et

Nr.	R ¹	R ³	R ⁵	Physikal. Daten
9.78	Me	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.60 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 6.40 (s, 1H), 6.64 (t, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)
9.79	OMe	Me	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 2.43 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 7.08 (s, 1H), 8.55 (s, 1H)
9.80	OMe	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.45 (t, 3H), 4.00 (s, 3H), 4.15 (q, 2H), 6.35 (s, 1H), 6.62 (t, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.65 (s, 1H)
9.81	Et	H	CF ₂ H	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.40 (t, 3H), 1.55 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 4.30 (q, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.80 (t, 1H), 7.64 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 8.78 (s, 1H)
9.82	Me	H	CF ₃	¹ H-NMR: δ [CDCl ₃] 1.48 (t, 3H), 2.60 (s, 3H), 4.20 (q, 2H), 6.42 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)

B. Formulierungsbeispiele

1. Stäubemittel

Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der allgemeinen Formel (I) und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

2. Dispergierbares Pulver

Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der allgemeinen Formel (I), 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiernittel mischt und in einer Stößmühle mahlt.

3. Dispersionskonzentrat

Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile einer Verbindung der allgemeinen Formel (I), 6 Gew.-Teile Alkylphenolpolyglykolether (@Triton X 207), 3 Gew.-Teile Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teile paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

4. Emulgierbares Konzentrat

Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der allgemeinen Formel (I), 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösemittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.

5. Wasserdispersierbares Granulat

Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten, indem man 75 Gew.-Teile einer Verbindung der allgemeinen Formel (I),

10	"	ligninsulfonsaures Calcium,
5	"	Natriumlaurylsulfat,
3	"	Polyvinylalkohol und
7	"	Kaolin

mischt, auf einer Stößmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.

Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man 25 Gew.-Teile einer Verbindung der allgemeinen Formel (I),

5	"	2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium,
2	"	oleoylmethyltaurinsaures Natrium,
1	"	Polyvinylalkohol,
17	"	Calciumcarbonat und
50	"	Wasser

auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

C. Biologische Beispiele

1. Herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen im Voraufbau

Samen von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen werden in Papptöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wäßrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert. Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. Auflaufschäden erfolgt nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen nach einer Versuchszeit von 3 bis 4 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Dabei zeigen beispielsweise die erfindungsgemäßen Verbindungen der Beispiele Nr. 1.13, 1.14, 1.25, 1.26, 1.39 und 1.46 bei einer Dosierung von 1000 g und weniger als 1000 g Aktivsubstanz pro Hektar eine 100 %ige Wirkung gegen *Amaranthus retroflexus*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis* und *Stellaria media*. Bei gleicher Dosierung zeigen beispielsweise die erfindungsgemäßen Verbindungen der Beispiele Nr. 7.13, 9.13 und 9.14 eine 100 %ige Wirkung gegen *Amaranthus retroflexus*, *Setaria viridis* und *Stellaria media*.

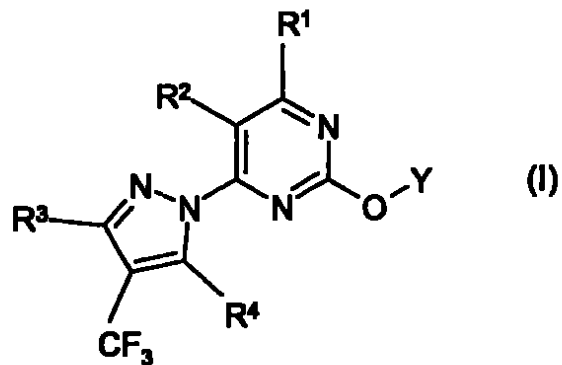
2. Herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen im Nachaufbau

Samen von mono- und dikotylen Schadpflanzen werden in Papptöpfen in sandigem Lehm Boden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Zwei bis drei Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt. Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach 3 bis 4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus

unter optimalen Wachstumsbedingungen wird die Wirkung der Verbindungen bonitiert. Dabei zeigen beispielsweise bei einer Dosierung von 1000 g und weniger als 1000 g Aktivsubstanz pro Hektar die erfindungsgemäßen Verbindungen der Beispiele Nr. 1.46 und 9.25 eine 100 %ige Wirkung gegen *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Sinapis arvensis* und *Stellaria media*.

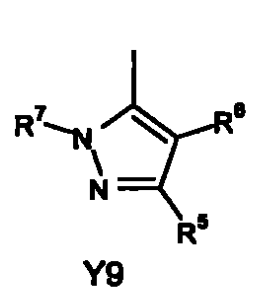
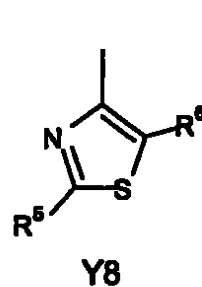
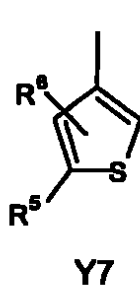
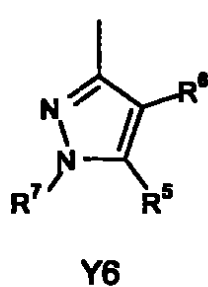
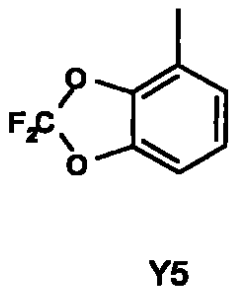
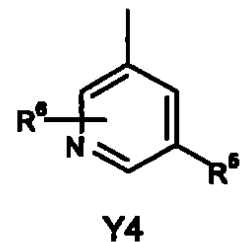
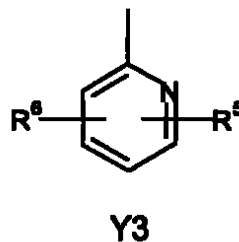
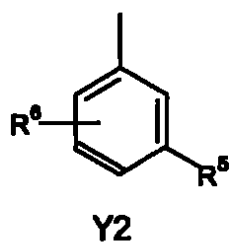
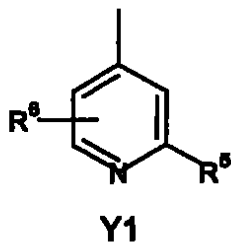
Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel (I), deren N-Oxide und deren Salze,



worin die Reste und Indizes folgende Bedeutungen haben:

Y bedeutet einen Rest aus der Gruppe Y1 bis Y9:



R¹ und R² bedeuten unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Cyano, Isocyano, Hydroxy, COOR⁹, COR⁹, CH₂OH, CH₂SH, CH₂NH₂, NO₂, CSNH₂, CONH₂,

57

(C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₂)-Alkoxy-(C₁-C₂)-alkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl, (C₂-C₄)-Alkynyl, (C₃-C₄)-Alkenyloxy, (C₃-C₄)-Alkynyloxy, (C₁-C₂)-Alkylthio-(C₁-C₂)-alkyl, S(O)_nR⁸, (C₁-C₂)-Alkylsulfonyl-(C₁-C₂)-alkyl, Amino, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₃)-Alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)-Alkylsulfonylamino oder Di-(C₁-C₄)-Alkylamino,

oder

R¹ und R² gemeinsam bedeuten CH₂-CH₂-CH₂, CH₂-CH₂-CH₂-CH₂ oder OCH₂-CH₂-CH₂O;

R³ und R⁴ bedeuten unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy oder Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy;

R⁵ bedeutet Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkylthio, (C₃-C₅)-Cycloalkyl, Halogen-(C₃-C₅)-Cycloalkyl, SF₅, S(O)_nR⁸, (C₂-C₄)-Alkenyl oder (C₂-C₄)-Alkynyl;

R⁶ bedeutet Wasserstoff, Halogen, Cyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, Halogen-(C₁-C₄)-alkoxy oder S(O)_nR⁸;

R⁷ bedeutet (C₁-C₄)-Alkyl;

R⁸ bedeutet Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl oder Halogen-(C₁-C₄)-alkyl;

R⁹ bedeutet Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl;

n bedeutet 0, 1 oder 2.

2. Verbindungen nach Anspruch 1, worin

R¹ und R² unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Formyl, Vinyl, (C₁-C₄)-Alkyl, Halogen-(C₁-C₄)-Alkyl, oder (C₁-C₄)-Alkoxy;
oder

R^1 und R^2 gemeinsam $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ bedeuten;
 R^3 und R^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Methyl oder Methoxy,
und
Y einen Rest Y1, Y2, Y3, Y6, Y7, Y8 oder Y9
bedeuten.

3. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2, worin

R^1 Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, Trifluormethyl, Methoxy, Methyl
oder Ethyl;

R^2 Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy,
oder

R^1 und R^2 gemeinsam $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2$, und

R^3 und R^4 unabhängig voneinander Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

4. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 3, worin

R^5 Halogen, Cyano, Halogen-($\text{C}_1\text{-C}_2$)-alkyl, Halogen-($\text{C}_1\text{-C}_2$)-alkoxy oder
Halogen-($\text{C}_1\text{-C}_2$)-alkylthio bedeutet.

5. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 4, worin R^2 und R^6 jeweils
Wasserstoff bedeuten sowie Y für Y1, Y2, Y7, Y8 oder Y9 steht.

6. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen herbizid wirksamen Gehalt an
mindestens einer Verbindung der allgemeinen Formel (I) gemäß einem der
Ansprüche 1 bis 5.

7. Herbizide Mittel nach Anspruch 6 in Mischung mit Formulierungshilfsmitteln.

8. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen, dadurch
gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung der
allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5 oder eines herbiziden
Mittels nach Anspruch 6 oder 7 auf die Pflanzen oder auf den Ort des
unerwünschten Pflanzenwachstums appliziert.

9. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5 oder von herbiziden Mitteln nach Anspruch 6 oder 7 zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

10. Verwendung nach Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen in Kulturen von Nutzpflanzen eingesetzt werden.

11. Verwendung nach Anspruch 10, dadurch gekennzeichnet, daß die Nutzpflanzen transgene Nutzpflanzen sind.

(12) Solicitud Internacional publicada según el Tratado de Cooperación Internacional en Materia de Patentes (PCT)

(19) Organización Mundial para la Propiedad Intelectual
Oficina Internacional

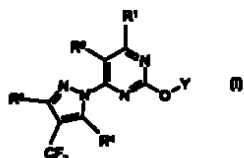
(43) Fecha de Publicación Internacional:
29 septiembre 2005 (29.09.2005)

(10) Número de publicación Internacional:
WO 2005/089551 A1

PCT

(51) Clasificación Internacional de Patentes⁷: A01N 43/72, 43/48, C07d 417/14, 409/14, 405/14, 403/04, 403/14, 401/14 (21) Expediente Internacional: PCT/EP2005/002049 (22) Fecha de solicitud Internacional: 26 febrero 2005 (26.02.2005) (25) Idioma de solicitud: alemán (26) Idioma de publicación: alemán (30) Datos de prioridad: 10 2004 011 705.5 10 marzo 2004 (10.03.2004) DE (71) Solicitante (para todos los estados designados excepto US): BAYER CROPSOURCE GMBH [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt (DE) (72) Inventor, y (75) Inventor/Solicitante (sólo para US) HOFFMANN, Michael, Gerhard (DE/DE); Jahnstrasse 8a, 65439 Flörsheim (DE), HELMKE, Hendrik (DE/DE); Taunusstrasse 49, 65853 Liederbach (DE), WILLMS, Lothar (DE/DE); Königsteiner Strasse 50, 65719 Hofheim (DE), AULER, Thomas (DE/DE); Bonner Strasse 15, 65812 Bad Soden a. Ts. (DE), KEHNE, Heinz (DE/DE); Iltsweg 7a 65719 Hofheim (DE), HILLS, Martin (GB/DE), Am Itzelgrund 5b, 65719 Hofheim (DE), FEUCHT, Dieter (DE/DE); Am Burggraben 7a, 65760 Eschborn (DE)	(81) Estados designados (nacional): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW. (84) Estados designados (regional): patentes ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), patentes euroasiáticas (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), patentes europeas (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), patentes OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Publicado: - con Informe internacional de Búsqueda. Para códigos con dos letras y otras abreviaturas consulte las "Notas de Guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparece al principio de cada edición regular del boletín PCT.
---	--

(54) Enunciado: 4-(4-Trifluorometilpirazolil)-pirimidinas sustituidas



Se describen 4-(4-trifluorometilpirazolil)-pirimidinas de la fórmula (I) y su utilización como herbicidas.

En esta fórmula general (I) R¹, R², R³ y R⁴ representan diferentes radicales e Y representa un radical aromático o heteroaromático.

4-(4-Trifluorometilpirazolil)-pirimidinas

El invento se refiere al sector técnico de los herbicidas, en particular al de los herbicidas del conjunto de los heteroaril-pirazoles para la represión selectiva de malezas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles.

A partir de diferentes documentos, ya es conocido que determinadas piridinas y pirimidinas sustituidas con radicales de azoles, tales como pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, poseen propiedades herbicidas. Así, a partir del documento de solicitud de patente internacional WO 99/28301 se conocen piridinas y pirimidinas, que en la posición 2 llevan un radical de azol y en la posición 4 o respectivamente 6 llevan un radical aromático o heteroaromático unido a través de un átomo de carbono. El documento WO 98/40379 describe piridinas y pirimidinas, que en la posición 2 llevan un radical de azol y en la posición 4 o respectivamente 6 llevan un radical aromático o heteroaromático unido a través de un átomo de oxígeno, nitrógeno o azufre. El radical de azol en la posición 2 puede estar sustituido con diferentes radicales. Este documento divulga diferentes sustituyentes para el radical pirazolilo, que siempre se encuentran en la posición 3, En ACS Symposium Series (2002), 800 (Synthesis and Chemistry of Agrochemicals = Síntesis y Química de Productos Agroquímicos), página 76, se divulgan pirimidinas, que llevan el radical de azol en la posición 4, como ineficaces en calidad de herbicidas. Estos compuestos son regioisómeros con respecto a los compuestos de piridina que se conocen a partir de los documentos antes mencionados.

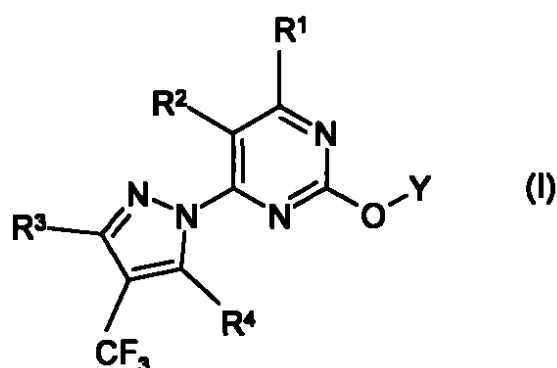
25

Los compuestos que se conocen a partir de los documentos precedentemente mencionados muestran sin embargo frecuentemente una actividad herbicida insuficiente. Es misión del presente invento, por lo tanto, la puesta a disposición de compuestos eficaces como herbicidas con propiedades herbicidas mejoradas – en comparación con las de los compuestos divulgados en el estado de la técnica –.

30

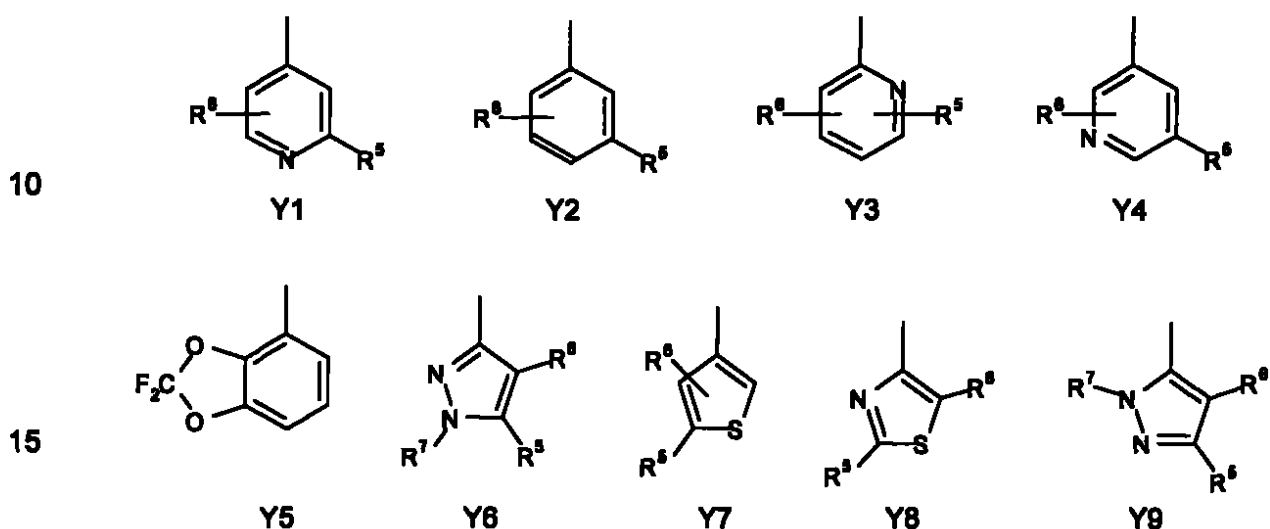
Se encontró por fin que determinadas 4-(4-trifluorometilpirazolil)-pirimidinas son especialmente bien apropiadas como herbicidas. Un objeto del presente invento son por lo tanto compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales,

35



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

5 **Y** significa un radical seleccionado entre el conjunto formado por Y1 hasta Y9:



20 **R¹** y **R²** significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, ciano, isociano, OH, COOR⁸, COR⁸, CH₂OH, CH₂SH, CH₂NH₂, NO₂, CSNH₂, CONH₂, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), halógeno- alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), alquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquenil (C₃-C₄)-oxi, alquinil (C₃-C₄)-oxi, alquil (C₁-C₂)-tio-alquilo (C₁-C₂), S(O)_nR⁸, alquil (C₁-C₂)-sulfonil-alquilo (C₁-C₂), amino, alquil (C₁-C₄)-amino, alquil (C₁-C₃)-carbonilamino, alquil (C₁-C₄)-sulfonilamino o di-alquil (C₁-C₄)-amino,

o

R¹ y **R²** en común significan CH₂-CH₂-CH₂, CH₂-CH₂-CH₂-CH₂ o OCH₂-CH₂-CH₂O;

R^3 y R^4 significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o halógeno-alcoxi (C_1-C_4);

- 5 R^5 significa halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halógeno-alcoxi (C_1-C_4), halógeno-alquil (C_1-C_4)-tio, cicloalquilo (C_3-C_5), halógeno-cicloalquilo (C_3-C_5), SF_5 , $S(O)_nR^6$, alquenilo (C_2-C_4) o alquinilo (C_2-C_4);

- 10 R^6 significa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halógeno-alcoxi (C_1-C_4) o $S(O)_nR^6$;

R^7 significa alquilo (C_1-C_4);

- 15 R^8 significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_4) o halógeno-alquilo (C_1-C_4);

R^9 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_4);

n significa 0, 1 o 2.

- 20 En la fórmula (I) y en todas las fórmulas subsiguientes, los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo con más de dos o respectivamente tres átomos de C pueden ser lineales o ramificados. Los radicales alquilo significan metilo, etilo, *n*- o *i*-propilo, *n*-, *i*-, *t*- o 2-butilo. El alquenilo significa por consiguiente etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo así como los diferentes isómeros de butenilo. El alquinilo significa etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo así como los diferentes isómeros de butinilo. De manera análoga han de entenderse las definiciones en sus significados compuestos tales como alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi y alquiltio. Así, el alquiniloxi representa por ejemplo $HC\equiv CCH_2O$, $CH_3C\equiv CCH_2O$ y $CH_3C\equiv CCH_2CH_2O$.
- 25

- 30 El cicloalquilo significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

En el caso de un grupo amino sustituido dos veces, tal como dialquil-amino, estos dos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

El halógeno significa fluoro, cloro, bromo o yodo. El halógeno-alquilo significa un alquilo sustituido total o parcialmente con halógeno, de modo preferido con fluoro, cloro y/o bromo, en particular con fluoro o cloro, p.ej. CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CF_3CF_2 , CH_2FCHCl , CCl_3 , CHCl_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; el halógeno-alcoxi es p.ej. OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$, OCH_2CF_3 y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; lo correspondiente es válido para otros radicales sustituidos con halógeno.

Los compuestos de la fórmula (I), según sean el tipo y el modo de unión de los sustituyentes, pueden presentarse como estereoisómeros. Si, por ejemplo, se presenta un doble enlace, pueden aparecer diastereoisómeros. Si, por ejemplo, están presentes uno o varios átomos de C asimétricos, entonces pueden aparecer enantiómeros y diastereoisómeros. Los estereoisómeros se pueden obtener a partir de las mezclas resultantes en la preparación de acuerdo con usuales métodos de separación, p.ej. por procedimientos cromatográficos de separación. Asimismo, los estereoisómeros se pueden preparar selectivamente por empleo de reacciones selectivas estereoselectivamente mediante utilización de sustancias de partida y coadyuvantes ópticamente activas. El invento se refiere también a todos los estereoisómeros y a sus mezclas, que se abarcan por la fórmula general (I) pero no se definen específicamente.

20

Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar fundamentalmente N-óxidos. Los N-óxidos se pueden preparar, de acuerdo con métodos conocidos por un experto en la especialidad, mediante reacción con reactivos oxidantes tales como perácidos, peróxido de hidrógeno y perborato de sodio. Tales métodos son descritos por ejemplo en la cita de T.L. Gilchrist, Comprehensive Organic Synthesis [Síntesis orgánicas amplias], volumen 7, páginas 748 hasta 750, S.V. Ley, coordinador de edición, Pergamon Press.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar fundamentalmente sales mediante reacción por adición con

- a) ácidos tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido fosfórico, ácido sulfúrico, ácido acético, ácido oxálico, o con
- b) bases tales como piridina, amoníaco, trietilamina, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio.

35

Las formas preferidas de realización de los compuestos conformes al invento abarcan, siempre y cuando que en lo sucesivo no se señale otra cosa distinta, siempre los N-óxidos y las sales.

- 5 Se han manifestado como ventajosos compuestos de la fórmula (I), en la que
- R^1 y R^2 independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, formilo, vinilo, alquilo (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), o alcoxi (C_1-C_4);
- o
- 10 R^1 y R^2 significan en común $CH_2CH_2CH_2$;
- R^3 y R^4 independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;
- Y significa un radical Y1, Y2, Y3, Y6, Y7, Y8 o Y9,
- y los otros sustituyentes e índices tienen en cada caso los significados mencionados
- 15 más arriba.

Presentan un mayor interés compuestos de la fórmula general (I), en la que

- R^1 significa hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, trifluorometilo, metoxi, metilo o etilo;
- 20 R^2 significa hidrógeno, hidroxilo, metilo, etilo, metoxi o etoxi,
- o
- R^1 y R^2 significan en común $CH_2-CH_2-CH_2$;
- R^3 y R^4 independientemente uno de otro, significan hidrógeno o metilo,
- y los otros sustituyentes e índices tienen en cada caso los significados mencionados
- 25 más arriba.

Se prefieren compuestos de la fórmula general (I), en la que

- R^5 significa halógeno, ciano, halógeno-alquilo (C_1-C_2), halógeno-alcoxi (C_1-C_2) o halógeno-alquil (C_1-C_2)-tio, y los otros sustituyentes e índices tienen en cada caso los
- 30 significados mencionados más arriba.

Se prefieren especialmente compuestos de la fórmula general (I), en la que

- R^2 y R^6 significan en cada caso hidrógeno;
- Y representa Y1, Y2, Y7, Y8 o Y9, y los otros sustituyentes e índices tienen en cada
- 35 caso los significados mencionados más arriba.

En todas las fórmulas seguidamente mencionadas, los sustituyentes y símbolos, siempre y cuando que no se defina otra cosa distinta, tienen los mismos significados que se describen dentro de la fórmula (I).

5

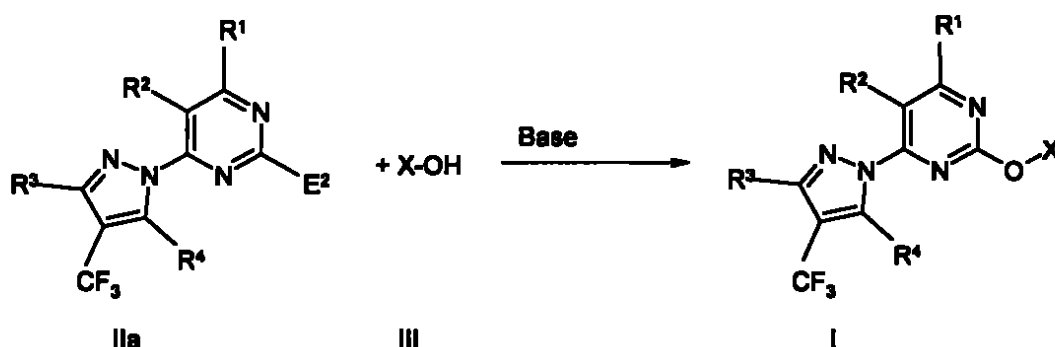
Los compuestos conformes al invento se pueden preparar por ejemplo de acuerdo con las vías de reacción indicadas en los siguientes esquemas:

Según el Esquema 1 se pueden preparar compuestos de la fórmula (I) mediante reacciones de sustitución nucleófilas, catalizadas por bases, de compuestos de la fórmula (III) con pirimidinas de la fórmula (IIa). En la fórmula (IIa) E² representa un grupo lábil tal como halógeno, metilsulfonilo o tosilo. Tales reacciones de sustitución nucleófilas son conocidas para un experto en la especialidad.

Esquema 1

15

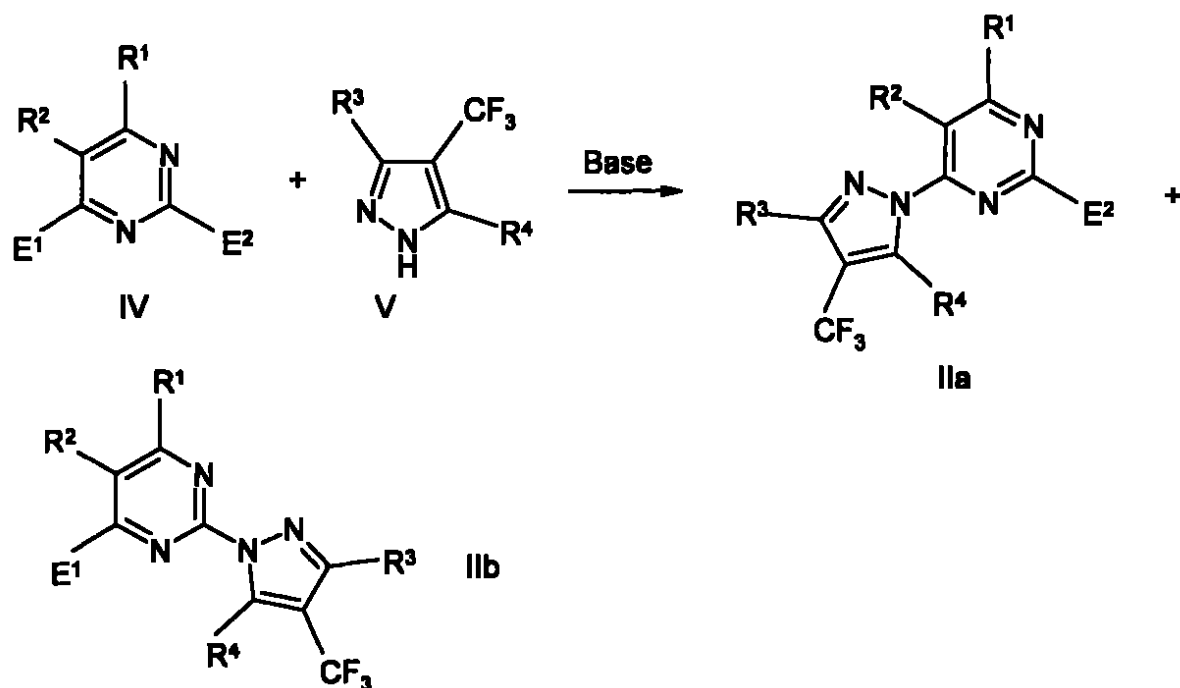
Compuestos de la fórmula (IIa), en la que E² representa halógeno, se pueden preparar



por ejemplo según el Esquema 2 mediante reacciones de sustitución, catalizadas por bases, de pirimidinas de la fórmula (IV), en la que E¹ y E² representan halógeno, con pirazoles de la fórmula (V). En este contexto pueden resultar también los respectivos regioisómeros (IIb), que se pueden separar por ejemplo por un tratamiento cromatográfico. Tales reacciones son conocidas para un experto en la especialidad.

20

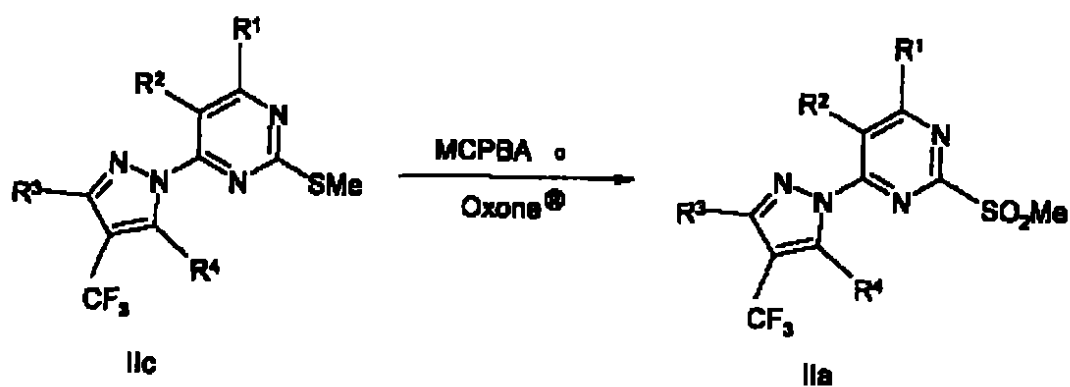
Esquema 2



- Compuestos de la fórmula (IIa), en la que E² representa metilsulfonilo, se pueden preparar por ejemplo según el Esquema 3 por oxidación con ácido m-cloroperbenzoico (MCPA) u Oxone[®] a partir de un compuesto de la fórmula (IIc). Tales reacciones son conocidas para un experto en la especialidad por ejemplo a partir de J. March, *Advanced Organic Chemistry* [Química orgánica avanzada, John Wiley, Nueva York, 2001, 5ª edición, páginas 1541 hasta 1542].

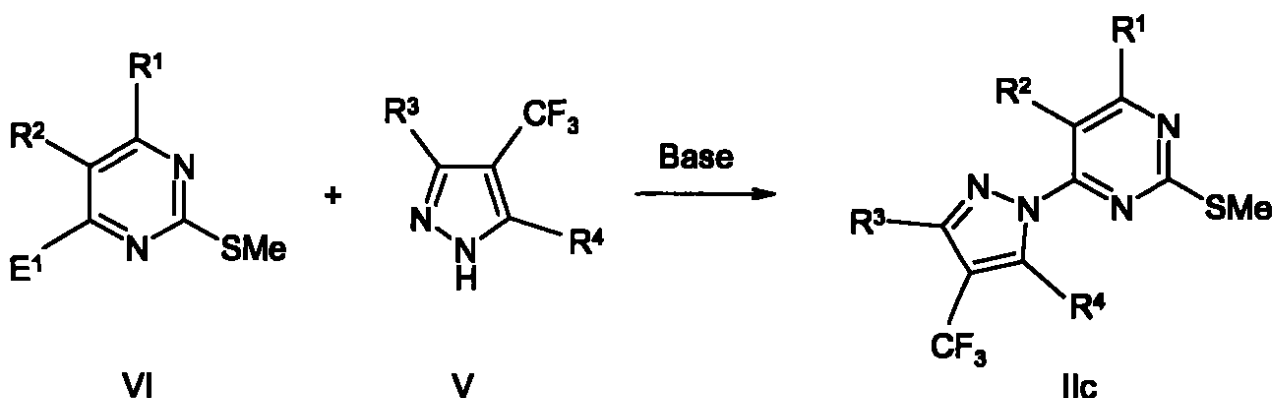
10

Esquema 3



Compuestos de la fórmula (IIc) se pueden preparar por ejemplo según el Esquema 4 mediante una reacción, catalizada por bases de pirimidinas de la fórmula (VI), en la que E¹ representa un grupo lábil tal como halógeno, con pirazoles de la fórmula (V).

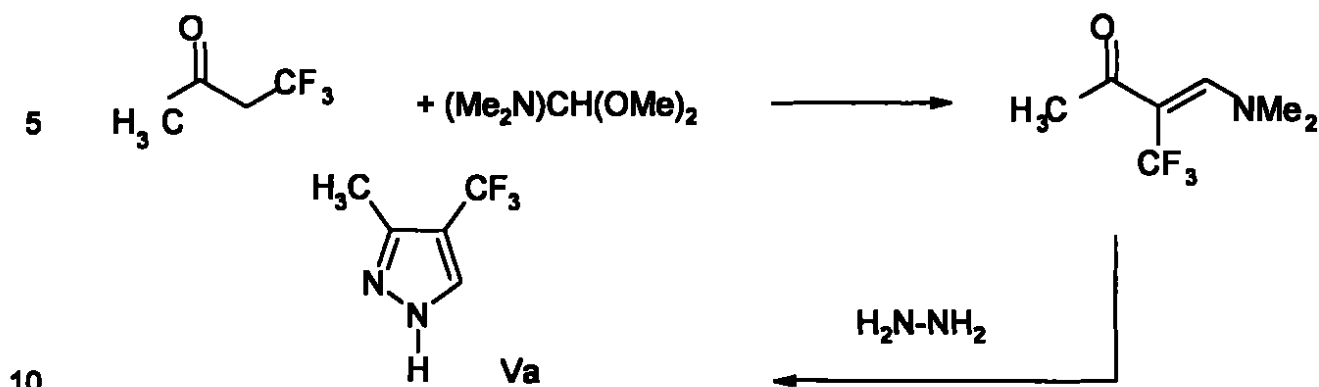
5 Esquema 4



Compuestos de la fórmula (VI), en la que E¹ representa un grupo lábil tal como halógeno, se pueden preparar por ejemplo mediante reacción de 2-tiometil-4-hidroxipirimidinas con POCl₃. Tales métodos conocidos para un experto en la especialidad se describen por ejemplo en Houben-Weyl, Methods of Organic Chemistry, Volumen E 9b, parte 1, 1998, páginas 209 hasta 210. Se pueden preparar 2-tiometil-4-hidroxipirimidinas sustituidas según métodos conocidos para un experto en la especialidad, tales como se describen por ejemplo en Houben-Weyl, Methods of Organic Chemistry, Volumen E 9b, parte 1, 1998, páginas 46, 47, 49 y 50. Pirazoles de la fórmula (V) se pueden preparar asimismo según métodos conocidos para un experto en la especialidad. La preparación de 4-trifluorometilpirazol se describe por ejemplo en Tetrahedron Letters, 37, 1996, páginas 1829 hasta 1830.

20 El 3-metil-4-trifluorometilpirazol (Va) se puede preparar según el Esquema 5,

Esquema 5



Los compuestos de acuerdo con el invento de la fórmula (I) tienen una excelente actividad herbicida contra un amplio espectro de plantas dañinas monocotiledóneas y dicotiledóneas económicamente importantes. También son perfectamente abarcadas las malezas perennes difícilmente combatibles, que brotan a partir de rizomas, capellones de raíces u otros órganos permanentes. En tal caso, por regla general carece de importancia que las sustancias se esparzan según los procedimientos de antes de la siembra, antes del brote o después del brote. En particular, se han de mencionar a modo de ejemplo algunos representantes de la flora de malezas mono- y di-cotiledóneas, que se pueden reprimir por medio de los compuestos conformes al invento, sin que por esta mención tenga que efectuarse ninguna limitación a determinadas especies. Por el lado de las especies de malezas monocotiledóneas se abarcan bien p.ej. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria, así como especies de Cyperus del grupo de las anuales, y por el lado de las especies perennes Agropyron, Cynodon, Imperata así como Sorghum y también especies de Cyperus persistentes. En el caso de especies de malezas dicotiledóneas, el espectro de efectos se extiende a especies tales como p.ej. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Sida, Matricaria y Abutilon por el lado de las anuales, así como Convolvulus, Cirsium, Rumex y Artemisia en el caso de las malezas perennes. Las plantas dañinas que se presentan en el arroz en las condiciones específicas de cultivo, tales como p.ej. Echinochloa, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus y Cyperus, se combaten asimismo de una manera sobresaliente por los agentes conformes al invento. Si los compuestos conformes al invento se aplican antes de la germinación sobre la superficie del terreno, o bien se impide totalmente el brote de las plántulas de malezas o las malezas crecen hasta llegar el estadio de

cotiledones, pero entonces cesan en su crecimiento y mueren finalmente de modo total tras haber transcurrido de tres a cuatro semanas. En el caso de la aplicación de las sustancias activas sobre las partes verdes de las plantas según el procedimiento de después del brote, aparece también con mucha rapidez después del tratamiento una drástica detención del crecimiento, y las plantas de malezas permanecen en el estadio de crecimiento que existía en el momento de la aplicación o mueren totalmente después de un cierto período de tiempo, por lo que de esta manera se elimina muy temprana y persistentemente una competencia por malezas que son perjudiciales para las plantas cultivadas. En particular, los compuestos conformes al invento muestran un sobresaliente efecto contra *Amaranthus retroflexus*, *Avena* sp., *Echinochloa* sp., *Cyperus serotinus*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Sagittaria pygmaea*, *Scirpus juncoides*, *Sinapis* sp. y *Stellaria media*.

Aún cuando los compuestos conformes al invento presentan una excelente actividad herbicida frente a malezas mono- y di-cotiledóneas, las plantas cultivadas de cultivos económicamente importantes, tales como p.ej. las de trigo, cebada, centeno, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón y soja, son dañadas sólo insignificantemente o incluso no son dañadas. En particular, ellos presentan una excelente compatibilidad en trigo, cebada, maíz, arroz y haba de soja. Los presentes compuestos son muy bien apropiados por estas razones para la represión selectiva de una vegetación indeseada de plantas en plantaciones útiles agrícolas o en plantas ornamentales.

Por causa de sus propiedades herbicidas, las sustancias activas se pueden emplear también para la represión de plantas dañinas en cultivos de plantas modificadas por tecnología genética, conocidas o que todavía se hayan de desarrollar. Las plantas transgénicas se distinguen por regla general por especiales propiedades ventajosas, por ejemplo por resistencias frente a determinados plaguicidas, sobre todo a determinados herbicidas, resistencias frente a enfermedades de plantas o agentes patógenos de enfermedades de plantas, tales como determinados insectos, o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales conciernen p.ej. al material cosechado en lo referente a la cantidad, la calidad, la aptitud para almacenamiento, la composición y las sustancias constitutivas especiales. Así, se conocen plantas transgénicas con un contenido aumentado de almidón o una calidad modificada del almidón, o las que tienen una distinta composición de ácidos grasos del material cosechado.

Se prefiere la aplicación de los compuestos de acuerdo con el invento de la fórmula (I) en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisantes y otras especies de hortalizas y legumbres. De modo preferido, los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear como herbicidas en cultivos de plantas útiles, que son resistentes o han sido hechos resistentes por vía de la tecnología genética frente a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

10

Vías habituales para la producción de nuevas plantas, que en comparación con las plantas hasta ahora existentes presentan propiedades modificadas, consisten por ejemplo en procedimientos clásicos de cultivación y en la producción de mutantes. Alternativamente, se pueden producir nuevas plantas con propiedades alteradas con ayuda de procedimientos de tecnología genética (véanse p.ej. los documentos EP-A-0221044, EP-A-0131624). Se describieron, por ejemplo, en varios casos

15

- alteraciones por tecnología genética de plantas cultivadas, con la finalidad de conseguir la modificación del almidón sintetizado en las plantas (p.ej., los documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),

20

- plantas cultivadas transgénicas, que presentan resistencias contra determinados herbicidas del tipo de glufosinato (compárense p.ej. los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o de glifosato (documento WO 92/00377) o de las sulfonil-ureas (documentos EP-A-0257993, US-A-5013659),

25

- plantas cultivadas transgénicas, por ejemplo de algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas de Bt), que hacen que las plantas se vuelvan resistentes contra determinadas plagas (documentos EP-A-0142924, EP-A-0193259),

30

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

Numerosas técnicas de biología molecular, con las que se pueden producir nuevas plantas transgénicas con propiedades alteradas, son conocidas en principio; véanse p.ej. las citas de Sambrook y colaboradores, 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual (Clonación molecular, un manual de laboratorio), 2ª edición, Cold Spring

35

Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o de Winnacker "Gene und Klone" [Genes y clones], VCH Weinheim, 2ª edición, 1996, o de Christou, "Trends in Plant Science" [Tendencias en la ciencia de las plantas] 1 (1996) 423-431).

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

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

- 20 Para ello se pueden utilizar, por una parte, moléculas de ADN, que abarcan la secuencia codificadora total de un producto génico, inclusive secuencias flanqueadoras eventualmente presentes, así como también moléculas de ADN, que abarcan solamente partes de la secuencia codificadora, teniendo estas partes que ser lo suficientemente largas como para producir en las células un efecto antisentido. Es
- 25 posible también la utilización de secuencias de ADN, que presentan un alto grado de homología con respecto a las secuencias codificadoras de un producto génico, pero no son totalmente idénticas.

- En el caso de la expresión de moléculas de ácidos nucleicos en plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimiento arbitrario de la célula
- 30 vegetal. Sin embargo, con el fin de conseguir la localización en un compartimiento determinado, p.ej. la región codificadora se puede reunir con secuencias de ADN, que garantizan la localización en un determinado compartimiento. Tales secuencias son conocidas para un experto en la especialidad (véanse por ejemplo las citas de Braun y
- 35 colaboradores, EMBO J. 11 (1992), 3.219-3.227; Wolter y colaboradores, Proc. Natl.

Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald y colaboradores, Plant J. 1 (1991) 95-106).

5 Las células de plantas transgénicas se pueden regenerar de acuerdo con técnicas conocidas para dar plantas enteras. En el caso de las plantas transgénicas, se puede tratar en principio de plantas de cualquier especie vegetal arbitraria, es decir plantas tanto monocotiledóneas como también dicotiledóneas.

10 De esta manera, se pueden obtener plantas transgénicas, que presentan propiedades modificadas, mediante sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias de genes homólogos (= naturales) o expresión de genes o secuencias de genes heterólogos (= ajenos).

15 En el caso de la aplicación de las sustancias activas conformes al invento en cultivos transgénicos, junto a los efectos contra plantas dañinas, que se pueden observar en otros cultivos, aparecen con frecuencia efectos, que son específicos para la aplicación en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplo un espectro modificado o ampliado especialmente de malezas, que se pueden reprimir, cantidades consumidas modificadas, que se pueden emplear para la aplicación, de modo preferido una buena
20 aptitud para la combinación con los herbicidas, frente a los que es resistente la planta transgénica, así como una influencia sobre el crecimiento y el rendimiento de las plantas cultivadas transgénicas. Es objeto del presente invento, por lo tanto, también la utilización de los compuestos conformes al invento como herbicidas para la represión de plantas dañinas en presencia de plantas cultivadas transgénicas.

25

Además de ello, los agentes conformes al invento presentan en parte sobresalientes propiedades reguladoras del crecimiento en el caso de las plantas cultivadas. Ellos intervienen en el metabolismo propio de las plantas en el sentido de regularlo y por consiguiente se pueden emplear para la influencia deliberada sobre las sustancias
30 constitutivas de las plantas y para facilitar las cosechas, tal como p.ej. por provocación de una desecación y un sofocamiento del crecimiento. Además, son apropiados también para el control, la regulación y la inhibición generales de un crecimiento vegetativo indeseado, sin aniquilar en tal caso a las plantas. Una inhibición del crecimiento vegetativo desempeña un gran cometido en muchos cultivos de plantas

mono- y di-cotiledóneas, puesto que con ello se puede disminuir o impedir totalmente el tumbamiento.

- Los compuestos conformes al invento se pueden aplicar en forma de polvos para
- 5 proyectar, concentrados emulsionables, soluciones atomizables, agentes para espolvorear o granulados en las formulaciones usuales. Son objeto del invento, por lo tanto, también agentes herbicidas, que contienen los compuestos de la fórmula (I). Los compuestos de la fórmula (I) se pueden formular de diferentes modos, dependiendo de cuáles sean los parámetros biológicos y/o químico-físicos que estén preestablecidos.
- 10 Como posibilidades de formulación entran en cuestión, por ejemplo: polvos para proyectar (SP), polvos solubles en agua (WP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones de los tipos de aceite en agua y de agua en aceite, soluciones atomizables, concentrados para suspender (SC), dispersiones sobre la base de aceites o de agua, soluciones
- 15 miscibles con aceites, suspensiones para encapsular (CS), agentes para espolvorear (DP), agentes desinfectantes, granulados para la aplicación sobre el suelo o por esparcimiento, granulados (GR) en forma de microgranulados o granulados formados por atomización, extensión y adsorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV (de volumen ultra-bajo),
- 20 microcápsulas y ceras.
- Estos tipos individuales de formulaciones son conocidos en principio y se describen por ejemplo en las obras de: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (Tecnología química), tomo 7, editorial C. Hauser, Munich, 4ª edición de 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations" (Formulaciones plaguicidas), Marcel Dekker,
- 25 N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying Handbook" (Manual del secado por atomización), 3ª edición de 1979, G. Goodwin Ltd, Londres.

- Los necesarios agentes coadyuvantes para formulaciones, tales como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y otros materiales aditivos, son asimismo
- 30 conocidos y se describen por ejemplo en las obras de: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" (Manual de diluyentes y vehículos para polvos finos insecticidas), 2ª edición, Darland Books, Caldwell N. J.; H.v. Olphen "Introduction to Clay Colloid Chemistry" (Introducción a la química de los coloides de arcillas), 2ª edición, J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide" (Guía de disolventes), 2ª
- 35 edición, Interscience, N.Y. 1963; "Detergents and Emulsifiers Annual" (Anual de

- detergentes y emulsionantes) de McCutcheon, MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents" (Enciclopedia de agentes tensioactivos), Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1984; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Ätilenoxidaddukte" (Aductos con óxido de etileno interfacialmente activos), Wiss. 5 Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (Tecnología química), tomo 7, editorial C. Hauser Munich, 4ª edición de 1986.

Los polvos para proyectar son formulaciones dispersables uniformemente en agua, que junto a la sustancia activa, aparte de una sustancia diluyente o inerte, contienen 10 además todavía agentes tensioactivos de tipos iónicos y/o no iónicos (agentes humectantes, agentes dispersantes), p.ej. alquilfenoles poli(oxetilados), alcoholes grasos poli(oxetilados), aminas grasas poli(oxetiladas), (alcohol graso)-poliglicol-éter-sulfatos, alcano-sulfonatos, alquil-benceno-sulfonatos, una sal de sodio de ácido 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfónico, una sal de sodio de ácido lignina-sulfónico, una sal de 15 sodio de ácido dibutilnaftaleno-sulfónico o también una sal de sodio de ácido oleoil-metil-táurico. Para la producción de los polvos para proyectar, las sustancias activas herbicidas se muelen finamente por ejemplo en equipos usuales tales como molinos de martillos, molinos de soplate y molinos de chorros de aire, y al mismo tiempo o a continuación se mezclan con los agentes coadyuvantes de formulaciones.

20

Los concentrados emulsionables se producen por disolución de la sustancia activa en un disolvente orgánico, p.ej. butanol, ciclohexanona, dimetil-formamida, xileno o también compuestos aromáticos o hidrocarburos de punto de ebullición más alto, o 25 mezclas de los disolventes orgánicos, mediando adición de uno o varios agentes tensioactivos de tipos iónicos y/o no iónicos (emulsionantes). Como emulsionantes se pueden utilizar p.ej.: sales de calcio con ácidos alquil-aril-sulfónicos tales como dodecil-benceno-sulfonato de Ca, o emulsionantes no iónicos, tales como ésteres de poliglicoles con ácidos grasos, alquil-aril-poliglicol-éteres, (alcohol graso)-poliglicol-éteres, productos de condensación de óxido de propileno y óxido de etileno, alquil- 30 poliéteres, ésteres de sorbitán tales como p.ej. ésteres con ácidos grasos de sorbitán, poli(oxietilen)-ésteres de sorbitán, tales como p.ej. poli(oxietilen)-ésteres con ácidos grasos de sorbitán.

Los agentes para espolvorear se obtienen mediante molienda de la sustancia activa con sustancias sólidas finamente divididas, p.ej. talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierra de diatomeas.

- 5 Los concentrados para suspender pueden estar constituidos sobre la base de agua o de un aceite. Éstos se pueden preparar por ejemplo por molienda en húmedo mediante molinos de perlas usuales en el comercio y eventualmente por adición de otros agentes tensioactivos, tales como los que ya se han señalado p.ej. con anterioridad en los casos de los otros tipos de formulaciones.
- 10 Las emulsiones, p.ej. del tipo de aceite en agua (EW), se pueden producir por ejemplo mediante agitadores, molinos de coloides y/o mezcladores estáticos, mediando utilización de disolventes orgánicos acuosos y eventualmente de agentes tensioactivos, tales como los que ya se han señalado p.ej. con anterioridad en los
- 15 casos de los otros tipos de formulaciones.

- Los granulados se pueden producir o bien por inyección de la sustancia activa sobre un material inerte granulado, capaz de adsorción, o por aplicación de concentrados de sustancias activas mediante pegamentos, p.ej. un poli(alcohol vinílico), una poli(sal de sodio de ácido acrílico) o también aceites minerales, sobre la superficie de materiales de soporte, tales como arena, caolinitas, o de un material inerte granulado. También se pueden granular sustancias activas apropiadas del modo que es usual para la producción de granallas de agentes fertilizantes - en caso deseado en mezcla con agentes fertilizantes -.

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

- 30 Para la producción de granulados en bandejas, en lecho fluidizado, en extrusor y por proyección véanse p.ej. los procedimientos expuestos en las obras "Spray-Drying Handbook" (Manual del secado por atomización), 3ª edición de 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration" (Aglomeración), Chemical and Engineering
- 35 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook" (Manual del ingeniero químico de Perry), 5ª edición, McGraw-Hill, Nueva York 1973, páginas 8-57.

Para más detalles acerca de la formulación de agentes para la protección de plantas, véanse p.ej. las obras de G.C. Klingman, "Weed Control as a Science" (Represión de hierbas como ciencia), John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y

5 J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook" (Manual de la represión de hierbas), 5ª edición, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

- Las formulaciones agroquímicas contienen por regla general de 0,1 a 99 % en peso, en particular de 0,1 a 95 % en peso, de una sustancia activa de la fórmula (I). En
- 10 polvos para proyectar, la concentración de sustancia activa es p.ej. de aproximadamente 10 a 90 % en peso, el resto hasta 100 % en peso consta de los usuales constituyentes de formulaciones. En el caso de los concentrados emulsionables, la concentración de sustancias activas puede ser por ejemplo de 1 a 90, de manera preferida de 5 a 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvos
- 15 finos contienen de 1 a 30 % en peso, de manera preferida en la mayor parte de los casos de 5 a 20 % en peso de una sustancia activa, las soluciones atomizables contienen aproximadamente de 0,05 a 80 %, de manera preferida de 2 a 50 % en peso de una sustancia activa. En el caso de granulados dispersables en agua, el contenido de sustancia activa depende en parte de si el compuesto eficaz se presenta en estado
- 20 líquido o sólido y de cuáles sean los agentes coadyuvantes de granulación y materiales de carga y relleno, etc., que se utilicen. En el caso de los granulados dispersables en agua, el contenido de sustancia activa está situado entre 1 y 95 % en peso, de manera preferida entre 10 y 80 % en peso.
- 25 Junto a ello, las mencionadas formulaciones de sustancias activas contienen eventualmente los agentes adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, protectores frente a las heladas y disolventes, materiales de carga y relleno, de soporte y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación, y agentes que influyen sobre el valor del pH y sobre la viscosidad, que en
- 30 cada caso sean usuales.

Sobre la base de estas formulaciones se pueden preparar también combinaciones con otras sustancias activas como plaguicidas, tales como p.ej. insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con antidotos, agentes fertilizantes y/o reguladores

del crecimiento, p.ej. en forma de una formulación acabada o como una mezcla en depósito (Tank-mix).

- Como partícipes en las combinaciones para las sustancias activas conformes al
- 5 invento en formulaciones de mezclas o en una mezcla en depósito se pueden emplear por ejemplo sustancias activas conocidas, tal como se describen p.ej. en Weed Research 26, 441-445 (1986) o en "The Pesticide Manual" [El manual de los plaguicidas], 11ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1997 y la bibliografía allí citada. Como herbicidas, que se pueden combinar
- 10 con los compuestos de la fórmula (I), se han de mencionar p.ej. las siguientes sustancias activas (observación: Los compuestos se designan o bien con el "nombre común" de acuerdo con la International Organization for Standardization (ISO) [Organización internacional para normalización] o con el nombre químico, eventualmente en común con un usual número de código):
- 15 acetocloro; acifluorofeno; aclonifeno; AKH 7088, es decir ácido $[[[1-[5-[2\text{-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-nitrofenil]-2\text{-metoxietiliden]-amino]-oxi]-acético y su éster metílico; alacloro; alloxidima; ametrina; amidosulfurón; amitrol; AMS, es decir sulfamato de amonio; anilofos; asulam; atrazina; azimsulfurón (DPX-A8947); aziprotrina; barbán; BAS 516 H, es decir 5-fluoro-2-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona;$
- 20 benazolina; benfluralina; benfuresato; bensulfurón-metilo; bensulida; bentazona; benzofenap; benzofluoro; benzollprop-etilo; benzotiazurón; bialafos; bifenox; bromacilo; bromobutida; bromofenoxima; bromoxinilo; bromurón; buminafos; busoxinone; butacloro; butamifos; butenaclo; butidazole; butralina; butilato; cafenstrole (CH-900); carbetamida; cafentrazone (ICI-A0051); CDAA, es decir 2-Cloro-
- 25 N,N-di-2-propenilacetamida; CDEC, es decir éster 2-cloroalílico de ácido dietilditiocarbámico; clometoxifeno; clorambeno; clorazifop-butilo, cloromesulón (ICI-A0051); clorobromurón; clorobufam; clorofenaco; cloroflurecol-metilo; cloridazona; clorimurón etilo; cloronitrofenol; clorotolurón; cloroxurón; cloroprofam; clorosulfurón; clortal-dimetilo; clorotiamid; cinmetilina; cinosulfurón; cletodima; clodinafop y sus
- 30 derivados ésteres (p.ej. clodinafop-propargilo); clomeprop; cloproxiidima; clopiralida; cumilurón (JC 940); cianazine; cicloato; ciclosulfamurón (AC 104); clodixidima; cidurón; cihalofop y sus derivados ésteres (p.ej. el éster butílico, DEH-112); clperquat; ciperazine; ciperazole; daimurón; 2,4-DB; dalapón; desmedifam; desmetrina; di-alato; dicamba; diclobenilo; dicloroprop; diclofop y sus ésteres tales como diclofop-metilo;
- 35 dietatilo; difenoxurón; difenzoquat; diflufenican; dimefurón; dimetaclo; dimetametrina;

- dimetenamida (SAN-582H); dimetazona, clomazona; dimetipina; dimetrasulfurón, dinitramina; dinoseb; dinoterb; difenamid; dipropetrina; dlquat; dltiopir; diurón; DNOC; eglinazina-etilo; EL 77, es decir 5-xiano-1-(1,1-dimetiletil)-N-metil-1H-pirazol-4-carboxamida; endotal; EPTC; esprocarb; etalfluralina; etametsulfurón-metilo;
- 5 etidimurón; etiozina; etofumesato; F5231, es decir N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropilo)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]-fenil]-etanosulfonamida; etoxifeno y sus ésteres (p.ej. éster etílico, HN-252); etobenzanida (HW 52); fenoprop; fenoxano, fenoxaprop y fenoxaprop-P así como sus ésteres, p.ej. fenoxaprop-P-etilo y fenoxaprop-etilo; fenoxidima; fenurón; flamprop-metilo; flazasulfurón; fluazifop y
- 10 fluazifop-P y sus ésteres, p.ej. fluazifop-butilo y fluazifop-P-butilo; fludoralina; flumetsulam; flumeturón; flumicloraco y sus ésteres (p.ej. el éster pentílico, S-23031); flumioxazina (S-482); flumipropina; flupoxam (KNW-739); fluorodifeno; fluoroglicofeno-etilo; flupropacilo (UBIC-4243); fluridona; fluocloridona; fluoroxipir; flurtamona; fomesafeno; fosamina; furiloxifeno; glufosinato; glifosato; halosafeno;
- 15 halosulfurón y sus ésteres (p.ej. el éster metílico, NC-319); haloxifop y sus ésteres; haloxifop-P (= R-haloxifop) y sus ésteres; hexazinona; imazapir; imazametabenz-metilo; imazaquina y sales tales como la sal de amonio; ioxinilo; imazetametapir; imazetapir; imazosulfurón; isocarbamida; isopropalina; isoproturón; isourón; Isoxabeno; isoxapirfop; karbutilato; lactofeno; lenacilo; linurón; MCPA; MCPB;
- 20 mecoprop; mefenacet; mefluidida; metamitrón; metazaclo; metam; metabenzotiazurón; metazol; metoxifenona; metildimurón; metabenzurón; metobenzurón; metobromurón; metolaclo; metosulam (XRD 511); metoxurón; metribuzina; metsulfurón-metilo; MH; molinato; monalida; monolinurón; monurón; monocarbamida dihidrógenosulfato; MT 128, es decir 6-cloro-N-(3-cloro-2-propenil)-
- 25 5-metil-N-fenil-3-piridazina; MT 5950, es decir N-[3-cloro-4-(1-metiletil)-fenil]-2-metilpentanamida; naproanilida; napropamida; naptalam; NC 310, es decir 4-(2,4-diclorobenzol)-1-metil-5-benciloxipirazol; neburón; nicosulfurón; nipiraclofeno; nitalina; nitrofenó; nitrofluorofeno; norflurazona; orbencarb; orizalina; oxadiargilo (RP-020630); oxadiazona; oxifluorofeno; paraquat; pebulato; pendimetalina;
- 30 perfluidona; fenisofam; fenmedifam; picloram; pinoxadeno; piperofos; piributicarb; pirifenop-butilo; pretilaclo; primisulfurón-metilo; proclazina; prodiamina; profluralina; proglinazina-etilo; prometón; prometrina; propaclo; propanilo; propaquizafop y sus ésteres; propazina; profam; propisoclo; propizamida; prosulfalina; prosulfocarb; prosulfurón (CGA-152005); prinaclo; piradonilo; pirazollato; pirazona;
- 35 pirazosulfurón-etilo; pirazoxifeno; piridato; piritiobaco (KIH-2031); piroxofop y sus

ésteres (p.ej. el éster propargílico); quincloraco; quinmeraco; quinofof y sus derivados ésteres, quizalofop y quizalofop-P y sus derivados ésteres p.ej. quizalofop-etilo; quizalofop-P-tefurilo y -etilo; renridurón; rimsulfurón (DPX-E 9636); S 275, es decir 2-[4-cloro-2-fluoro-5-(2-propinilo)-fenil]-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol; 5 secbumetona; setoxidima; sidurón; simazina; simetrina; SN 106279, es decir ácido 2-[[7-[2-cloro-4-(trifluoro-metil)-fenoxi]-2-naftalenil]-oxi]-propanoico y su éster metílico; sulfentrazona (FMC-97285, F-8285); sulfazurón; sulfometurón-metilo; sulfosato (ICI-A0224); TCA; tebutam (GCP-5544); tebutiurón; terbacilo; terbucarb; terbucloro; terbumetona; terbutilazine; terbutrina; TFH 450, es decir N,N-dietil-3-[(2-etil-6- 10 metilfenil)-sulfonil]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamida; tenilcloro (NSK-850); tiazafurón; tiazopir (Mon-13200); tidiazimina (SN-24085); tiobencarb; tifensulfurón-metilo; tiocarbazilo; tralkoxidima; tri-alato; triasulfurón; triazofenamida; tribenurón-metilo; tricopir; tridifano; trietazina; trifluralina; triflusulfurón y sus ésteres (p.ej. el éster metílico, DPX-88037); trimeturón; tsitodef; vemolato; WL 110547, es decir 5-fenoxi-1- 15 [3-(trifluorometil)-fenil]-1H-tetrazol; UBH-508; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 y KIH-2023,

Para la aplicación, las formulaciones presentes en una forma usual en el comercio se 20 diluyen de una manera usual p.ej. mediante agua en los casos de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables en agua. Las formulaciones en forma de polvos finos, los granulados para el suelo o respectivamente para esparcir, así como las soluciones atomizables, usualmente ya no se diluyen con otras sustancias inertes antes de la aplicación. Con las condiciones 25 externas tales como la temperatura, la humedad, el tipo del herbicida utilizado, etc., varía la necesaria cantidad a consumir de los compuestos de la fórmula (I). Ésta puede fluctuar dentro de amplios límites, p.ej. entre 0,001 y 1,0 o más kg/ha de la sustancia activa, preferiblemente, sin embargo, está situada entre 0,005 y 750 g/ha.

30 Los siguientes Ejemplos explican el invento.

A. Ejemplos químicos

Preparación de 6-etil-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-(2-trifluorometilpiridin-4-il-oxi)pirimidina (N° 1,25):

- 5 Una mezcla de 0,4 g (1,25 mmol) de 6-etil-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-metilsulfonilpirimidina, de 0,2 g (1,25 mmol) de 4-hidroxi-2-trifluorometilpiridina y de 0,345 g (2,5 mmol) de K_2CO_3 en 20 ml de acetonitrilo se agita a reflujo durante 8 h y a continuación se deja reposar durante una noche a la TA (temperatura ambiente). La mezcla se vierte sobre 40 ml de agua y se extrae cuatro veces, cada vez con 20 ml de
- 10 CH_2Cl_2 . Las fases orgánicas reunidas se secan sobre Na_2SO_4 y se concentran por evaporación. La purificación por cromatografía en presencia de gel de sílice con una mezcla de heptano y acetato de etilo (1:1) proporciona 0,33 g (65 %) de 6-etil-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-(2-trifluorometilpiridin-4-il-oxi)pirimidina.
- 1H -RMN: δ [$CDCl_3$] 1,35 (t, 3H), 2,85 (q, 2H), 7,45 (dd, 1H), 7,70 (s, 2H), 7,95 (s, 1H), 8,00 (d, 1H), 8,70 (s, 1H).
- 15

Preparación de 6-metil-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-(2-trifluorometilpiridin-4-il-oxi)pirimidina (N° 1,13):

- Una mezcla de 0,63 g (2,4 mmol) de 6-metil-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-cloropirimidina, de 0,39 g (2,4 mmol) de 4-hidroxi-2-trifluorometilpiridina y de 0,66 g (4,8 mmol) de K_2CO_3 en 20 ml de acetonitrilo se agita a reflujo durante 8 h y a continuación se deja reposar durante una noche a la TA. La mezcla se vierte sobre 40 ml de agua y se extrae cuatro veces, cada vez con 20 ml de CH_2Cl_2 . Las fases orgánicas reunidas se secan sobre Na_2SO_4 y se concentran por evaporación. La
- 20 purificación por cromatografía en presencia de gel de sílice con una mezcla de heptano y acetato de etilo (7:3) proporciona 0,8 g (85 %) de 6-metil-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-(2-trifluorometilpiridin-4-il-oxi)pirimidina.
- 1H -RMN: δ [$CDCl_3$] 2,60 (s, 3H), 7,43 (dd, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,80 (d, 1H).
- 25
- 30

Preparación de 6-metoxi-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-(1-metil-3-trifluorometilpirazol-5-il-oxi)pirimidina (N° 9,37):

- Una mezcla de 0,35 g (1,09 mmol) de 6-metoxi-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-metilsulfonilpirimidina, de 0,18 g (1,09 mmol) de 1-metil-3-trifluorometil-2-pirazolin-5-ona y de 0,3 g (2,17 mmol) de K_2CO_3 en 5 ml de acetonitrilo se agita a reflujo durante
- 35

8 h y a continuación se deja reposar durante una noche a la TA. La mezcla se vierte sobre 40 ml de agua y se extrae cuatro veces, cada vez con 20 ml de CH₂Cl₂. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre Na₂SO₄ y se concentran por evaporación. La purificación por cromatografía en presencia de gel de sílice con una mezcla de heptano y acetato de etilo (1:1) proporciona 0,38 g (82 %) de 6-metoxi-4-(4-trifluorometil-1H-1-pirazolil)-2-(1-metil-3-trifluorometilpirazol-5-il-oxi)pirimidina.

¹H-RMN: δ [CDCl₃] 3,85 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 6,24 (s, 1H), 7,15 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,65 (s, 1H).

10 Preparación de 3-metil-4-trifluorometilpirazol:

Una solución de 15 g (119 mmol) de 4,4,4-trifluorobutan-2-ona y de 28,3 g (238 mmol) del dimetilacetal de N,N-dimetilformamida en 100 ml de tolueno se agita a reflujo durante 8 h. A continuación, se concentra por evaporación hasta sequedad. El producto bruto se recoge en 100 ml de etanol, se mezcla con 18,45 ml de hidrato de hidrazina, luego se agita a reflujo durante 8 h y de nuevo se concentra por evaporación. La purificación por cromatografía en presencia de gel de sílice con una mezcla de heptano y acetato de etilo (3:7) proporciona 5,4 g (31 %) de 3-metil-4-trifluorometilpirazol.

¹H-RMN: δ [CDCl₃] 2,40 (s, 3H), 7,75 (s, 1H).

20

Los Ejemplos expuestos en las subsiguientes tablas se prepararon de una manera análoga a los métodos arriba mencionados o respectivamente son obtenibles de una manera análoga a los métodos arriba mencionados.

25 Las abreviaturas aquí utilizadas significan:

Et = etilo	OEt = etoxi	Me = metilo
OMe = Metoxi	EE = acetato de etilo	Fp. = punto de fusión
R' = valor de retención	i-Pr = Iso-propilo	n-Pr = n-propilo
TA = temperatura ambiente		

Tabla 1: **Compuestos conformes al invento de la fórmula general (I), en la que los sustituyentes y símbolos tienen los siguientes significados:**

Y = Y1 R⁶ = H

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
1,1	H	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 7,43 (dd, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,75 (d, 1H), 8,78 (s, 1H) 8,80 (d, 1H)
1,2	H	H	Me	H	CF ₃	
1,3	H	H	H	Me	CF ₃	
1,4	H	H	H	H	Cl	
1,5	H	H	Me	H	Cl	
1,6	H	H	H	Me	Cl	
1,7	H	H	H	H	CN	
1,8	H	H	Me	H	CN	
1,9	H	H	H	Me	CN	
1,10	H	H	H	H	OCF ₂ H	
1,11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,13	Me	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 7,43 (dd, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,80 (d, 1H)
1,14	Me	H	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,45 (s, 3H), 2,59 (s, 3H), 7,40 (dd, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,78 (d, 1H)
1,15	Me	H	H	Me	CF ₃	
1,16	Me	H	H	H	Cl	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 7,16 (dd, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,45 (d, 1H), 8,70 (s, 1H)
1,17	Me	H	Me	H	Cl	
1,18	Me	H	H	Me	Cl	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
1,19	Me	H	H	H	CN	
1,20	Me	H	Me	H	CN	
1,21	Me	H	H	Me	CN	
1,22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 6,82 (d, 1H), 7,03 (dd, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,70 (s, 1H)
1,23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,25	Et	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,35 (t, 3H), 2,85 (q, 2H), 7,45 (dd, 1H), 7,70 (s, 2H), 7,95 (s, 1H), 8,00 (d, 1H), 8,70 (s, 1H)
1,26	Et	H	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 7,41 (dd, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,78 (d, 1H)
1,27	Et	H	H	Me	CF ₃	
1,28	Et	H	H	H	Cl	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,40 (t, 3H), 2,92 (q, 2H), 7,23 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,72 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,88 (s, 1H)
1,29	Et	H	Me	H	Cl	
1,30	Et	H	H	Me	Cl	
1,31	Et	H	H	H	CN	
1,32	Et	H	Me	H	CN	
1,33	Et	H	H	Me	CN	
1,34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	
1,35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,37	OMe	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 4,00 (s, 3H), 7,15 (s,

81
83

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
						1H), 7,42 (dd, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,80 (d, 1H)
1,38	OMe	H	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,40 (s, 1H), 3,98 (s, 3H), 7,08 (s, 1H), 7,42 (dd, 1H), 7,70 (d, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,80 (d, 1H)
1,39	OMe	H	H	Me	CF ₃	
1,40	OMe	H	H	H	Cl	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 4,00 (s, 3H), 7,13 (s, 1H), 7,18 (dd, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,94 (s, 1H), 8,45 (d, 1H), 8,60 (s, 1H)
1,41	OMe	H	Me	H	Cl	
1,42	OMe	H	H	Me	Cl	
1,43	OMe	H	H	H	CN	
1,44	OMe	H	Me	H	CN	
1,45	OMe	H	H	Me	CN	
1,46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 4,00 (s, 3H), 6,85 (d, 1H), 7,05 (dd, 1H), 7,12 (s, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,92 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,60 (s, 1H)
1,47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,49	Cl	H	H	H	CF ₃	
1,50	Cl	H	Me	H	CF ₃	
1,51	Cl	H	H	Me	CF ₃	
1,52	Cl	H	H	H	Cl	
1,53	Cl	H	Me	H	Cl	
1,54	Cl	H	H	Me	Cl	
1,55	Cl	H	H	H	CN	
1,56	Cl	H	Me	H	CN	
1,57	Cl	H	H	Me	CN	
1,58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	

62
64

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
1,59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,61	CN	H	H	H	CF ₃	
1,62	CN	H	Me	H	CF ₃	
1,63	CN	H	H	Me	CF ₃	
1,64	CN	H	H	H	Cl	
1,65	CN	H	Me	H	Cl	
1,66	CN	H	H	Me	Cl	
1,67	CN	H	H	H	CN	
1,68	CN	H	Me	H	CN	
1,69	CN	H	H	Me	CN	
1,70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	
1,71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,73	H	H	H	H	CF ₂ H	
1,74	Me	H	Me	H	CF ₂ H	
1,75	Me	H	H	Me	CF ₂ H	
1,76	Me	H	H	H	CF ₂ H	
1,77	Et	H	H	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,86 (q, 2H), 6,70 (t, 1H), 7,35 (dd, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,72 (d, 1H)
1,78	Et	H	Me	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 6,70 (t, 1H), 7,35 (dd, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,70 (d, 1H)
1,79	Et	H	H	Me	CF ₂ H	
1,80	OMe	H	H	H	CF ₂ H	
1,81	OMe	H	Me	H	CF ₂ H	

3
65

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
1,82	OMe	H	H	Me	CF ₂ H	
1,83	OH	H	H	H	CF ₃	
1,84	OH	H	Me	H	CF ₃	
1,85	OH	H	H	Me	CF ₃	
1,86	OH	H	H	H	OCF ₂ H	
1,87	OH	H	Me	H	OCF ₂ H	
1,88	OH	H	H	Me	OCF ₂ H	
1,89	OH	H	H	H	CF ₂ H	
1,90	OH	H	Me	H	CF ₂ H	
1,91	OH	H	H	Me	CF ₂ H	
1,92	n-Pr	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,00 (t, 3H), 1,80 (m, 2H), 2,80 (t, 2H), 7,42 (dd, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,80 (d, 1H)
1,93	n-Pr	H	H	H	Cl	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,00 (t, 3H), 1,80 (m, 2H), 2,80 (t, 2H), 7,18 (dd, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,45 (d, 1H), 8,70 (s, 1H)
1,94	CF ₃	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 7,50 (dd, 1H), 7,72 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,75 (s, 1H), 8,83 (d, 1H)
1,95	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,25 (m, 2H), 3,05 (t, 2H), 3,40 (t, 2H), 7,40 (dd, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,78 (s, 1H)

$$Y = Y_2 \quad R^2 = H \quad R^6 = H$$

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
2,1	H	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 7,42 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,65 (d, 1H), 8,70 (s, 1H)
2,2	H	H	Me	H	CF ₃	H	
2,3	H	H	H	Me	CF ₃	H	
2,4	H	H	H	H	Cl	H	
2,5	H	H	Me	H	Cl	H	
2,6	H	H	H	Me	Cl	H	
2,7	H	H	H	H	CN	H	
2,8	H	H	Me	H	CN	H	
2,9	H	H	H	Me	CN	H	
2,10	H	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2,11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2,12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2,13	Me	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 7,28 (s, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,60 (m, 3H), 7,95 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
2,14	Me	H	Me	H	CF ₃	H	
2,15	Me	H	H	Me	CF ₃	H	
2,16	Me	H	H	H	Cl	H	
2,17	Me	H	Me	H	Cl	H	
2,18	Me	H	H	Me	Cl	H	
2,19	Me	H	H	H	CN	H	
2,20	Me	H	Me	H	CN	H	
2,21	Me	H	H	Me	CN	H	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
2,22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2,23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2,24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2,25	Et	H	H	H	CF ₃	H	
2,26	Et	H	Me	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,30 (t, 3H), 2,41 (s, 3H), 2,80 (q, 2H), 7,42 (m, 1H), 7,58 (m, 3H), 8,50 (s, 1H)
2,27	Et	H	H	Me	CF ₃	H	
2,28	Et	H	H	H	Cl	H	
2,29	Et	H	Me	H	Cl	H	
2,30	Et	H	H	Me	Cl	H	
2,31	Et	H	H	H	CN	H	
2,32	Et	H	Me	H	CN	H	
2,33	Et	H	H	Me	CN	H	
2,34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2,35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2,36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2,37	OMe	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 3,85 (s, 3H), 6,97 (s, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,50 (m, 3H), 7,80 (s, 1H), 8,44 (s, 1H)
2,38	OMe	H	Me	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,40 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 7,00 (s, 1H), 7,42 (m, 1H), 7,56 (m, 3H), 8,43 (s, 1H)
2,39	OMe	H	H	Me	CF ₃	H	
2,40	OMe	H	H	H	Cl	H	
2,41	OMe	H	Me	H	Cl	H	
2,42	OMe	H	H	Me	Cl	H	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
2,43	OMe	H	H	H	CN	H	
2,44	OMe	H	Me	H	CN	H	
2,45	OMe	H	H	Me	CN	H	
2,46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2,47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2,48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2,49	Cl	H	H	H	CF ₃	H	
2,50	Cl	H	Me	H	CF ₃	H	
2,51	Cl	H	H	Me	CF ₃	H	
2,52	Cl	H	H	H	Cl	H	
2,53	Cl	H	Me	H	Cl	H	
2,54	Cl	H	H	Me	Cl	H	
2,55	Cl	H	H	H	CN	H	
2,56	Cl	H	Me	H	CN	H	
2,57	Cl	H	H	Me	CN	H	
2,58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2,59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	H	
2,60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2,61	CN	H	H	H	CF ₃	H	
2,62	CN	H	Me	H	CF ₃	H	
2,63	CN	H	H	Me	CF ₃	H	
2,64	CN	H	H	H	Cl	H	
2,65	CN	H	Me	H	Cl	H	
2,66	CN	H	H	Me	Cl	H	
2,67	CN	H	H	H	CN	H	
2,68	CN	H	Me	H	CN	H	
2,69	CN	H	H	Me	CN	H	
2,70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	H	
2,71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	H	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
2,72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	H	
2,73	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 7,45 (m, 1H), 7,60 (m, 3H), 7,70 (d, 1H), 8,00 (s, 1H), 8,05 (s, 1H), 8,63 (s, 1H)
2,74	n-Pr	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,00 (t, 3H), 2,80 (m, 2H), 2,78 (t, 2H), 7,42 (m, 1H), 7,58 (m, 3H), 7,95 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
2,75	n-Pr	H	H	H	CF ₃	4-F	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,00 (t, 3H), 2,80 (m, 2H), 2,78 (t, 2H), 7,28 (m, 1H), 7,42 (m, 1H), 7,53 (m, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,63 (s, 1H)
2,76	Et	H	H	H	CF ₃	4-F	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,30 (t, 3H), 2,80 (q, 4H), 7,30 (m, 1H), 7,42 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,94 (s, 1H)
2,77	Et	H	Me	H	CF ₃	4-F	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,30 (t, 3H), 2,42 (s, 3H), 2,80 (q, 2H), 7,28 (m, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,55 (s, 1H), 8,55 (s, 1H)
2,78	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H	CF ₃	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,20 (m, 2H), 3,00 (t, 2H), 3,40 (t, 2H), 7,42 (m, 1H), 7,55 (m, 3H), 7,92 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)

69
71

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
3,25	Et	H	H	CF ₃	
3,26	Et	Me	H	CF ₃	
3,27	Et	H	Me	CF ₃	
3,28	Et	H	H	Cl	
3,29	Et	Me	H	Cl	
3,30	Et	H	Me	Cl	
3,31	Et	H	H	CN	
3,32	Et	Me	H	CN	
3,33	Et	H	Me	CN	
3,34	Et	H	H	OCF ₂ H	
3,35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
3,36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
3,37	OMe	H	H	CF ₃	
3,38	OMe	Me	H	CF ₃	
3,39	OMe	H	Me	CF ₃	
3,40	OMe	H	H	Cl	
3,41	OMe	Me	H	Cl	
3,42	OMe	H	Me	Cl	
3,43	OMe	H	H	CN	
3,44	OMe	Me	H	CN	
3,45	OMe	H	Me	CN	
3,46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
3,47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
3,48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
3,49	Cl	H	H	CF ₃	
3,50	Cl	Me	H	CF ₃	
3,51	Cl	H	Me	CF ₃	
3,52	Cl	H	H	Cl	
3,53	Cl	Me	H	Cl	

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
3,54	Cl	H	Me	Cl	
3,55	Cl	H	H	CN	
3,56	Cl	Me	H	CN	
3,57	Cl	H	Me	CN	
3,58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
3,59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	
3,60	Cl	H	Me	OCF ₂ H	
3,61	CN	H	H	CF ₃	
3,62	CN	Me	H	CF ₃	
3,63	CN	H	Me	CF ₃	
3,64	CN	H	H	Cl	
3,65	CN	Me	H	Cl	
3,66	CN	H	Me	Cl	
3,67	CN	H	H	CN	
3,68	CN	Me	H	CN	
3,69	CN	H	Me	CN	
3,70	CN	H	H	OCF ₂ H	
3,71	CN	Me	H	OCF ₂ H	
3,72	CN	H	Me	OCF ₂ H	

$$R^0 = H$$

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
4,1	H	H	H	CF ₃	
4,2	H	Me	H	CF ₃	
4,3	H	H	Me	CF ₃	
4,4	H	H	H	Cl	
4,5	H	Me	H	Cl	
4,6	H	H	Me	Cl	
4,7	H	H	H	CN	
4,8	H	Me	H	CN	
4,9	H	H	Me	CN	
4,10	H	H	H	OCF ₂ H	
4,11	H	Me	H	OCF ₂ H	
4,12	H	H	Me	OCF ₂ H	
4,13	Me	H	H	CF ₃	
4,14	Me	Me	H	CF ₃	
4,15	Me	H	Me	CF ₃	
4,16	Me	H	H	Cl	
4,17	Me	Me	H	Cl	
4,18	Me	H	Me	Cl	
4,19	Me	H	H	CN	
4,20	Me	Me	H	CN	
4,21	Me	H	Me	CN	
4,22	Me	H	H	OCF ₂ H	
4,23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
4,24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
4,25	Et	H	H	CF ₃	
4,26	Et	Me	H	CF ₃	
4,27	Et	H	Me	CF ₃	
4,28	Et	H	H	Cl	

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
4,29	Et	Me	H	Cl	
4,30	Et	H	Me	Cl	
4,31	Et	H	H	CN	
4,32	Et	Me	H	CN	
4,33	Et	H	Me	CN	
4,34	Et	H	H	OCF ₂ H	
4,35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
4,36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
4,37	OMe	H	H	CF ₃	
4,38	OMe	Me	H	CF ₃	
4,39	OMe	H	Me	CF ₃	
4,40	OMe	H	H	Cl	
4,41	OMe	Me	H	Cl	
4,42	OMe	H	Me	Cl	
4,43	OMe	H	H	CN	
4,44	OMe	Me	H	CN	
4,45	OMe	H	Me	CN	
4,46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
4,47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
4,48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
4,49	Cl	H	H	CF ₃	
4,50	Cl	Me	H	CF ₃	
4,51	Cl	H	Me	CF ₃	
4,52	Cl	H	H	Cl	
4,53	Cl	Me	H	Cl	
4,54	Cl	H	Me	Cl	
4,55	Cl	H	H	CN	
4,56	Cl	Me	H	CN	
4,57	Cl	H	Me	CN	
4,58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
4,59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
4,60	Cl	H	Me	OCF ₂ H	
4,61	CN	H	H	CF ₃	
4,62	CN	Me	H	CF ₃	
4,63	CN	H	Me	CF ₃	
4,64	CN	H	H	Cl	
4,65	CN	Me	H	Cl	
4,66	CN	H	Me	Cl	
4,67	CN	H	H	CN	
4,68	CN	Me	H	CN	
4,69	CN	H	Me	CN	
4,70	CN	H	H	OCF ₂ H	
4,71	CN	Me	H	OCF ₂ H	
4,72	CN	H	Me	OCF ₂ H	

Tabla 5: Compuestos conformes al invento de la fórmula general (I), en la que los sustituyentes y símbolos tienen los siguientes significados:

Y = Y5 R² = H

5

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	Datos físicos
5,1	H	H	H	
5,2	H	Me	H	
5,3	H	H	Me	
5,4	H	H	H	
5,5	H	Me	H	
5,6	H	H	Me	
5,7	H	H	H	
5,8	H	Me	H	
5,9	H	H	Me	
5,10	H	H	H	
5,11	H	Me	H	
5,12	H	H	Me	

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	Datos físicos
5,13	Me	H	H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,58 (s, 3H), 7,03 (m, 2H), 7,15 (m, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,92 (s, 1H), 8,62 (s, 1H)
5,14	Me	Me	H	
5,15	Me	H	Me	
5,16	Me	H	H	
5,17	Me	Me	H	
5,18	Me	H	Me	
5,19	Me	H	H	
5,20	Me	Me	H	
5,21	Me	H	Me	
5,22	Me	H	H	
5,23	Me	Me	H	
5,24	Me	H	Me	
5,25	Et	H	H	
5,26	Et	Me	H	
5,27	Et	H	Me	
5,28	Et	H	H	
5,29	Et	Me	H	
5,30	Et	H	Me	
5,31	Et	H	H	
5,32	Et	Me	H	
5,33	Et	H	Me	
5,34	Et	H	H	
5,35	Et	Me	H	
5,36	Et	H	Me	
5,37	OMe	H	H	
5,38	OMe	Me	H	
5,39	OMe	H	Me	
5,40	OMe	H	H	
5,41	OMe	Me	H	
5,42	OMe	H	Me	

45
77

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	Datos físicos
5,43	OMe	H	H	
5,44	OMe	Me	H	
5,45	OMe	H	Me	
5,46	OMe	H	H	
5,47	OMe	Me	H	
5,48	OMe	H	Me	
5,49	Cl	H	H	
5,50	Cl	Me	H	
5,51	Cl	H	Me	
5,52	Cl	H	H	
5,53	Cl	Me	H	
5,54	Cl	H	Me	
5,55	Cl	H	H	
5,56	Cl	Me	H	
5,57	Cl	H	Me	
5,58	Cl	H	H	
5,59	Cl	Me	H	
5,60	Cl	H	Me	
5,61	CN	H	H	
5,62	CN	Me	H	
5,63	CN	H	Me	
5,64	CN	H	H	
5,65	CN	Me	H	
5,66	CN	H	Me	
5,67	CN	H	H	
5,68	CN	Me	H	
5,69	CN	H	Me	
5,70	CN	H	H	
5,71	CN	Me	H	
5,72	CN	H	Me	

70
78

Tabla 6: Compuestos conformes al invento de la fórmula general (I), en la que los sustituyentes y símbolos tienen los siguientes significados:

Y = Y6 R², R⁶ = H R⁷ = Et

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
6,1	H	H	H	CF ₃	
6,2	H	Me	H	CF ₃	
6,3	H	H	Me	CF ₃	
6,4	H	H	H	Cl	
6,5	H	Me	H	Cl	
6,6	H	H	Me	Cl	
6,7	H	H	H	CN	
6,8	H	Me	H	CN	
6,9	H	H	Me	CN	
6,10	H	H	H	OCF ₂ H	
6,11	H	Me	H	OCF ₂ H	
6,12	H	H	Me	OCF ₂ H	
6,13	Me	H	H	CF ₃	
6,14	Me	Me	H	CF ₃	
6,15	Me	H	Me	CF ₃	
6,16	Me	H	H	Cl	
6,17	Me	Me	H	Cl	
6,18	Me	H	Me	Cl	
6,19	Me	H	H	CN	
6,20	Me	Me	H	CN	
6,21	Me	H	Me	CN	
6,22	Me	H	H	OCF ₂ H	
6,23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
6,24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
6,25	Et	H	H	CF ₃	
6,26	Et	Me	H	CF ₃	
6,27	Et	H	Me	CF ₃	
6,28	Et	H	H	Cl	

22
79

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
6,29	Et	Me	H	Cl	
6,30	Et	H	Me	Cl	
6,31	Et	H	H	CN	
6,32	Et	Me	H	CN	
6,33	Et	H	Me	CN	
6,34	Et	H	H	OCF ₂ H	
6,35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
6,36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
6,37	OMe	H	H	CF ₃	
6,38	OMe	Me	H	CF ₃	
6,39	OMe	H	Me	CF ₃	
6,40	OMe	H	H	Cl	
6,41	OMe	Me	H	Cl	
6,42	OMe	H	Me	Cl	
6,43	OMe	H	H	CN	
6,44	OMe	Me	H	CN	
6,45	OMe	H	Me	CN	
6,46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
6,47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
6,48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
6,49	Cl	H	H	CF ₃	
6,50	Cl	Me	H	CF ₃	
6,51	Cl	H	Me	CF ₃	
6,52	Cl	H	H	Cl	
6,53	Cl	Me	H	Cl	
6,54	Cl	H	Me	Cl	
6,55	Cl	H	H	CN	
6,56	Cl	Me	H	CN	
6,57	Cl	H	Me	CN	
6,58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
6,59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
7,8	H	H	Me	H	CN	
7,9	H	H	H	Me	CN	
7,10	H	H	H	H	OCF ₂ H	
7,11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	
7,12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	
7,13	Me	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 7,36 (d, 2H), 7,45 (m, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,92 (s, 1H), 8,70 (s, 1H)
7,14	Me	H	Me	H	CF ₃	
7,15	Me	H	H	Me	CF ₃	
7,16	Me	H	H	H	Cl	
7,17	Me	H	Me	H	Cl	
7,18	Me	H	H	Me	Cl	
7,19	Me	H	H	H	CN	
7,20	Me	H	Me	H	CN	
7,21	Me	H	H	Me	CN	
7,22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	
7,23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	
7,24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	
7,25	Et	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,87 (q, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,92 (s, 1H), 8,70 (s, 1H)
7,26	Et	H	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,43 (s, 2H), 2,83 (q, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,57 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
7,27	Et	H	H	Me	CF ₃	
7,28	Et	H	H	H	Cl	
7,29	Et	H	Me	H	Cl	
7,30	Et	H	H	Me	Cl	
7,31	Et	H	H	H	CN	

82

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
7,32	Et	H	Me	H	CN	
7,33	Et	H	H	Me	CN	
7,34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	
7,35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	
7,36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	
7,37	OMe	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 4,00 (s, 3H), 7,05 (s, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,90 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
7,38	OMe	H	Me	H	CF ₃	
7,39	OMe	H	H	Me	CF ₃	
7,40	OMe	H	H	H	Cl	
7,41	OMe	H	Me	H	Cl	
7,42	OMe	H	H	Me	Cl	
7,43	OMe	H	H	H	CN	
7,44	OMe	H	Me	H	CN	
7,45	OMe	H	H	Me	CN	
7,46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	
7,47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	
7,48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	
7,49	Cl	H	H	H	CF ₃	
7,50	Cl	H	Me	H	CF ₃	
7,51	Cl	H	H	Me	CF ₃	
7,52	Cl	H	H	H	Cl	
7,53	Cl	H	Me	H	Cl	
7,54	Cl	H	H	Me	Cl	
7,55	Cl	H	H	H	CN	
7,56	Cl	H	Me	H	CN	
7,57	Cl	H	H	Me	CN	
7,58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
7,59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	
7,60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	
7,61	CN	H	H	H	CF ₃	
7,62	CN	H	Me	H	CF ₃	
7,63	CN	H	H	Me	CF ₃	
7,64	CN	H	H	H	Cl	
7,65	CN	H	Me	H	Cl	
7,66	CN	H	H	Me	Cl	
7,67	CN	H	H	H	CN	
7,68	CN	H	Me	H	CN	
7,69	CN	H	H	Me	CN	
7,70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	
7,71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	
7,72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	
7,73	n-Pr	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,00 (t, 3H), 2,43 (s, 1H), 2,80 (t, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,93 (s, 1H), 8,72 (s, 1H)
7,74	CH ₂ CH ₂ CH ₂			Me	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,20 (m, 2H), 3,06 (t, 2H), 3,40 (t, 2H), 7,32 (d, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,97 (s, 1H), 8,73 (s, 1H)

84

Tabla 8: Compuestos conformes al invento de la fórmula general (I), en la que los sustituyentes y símbolos tienen los siguientes significados:

$Y = Y8$
 $R^2 = H$
 $R^9 = H$

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
8,1	H	H	H	CF ₃	
8,2	H	Me	H	CF ₃	
8,3	H	H	Me	CF ₃	
8,4	H	H	H	Cl	
8,5	H	Me	H	Cl	
8,6	H	H	Me	Cl	
8,7	H	H	H	CN	
8,8	H	Me	H	CN	
8,9	H	H	Me	CN	
8,10	H	H	H	OCF ₂ H	
8,11	H	Me	H	OCF ₂ H	
8,12	H	H	Me	OCF ₂ H	
8,13	Me	H	H	CF ₃	
8,14	Me	Me	H	CF ₃	
8,15	Me	H	Me	CF ₃	
8,16	Me	H	H	Cl	
8,17	Me	Me	H	Cl	
8,18	Me	H	Me	Cl	
8,19	Me	H	H	CN	
8,20	Me	Me	H	CN	
8,21	Me	H	Me	CN	
8,22	Me	H	H	OCF ₂ H	
8,23	Me	Me	H	OCF ₂ H	
8,24	Me	H	Me	OCF ₂ H	
8,25	Et	H	H	CF ₃	
8,26	Et	Me	H	CF ₃	
8,27	Et	H	Me	CF ₃	
8,28	Et	H	H	Cl	

Nº	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
8,29	Et	Me	H	Cl	
8,30	Et	H	Me	Cl	
8,31	Et	H	H	CN	
8,32	Et	Me	H	CN	
8,33	Et	H	Me	CN	
8,34	Et	H	H	OCF ₂ H	
8,35	Et	Me	H	OCF ₂ H	
8,36	Et	H	Me	OCF ₂ H	
8,37	OMe	H	H	CF ₃	
8,38	OMe	Me	H	CF ₃	
8,39	OMe	H	Me	CF ₃	
8,40	OMe	H	H	Cl	
8,41	OMe	Me	H	Cl	
8,42	OMe	H	Me	Cl	
8,43	OMe	H	H	CN	
8,44	OMe	Me	H	CN	
8,45	OMe	H	Me	CN	
8,46	OMe	H	H	OCF ₂ H	
8,47	OMe	Me	H	OCF ₂ H	
8,48	OMe	H	Me	OCF ₂ H	
8,49	Cl	H	H	CF ₃	
8,50	Cl	Me	H	CF ₃	
8,51	Cl	H	Me	CF ₃	
8,52	Cl	H	H	Cl	
8,53	Cl	Me	H	Cl	
8,54	Cl	H	Me	Cl	
8,55	Cl	H	H	CN	
8,56	Cl	Me	H	CN	
8,57	Cl	H	Me	CN	
8,58	Cl	H	H	OCF ₂ H	
8,59	Cl	Me	H	OCF ₂ H	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
9,8	H	H	Me	H	CN	
9,9	H	H	H	Me	CN	
9,10	H	H	H	H	OCF ₂ H	
9,11	H	H	Me	H	OCF ₂ H	
9,12	H	H	H	Me	OCF ₂ H	
9,13	Me	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 3,85 (s, 3H), 6,47 (s, 1H), 7,95 (d, 1H), 8,75 (d, 1H)
9,14	Me	H	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,40 (s, 3H), 2,60 (s, 3H), 3,85 (s, 3H), 6,45 (s, 1H), 7,60 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
9,15	Me	H	H	Me	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,52 (s, 3H), 2,60 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 6,35 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,82 (s, 1H)
9,16	Me	H	H	H	Cl	
9,17	Me	H	Me	H	Cl	
9,18	Me	H	H	Me	Cl	
9,19	Me	H	H	H	CN	
9,20	Me	H	Me	H	CN	
9,21	Me	H	H	Me	CN	
9,22	Me	H	H	H	OCF ₂ H	
9,23	Me	H	Me	H	OCF ₂ H	
9,24	Me	H	H	Me	OCF ₂ H	
9,25	Et	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,90 (q, 2H), 3,86 (s, 3H), 6,47 (s, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 8,75 (s, 1H)
9,26	Et	H	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,34 (t, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,80 (q, 2H), 3,95 (s, 3H), 6,50 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
9,27	Et	H	H	Me	CF ₃	
9,28	Et	H	H	H	Cl	



Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	Datos físicos
9,29	Et	H	Me	H	Cl	
9,30	Et	H	H	Me	Cl	
9,31	Et	H	H	H	CN	
9,32	Et	H	Me	H	CN	
9,33	Et	H	H	Me	CN	
9,34	Et	H	H	H	OCF ₂ H	
9,35	Et	H	Me	H	OCF ₂ H	
9,36	Et	H	H	Me	OCF ₂ H	
9,37	OMe	H	H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 3,85 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 6,42 (s, 1H), 7,15 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,65 (s, 1H)
9,38	OMe	H	Me	H	CF ₃	
9,39	OMe	H	H	Me	CF ₃	
9,40	OMe	H	H	H	Cl	
9,41	OMe	H	Me	H	Cl	
9,42	OMe	H	H	Me	Cl	
9,43	OMe	H	H	H	CN	
9,44	OMe	H	Me	H	CN	
9,45	OMe	H	H	Me	CN	
9,46	OMe	H	H	H	OCF ₂ H	
9,47	OMe	H	Me	H	OCF ₂ H	
9,48	OMe	H	H	Me	OCF ₂ H	
9,49	Cl	H	H	H	CF ₃	
9,50	Cl	H	Me	H	CF ₃	
9,51	Cl	H	H	Me	CF ₃	
9,52	Cl	H	H	H	Cl	
9,53	Cl	H	Me	H	Cl	
9,54	Cl	H	H	Me	Cl	
9,55	Cl	H	H	H	CN	
9,56	Cl	H	Me	H	CN	
9,57	Cl	H	H	Me	CN	

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
9,58	Cl	H	H	H	OCF ₂ H	
9,59	Cl	H	Me	H	OCF ₂ H	
9,60	Cl	H	H	Me	OCF ₂ H	
9,61	CN	H	H	H	CF ₃	
9,62	CN	H	Me	H	CF ₃	
9,63	CN	H	H	Me	CF ₃	
9,64	CN	H	H	H	Cl	
9,65	CN	H	Me	H	Cl	
9,66	CN	H	H	Me	Cl	
9,67	CN	H	H	H	CN	
9,68	CN	H	Me	H	CN	
9,69	CN	H	H	Me	CN	
9,70	CN	H	H	H	OCF ₂ H	
9,71	CN	H	Me	H	OCF ₂ H	
9,72	CN	H	H	Me	OCF ₂ H	
9,73	H	Et	H	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,90 (q, 2H), 3,82 (s, 3H), 6,40 (s, 1H), 6,63 (t, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,75 (s, 1H)
9,74	H	Et	Me	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,35 (t, 3H), 2,43 (s, 3H), 2,85 (q, 2H), 3,80 (s, 3H), 6,40 (s, 1H), 6,61 (t, 1H), 7,60 (s, 1H), 8,60 (s, 1H)
9,75	H	H	H	H	c-Pr	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 0,75 (m, 2H), 0,93 (m, 2H), 1,93 (m, 1H), 3,68 (s, 3H), 5,80 (s, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,68 (d, 1H), 8,00 (s, 1H)
9,76	H	Me	H	H	c-Pr	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 0,75 (m, 2H), 0,92 (m, 2H), 1,92 (m, 1H), 2,60 (s, 3H), 3,70 (s, 3H), 5,80 (s, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,70 (s, 1H)

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos
9,77	CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,20 (m, 2H), 3,05 (t, 2H), 3,40 (t, 2H), 3,97 (s, 3H), 6,50 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,80 (s, 1H)

891

Tabla 10: Compuestos conformes al invento de la fórmula general (I), en la que los sustituyentes y símbolos tienen los siguientes significados:

Y = Y9 R², R⁴, R⁶ = H R⁷ = Et

Nº	R ¹	R ³	R ⁵	Datos físicos
9,78	Me	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,60 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 6,40 (s, 1H), 6,64 (t, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,75 (s, 1H)
9,79	OMe	Me	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 2,43 (s, 3H), 3,85 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 6,42 (s, 1H), 7,08 (s, 1H), 8,55 (s, 1H)
9,80	OMe	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,45 (t, 3H), 4,00 (s, 3H), 4,15 (q, 2H), 6,35 (s, 1H), 6,62 (t, 1H), 7,15 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,65 (s, 1H)
9,81	Et	H	CF ₂ H	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,40 (t, 3H), 1,55 (t, 3H), 2,90 (q, 2H), 4,30 (q, 2H), 6,42 (s, 1H), 6,80 (t, 1H), 7,64 (s, 1H), 8,00 (s, 1H), 8,78 (s, 1H)
9,82	Me	H	CF ₃	¹ H-RMN: δ [CDCl ₃] 1,48 (t, 3H), 2,60 (s, 3H), 4,20 (q, 2H), 6,42 (s, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 8,75 (s, 1H)

B. Ejemplos de formulación

1. Agentes para espolvorear

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

2. Polvo dispersable

Se obtiene un polvo humectable, fácilmente dispersable en agua, mezclando 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I), 64 partes en peso de cuarzo con un contenido de caolín como material inerte, 10 partes en peso de una sal de potasio de ácido lignina-sulfónico y 1 parte en peso de una sal de sodio de ácido oleoil-metil-táurico como agentes humectantes y dispersantes, y moliéndolas en un molino de púas.

3. Concentrado para dispersión

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

4. Concentrado emulsionable

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

5. Granulado dispersable en agua

Se obtiene un granulado dispersable en agua, mezclando

75	partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I),
10	" " de una sal de calcio de ácido lignina-sulfónico,
5	" " de lauril-sulfato de sodio,
3	" " de un poli(alcohol vinílico), y
7	" " de caolín,

moliéndolas en un molino de púas y granulando el polvo en un lecho fluidizado mediante aplicación por rociado de agua como líquido de granulación.

- Se obtiene también un granulado dispersable en agua, homogeneizando y desmenuzando previamente en un molino de coloides
- 5 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I),
- 5 " " de una sal de sodio de ácido 2.2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfónico,
- 2 " " de una sal de sodio de ácido oleoil-metil-táurico,
- 1 " " de un poli(alcohol vinílico),
- 10 17 " " de carbonato de calcio, y
- 50 " " de agua,

a continuación moliéndolas en un molino de perlas, y atomizando y secando la suspensión así obtenida en una torre de atomización mediante una boquilla para un sólo material.

15

C. Ejemplos biológicos

1. Efecto herbicida contra plantas dañinas antes del brote

- Semillas de plantas de malezas mono- y di-cotiledóneas se colocan en macetas de cartón en tierra de légamo arenoso y se cubren con tierra. Los compuestos conformes al invento, formulados en forma de polvos humectables o de concentrados para emulsionar, se aplican luego en diferentes dosificaciones sobre la superficie de la tierra de cubrimiento en forma de una suspensión o emulsión acuosa con una cantidad consumida de agua que, convertida por cálculo, es de 600 a 800 l/ha. Después del tratamiento, las macetas se colocan en un invernadero y se mantienen en buenas condiciones de crecimiento para las malezas. La evaluación óptica de los daños para las plantas o para el brote se efectúa después de haber brotado las plantas ensayadas después de un período de tiempo de ensayo de 3 a 4 semanas en comparación con testigos sin tratar. En tal caso, por ejemplo, los compuestos conformes al invento de los Ejemplos N° 1,13, 1,14, 1,25, 1,26, 1,39 y 1,46, en una dosificación de 1.000 g y de menos que 1.000 g de una sustancia activa por hectárea, muestran un efecto del 100 % contra *Amaranthus retroflexus*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis* y *Stellaria media*. En la misma dosificación, por ejemplo, los compuestos conformes al invento de los Ejemplos N° 7,13, 9,13 y 9,14 muestran un efecto del 100 % contra *Amaranthus retroflexus*, *Setaria viridis* y *Stellaria media*.

Q3
Q4

2, Efecto herbicida contra plantas dañinas después del brote

Semillas de plantas dañinas mono- y di-cotiledóneas así como de plantas cultivadas se colocan en macetas de cartón en tierra de légamo arenoso, se cubren con tierra y se cultivan en un invernadero en buenas condiciones de crecimiento. De dos a tres

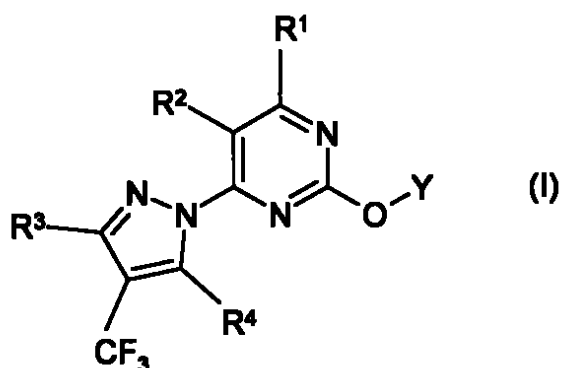
5 semanas después de la siembra se tratan las plantas ensayadas en el estadio de tres hojas. Los compuestos conformes al invento, formulados en forma de polvos para proyectar o de concentrados para emulsionar, se proyectan luego en diferentes dosificaciones sobre la superficie de las partes verdes de las plantas, con una cantidad consumida de agua que, convertida por cálculo, es de 600 a 800 l/ha. Después de un

10 período de tiempo de permanencia de 3 a 4 semanas de las plantas ensayadas en el invernadero en óptimas condiciones de crecimiento, se evalúa el efecto de los compuestos. En tal caso, por ejemplo, los compuestos conformes al invento de los Ejemplos N° 1,46 y 9,25, en una dosificación de 1.000 g y de menos que 1.000 g de una sustancia activa por hectárea, muestran un efecto del 100 % contra *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Sinapis arvensis* y *Stellaria media*.

15

Q27
45**Reivindicaciones de patente:**

1. Compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales,

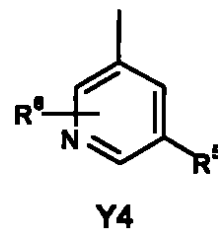
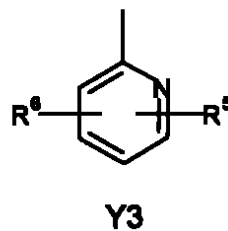
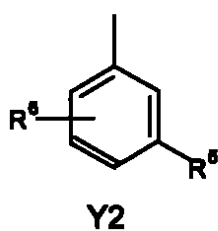
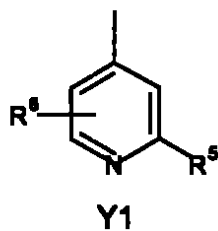


5

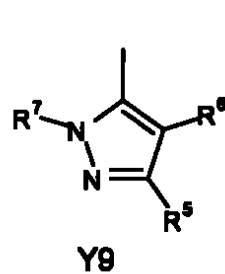
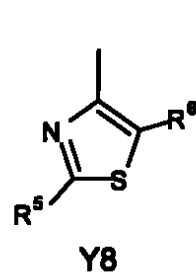
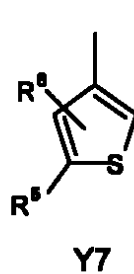
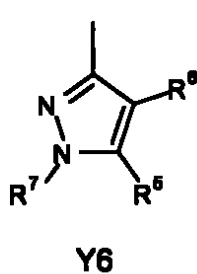
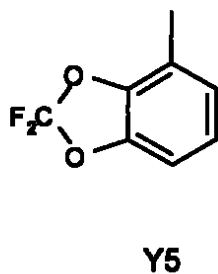
en la que los radicales e índices tienen los siguientes significados:

Y significa un radical seleccionado entre el conjunto formado por Y1 hasta Y9:

10



15



20

R¹ y **R²** significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, ciano, isociano, hidroxilo, COOR⁸, COR⁸, CH₂OH, CH₂SH, CH₂NH₂, NO₂, CSNH₂, CONH₂, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), halógeno-alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), alquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquenil (C₃-C₄)-oxi, alquinil (C₃-C₄)-oxi, alquil (C₁-C₂)-tio-alquilo (C₁-C₂), S(O)_nR⁸, alquil

25

(C₁-C₂)-sulfonil-alquilo (C₁-C₂), amino, alquil (C₁-C₄)-amino, alquil (C₁-C₃)-carbonilamino, alquil (C₁-C₄)-sulfonilamino o di-alquil (C₁-C₄)-amino,

o

R¹ y R² en común significan CH₂-CH₂-CH₂, CH₂-CH₂-CH₂-CH₂ o OCH₂-CH₂-CH₂O;

5

R³ y R⁴ significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄) o halógeno-alcoxi (C₁-C₄);

10 R⁵ significa halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halógeno-alcoxi (C₁-C₄), halógeno-alquil (C₁-C₄)-tio, cicloalquilo (C₃-C₆), halógeno-cicloalquilo (C₃-C₆), SF₆, S(O)_nR⁶, alquenilo (C₂-C₄) o alquinilo (C₂-C₄);

R⁶ significa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halógeno-alcoxi (C₁-C₄) o S(O)_nR⁶;

15

R⁷ significa alquilo (C₁-C₄);

R⁸ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄) o halógeno-alquilo (C₁-C₄);

20 R⁹ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄);

n significa 0, 1 o 2.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

25 R¹ y R² independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, formilo, vinilo, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), o alcoxi (C₁-C₄);

o

R¹ y R² significan en común CH₂CH₂CH₂;

30 R³ y R⁴ independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

Y significa un radical Y1, Y2, Y3, Y6, Y7, Y8 o Y9.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en los que

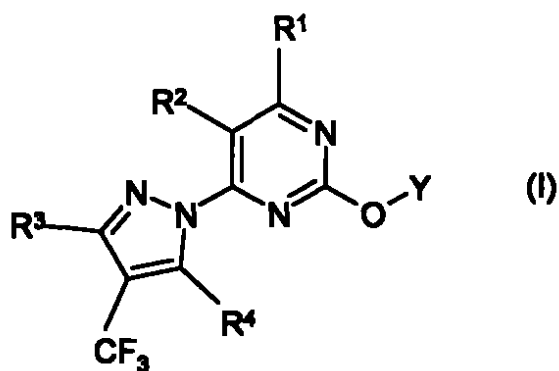
- R¹** significa hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, trifluorometilo, metoxi, metilo o etilo;
- R²** significa hidrógeno, hidroxilo, metilo, etilo, metoxi o etoxi,
- o
- 5 **R¹ y R²** significan en común CH₂-CH₂-CH₂;
- R³ y R⁴** independientemente uno de otro, significan hidrógeno o metilo.
4. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 hasta 3, en los que
- R⁵** significa halógeno, ciano, halógeno-alquilo (C₁-C₂), halógeno-alcoxi (C₁-C₂) o
- 10 halógeno-alquil (C₁-C₂)-tio.
5. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 hasta 4, en los que
- R² y R⁶** significan en cada caso hidrógeno así como Y representa Y1, Y2, Y7, Y8 o Y9.
- 15 6. Agentes herbicidas, caracterizados por un contenido eficaz como herbicida de por lo menos un compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 hasta 5,
7. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 6 en mezcla con agentes
- 20 coadyuvantes de formulación.
8. Procedimiento para la represión de plantas indeseadas, caracterizado porque una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 bis 5 o de un agente herbicida de acuerdo
- 25 con la reivindicación 6 o 7 se aplica sobre las plantas o sobre el sitio del crecimiento de las plantas indeseadas.
9. Utilización de compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 hasta 5 o de agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 6
- 30 o 7 para la represión de las plantas indeseadas.
10. Utilización de acuerdo con la reivindicación 9, caracterizada porque los compuestos de la fórmula general (I) se emplean para la represión de las plantas indeseadas en cultivos de plantas útiles.

11. Utilización de acuerdo con la reivindicación 10, caracterizada porque las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.

.

Resumen:**4-(4-Trifluorometilpirazolil)-pirimidinas sustituidas**

- 5 Se describen 4-(4-trifluorometilpirazolil)-pirimidinas de la fórmula (I) y su utilización como herbicidas.



- En esta fórmula general (I) R¹, R², R³ y R⁴ representan diferentes radicales e Y
10 representa un radical aromático o heteroaromático.

100

TRATAD DE COOPERACION EN MATERIA DE PATENTES

De: LA ADMINISTRACIÓN DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Destinatario:
BAYER CROPSCIENCE GMBH
Patent- und Lizenzabteilung
Industriepark Höchst Gebäude K 607
65926 Frankfurt
ALEMANIA

PCT

NOTIFICACIÓN DE TRANSMISIÓN DEL INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD (Capítulo II del Tratado de Cooperación en materia de Patentes) (Regla 71.1 del PCT)

Referencia del expediente del solicitante o del mandatario		Fecha de expedición (día/mes/año)
BCS 04-1005		14.02.2006
NOTIFICACIÓN IMPORTANTE		
Solicitud Internacional nº	Fecha de presentación internacional (día/mes/año)	Fecha de prioridad (día/mes/año)
PCT/EP2005/002049	26.02.2005	10.03.2004
Solicitante BAYER CROPSCIENCE GMBH		

- 1. Se notifica al solicitante que la Administración encargada del examen preliminar internacional ha emitido el informe de examen preliminar internacional para la solicitud internacional y se lo transmite adjunto, acompañado, al procede, de sus anexos.
- 2. Se transmite una copia del presente informe y, al procede, de sus anexos, a la Oficina Internacional para comunicación a todas las Oficinas elegidas.
- 3. Si alguna Oficina elegida lo exige, la Oficina Internacional realizará una traducción en inglés del informe (con exclusión de sus anexos) y la transmitirá a las Oficinas interesadas.

4. RECORDATORIO

Para iniciar la fase nacional ante cada Oficina elegida, el solicitante debe cumplir ciertos actos (presentación de traducción y pago de las tasas nacionales) en el plazo de 30 meses desde la fecha de prioridad (o más tarde por lo que respecta a ciertas Oficinas) (Artículo 39.1)) (véase también el recordatorio enviado por la Oficina Internacional en el formulario PCT/IB/301),

Cuando deba entregarse una traducción de la solicitud internacional a una Oficina elegida, se incluirá la traducción de cualquier anexo del informe de examen preliminar internacional. Corresponde al solicitante preparar la traducción en cuestión y entregarla directamente a cada Oficina elegida interesada.

Para más amplos detalles en lo relativo a los plazos aplicables y las exigencias de las Oficinas elegidas, véase el Volumen II de la Guía del Solicitante PCT.

Se llama la atención del solicitante sobre el Artículo 33.5 que prevé que los criterios de novedad, actividad inventiva y de aplicación industrial definidos en el Artículo 33.2 a 4 sólo servirán a los efectos del examen preliminar internacional, y que "todo Estado contratante puede aplicar criterios adicionales o diferentes al objeto de decidir, en ese Estado, si la invención es patentable o no" (véase también el artículo 27.5). Tales criterios adicionales pueden afectar, por ejemplo, a las excepciones de patentabilidad, requisitos específicos relativos a la divulgación, la claridad de las reivindicaciones o sobre la cuestión de si las reivindicaciones se fundan en la descripción.

Nombre y dirección postal de la Administración encargada del examen preliminar internacional Europaleches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2 N.L.-2280 HV Rijswijk – Países Bajos (Holanda) Tel. +31 70 340 – 2040 Tlx 31 851 apo nl Nº de fax: +31 70 340 - 3018	Funcionario autorizado Cardenas, C Nº de teléfono: +31 70 340-3370
---	--

199
10/

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

PCT

INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD
(Capítulo II del Tratado de Cooperación en materia de Patentes)

Referencia del expediente del solicitante o del mandatario BCS 04-1005	PARA ACCIÓN Véase formulario PCT/IPEA/416	
Solicitud internacional n° PCT/EP2005/002049	Fecha de presentación internacional (Día/mes/año) 26.02.2005	Fecha de prioridad (día/mes/año) 10.03.2004
Clasificación internacional de Patentes (IPC) o a la vez clasificación nacional e IPC A01N43/72, A01N43/48, C07D417/14, C07D409/14, C07D405/14, C07D403/04, C07D403/14, C07D401/14		
Solicitante BAYER CROPSCIENCE GMBH		

1. El presente informe preliminar internacional sobre patentabilidad, se establece por esta Administración encargada del examen preliminar internacional según el Artículo 35 y se transmite al solicitante conforme al Artículo 38. 2. Este INFORME comprende 5 hojas, incluida la presente hoja de portada. 3. Este informe también contiene ANEXOS, que comprenden a. ☐ (remitido al solicitante y a la Oficina internacional) un total de _____ hojas, descritas a continuación ☐ hojas de la descripción, las reivindicaciones y/o los dibujos que han sido modificadas y que sirven de base al presente informe, y/o de hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta Administración (véase la Regla 70.16 y la Instrucción Administrativa 807 del PCT) ☐ hojas que reemplazan a otras hojas anteriores, pero que esta Administración considera que contienen modificaciones que se extienden más allá de la divulgación de la invención tal como fue originalmente presentada, según se indica en el punto 4 del Recuadro I y en el Recuadro Suplementario b. ☐ (remitido únicamente a la Oficina internacional) un total de (Indicar tipo y número de soporte(s) electrónico(s)) _____, que contiene una lista de secuencias y/o tabla(s) relativas(a), sólo en formato legible por ordenador, como se indica en el Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias (ver Instrucción Administrativa 802).
4. El presente informe contiene indicaciones relativas a los puntos siguientes: ☒ Recuadro I Base de este informe ☐ Recuadro II Prioridad ☐ Recuadro III No formulación de opinión sobre la novedad la actividad inventiva y la aplicación industrial ☐ Recuadro IV Falta de unidad de invención ☒ Recuadro V Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración ☐ Recuadro VI Ciertos documentos citados ☐ Recuadro VII Defectos en la solicitud internacional ☐ Recuadro VIII Observaciones relativas a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la solicitud de examen preliminar internacional 13.12.2005	Fecha de finalización del presente informe 14.02.2008
Nombre y dirección postal de la Administración encargada del examen preliminar internacional Europatentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 N.L.-2280 HV Rijswijk - Países Bajos (Holanda) Tel. +31 70 340 - 2040 Tlx: 31 851 epo nl N° de fax: +31 70 340 - 3016	Funcionario autorizado Fritz, M N° de teléfono: +31 70 340

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD**

Solicitud Internacional N°
PCT/EP2005/002049

Recuadro I. Base de este informe

1. Por lo que respecta al idioma, este informe se ha establecido sobre la base de la solicitud internacional en el idioma en el cual se depositó, salvo indicación en contra señalada a continuación.
 - ☐ Este informe está basada en una traducción del idioma original al siguiente idioma _____, que es el de una traducción proporcionada a los fines de:
 - ☐ búsqueda internacional (según Reglas 12.3 y 23.1. b))
 - ☐ publicación de la solicitud internacional (según Regla 12.4)
 - ☐ examen preliminar internacional (según Reglas 55.2 y/o 55.3)
2. Por lo que respecta a los elementos de la solicitud internacional, esta opinión se ha establecido sobre la base de (las hojas de reemplazo que hayan sido enviadas a la Oficina receptora en respuesta a un requerimiento según el artículo 14 se las denomina en este informe como "inicialmente presentadas" y no se anexan al informe):
 - ☐ La solicitud internacional tal y como fue inicialmente presentada/enviada
 - ☐ La descripción:
Páginas ____ 1-55 _____, tal como se presentaron/enviaron inicialmente
 - ☐ Las reivindicaciones:
Páginas ____ 1-11 _____, tal como se presentaron/enviaron inicialmente
 - ☐ Una lista de secuencias y/o eventuales tabla(s) relativa(s) – ver Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias
3. ☐ Las modificaciones ha ocasionado la anulación de:
 - ☐ la descripción, páginas _____
 - ☐ las reivindicaciones, N°s _____
 - ☐ los dibujos, hojas/fig. _____
 - ☐ la lista de secuencias (precisar) _____
 - ☐ tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (precisar) _____
4. ☐ El presente informe ha sido establecido como si no se hubiesen presentado (algunas de) las modificaciones anexadas a este informe y listadas abajo, ya que se ha considerado que iban más allá de la divulgación de la invención tal como fue presentada, como se indica en el Recuadro Suplementario (Regla 70.2.c)).
 - ☐ La descripción, páginas _____
 - ☐ Las reivindicaciones, N°s _____
 - ☐ Los dibujos, hojas/fig. _____
 - ☐ La lista de secuencias (precisar) _____
 - ☐ Tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (precisar) _____

* Si se utiliza el punto 4, algunas o todas estas páginas pueden llevar el sello de "sustituida"

101
103

INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD

Solicitud internacional Nº
PCT/EP2005/002049

Recuadro V. Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación Industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

1. Declaración

Novedad	Si: Reivindicaciones 1-11 No: Reivindicaciones
Actividad inventiva	Si: Reivindicaciones 1-11 No: Reivindicaciones
Aplicación Industrial	Si: Reivindicaciones 1-11 No: Reivindicaciones

2. Citas y explicaciones (Regla 70.7)
Ver hoja separada

HOJA SEPARADA**Acercas del Recuadro V**

Declaración motivada según el Artículo 66.2 (a)(ii) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

- D1: WO 2004/013128 A (BAYER CROPS SCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12 Febrero 2004 (12-02-2004)**
- D2: WO 2004/013131 A (BAYER CROPS SCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12 Febrero 2004 (12-02-2004)**
- D3: WO 98/401378 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, SELBY, THOMAS, P) 17. Septiembre 1998 (17-09-1998)**

La presente solicitud divulga compuestos de la fórmula general (I) (reivindicaciones 1-5), agentes herbicidas. Que contienen estos compuestos (I) (reivindicaciones 6-7), un procedimiento para la represión de plantas indeseadas mediante (I) (reivindicación 8) así como su utilización para la represión de plantas indeseadas (reivindicaciones 9-11).

Los compuestos (I) de acuerdo con la solicitud consisten en una pirimidina eventualmente sustituida, a la que están unidos, en la posición 2 un grupo aril o al o heteroaril o al O-Y y en la posición 4 un radical pirazol-1-ilo sustituido.

Compuestos estructuralmente comparables con efecto herbicida se describen en D1-D3; éstos constan asimismo de un grupo de pirimidina central, eventualmente sustituido, pero aquí un radical comparable al grupo O-Y de acuerdo con la solicitud está unido a la pirimidina en la posición 4 y un radical pirazol-1-ilo sustituido está unido a la pirimidina en la posición 2.

Por lo tanto el objeto de las reivindicaciones 1-11 es nuevo en el sentido del artículo 33(2) del PCT.

Como estado de la técnica más próximo se pueden considerar D1 así como también D2 o D3.

Fue misión de la presente solicitud poner a disposición nuevos derivados de pirimidina con efecto herbicida.

El problema planteado por la misión se resolvió mediante compuestos (I) de acuerdo con la solicitud, tal como se mostró mediante el Ejemplo indicado en la Memoria descriptiva.

Con el fin de llegar, partiendo de los compuestos divulgados en D1-D3, a los compuestos (I) de acuerdo con la solicitud, hubiera sido necesario de manera puramente formal el cambio de los sustituyentes en las posiciones 2 y 4 entre ellos. Puesto que los sustituyentes de los derivados de pirimidina incluso en la divulgación general de D1-D3, sin embargo, están establecidos fijamente, un experto en la especialidad, para el que son conocidos uno o varios de estos documentos, no tendría ninguna ocasión de tomar en consideración las modificaciones que hubieran conducido a representantes de los compuestos (I) de acuerdo con la solicitud, es decir que estos últimos no pueden considerarse como evidentes frente a D1-D3.

Como consecuencia de esto, se puede reconocer para el objeto de las reivindicaciones 1-11 una actividad inventiva en el sentido del artículo 33(3) del PCT-

Reparos:

En contradicción con las exigencias de la Regla 5.1 a) ii) del PCT no se indican en la memoria descriptiva ni en el estado de la técnica pertinente divulgado en los documentos D1-D2 ni tampoco estos documentos.

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

11L
103
105

Absender: MIT DER INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN PRÜFUNG BEAUFTRAGTE BEHÖRDE

PCT

An: Bayer CropScience GmbH Patent- und Lizenzabteilung Industriepark Höchst D-65926 Frankfurt a.M. ALLEMAGNE		Bayer CropScience GmbH Patent- u. Lizenzabteilung K 607 Vorg. Eing. 17. Feb. 2006 ☐ WW ☒ ablegen 15.12.06 ☐ Vert. wie Vorg. / angegeb.	MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN BERICHTS ZUR PATENTIERBARKEIT (Regel 71.1 PCT)
		Absendedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.02.2006	
Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts BCS 04-1005		WICHTIGE MITTEILUNG	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002049	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 26.02.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10.03.2004	
Anmelder BAYER CROPSCIENCE GMBH			

- Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der Internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Bericht zur Patentierbarkeit, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
- Eine Kopie des Berichts wird - gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen - dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
- Auf Wunsch eines ausgewählten Amtes wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.

4. ERINNERUNG

Zum Eintritt in die nationale Phase hat der Anmelder vor jedem ausgewählten Amt innerhalb von 30 Monaten ab dem Prioritätsdatum (oder in manchen Ämtern noch später) bestimmte Handlungen (Einreichung von Übersetzungen und Entrichtung nationaler Gebühren) vorzunehmen (Artikel 39 (1)) (siehe auch die durch das Internationale Büro im Formblatt PCT/IB/301 übermittelte Information).

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Bericht zur Patentierbarkeit enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu den maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Der Anmelder wird auf Artikel 33(5) hingewiesen, in welchem erklärt wird, daß die Kriterien für Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit, die im Artikel 33(2) bis (4) beschrieben werden, nur für die internationale vorläufige Prüfung Bedeutung haben, und daß "jeder Vertragsstaat (...) für die Entscheidung über die Patentfähigkeit der beanspruchten Erfindung in diesem Staat zusätzliche oder abweichende Merkmale aufstellen" kann (siehe auch Artikel 27(5)). Solche zusätzlichen Merkmale können z.B. Ausnahmen von der Patentierbarkeit, Erfordernisse für die Offenbarung der Erfindung sowie Klarheit und Stützung der Ansprüche betreffen.

Name und Postanschrift der mit der Internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3018	Bevollmächtigter Bediensteter Cardenas, C Tel. +31 70 340-3370	
--	--	---

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts BCS 04-1005	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/16	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002049	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 26.02.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10.03.2004
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A01N43/72, A01N43/48, C07D417/14, C07D409/14, C07D405/14, C07D403/04, C07D403/14, C07D401/14		
Anmelder BAYER CROPSCIENCE GMBH		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem legen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☐ (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um ☐ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enhalten, nur in computerisierbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).		
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids ☐ Feld Nr. II Priorität ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 13.12.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 14.02.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentaan 2 NL-2200 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tlx 31 661 epo nl Fax: +31 70 340 - 3018	Bevollmächtigter Bediensteter Fritz, M Tel. +31 70 340- 	

105
107

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*.

Beschreibung, Seiten

1-55 In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-11 In der ursprünglich eingereichten Fassung

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

108

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/002049

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|---------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-11 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-11 |
| | Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-11 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- D1: WO 2004/013129 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12. Februar 2004 (2004-02-12)
D2: WO 2004/013131 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12. Februar 2004 (2004-02-12)
D3: WO 98/40379 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY; SELBY, THOMAS, P) 17. September 1998 (1998-09-17)

Die vorliegende Anmeldung offenbart Verbindungen der allgemeinen Formel (I) (Ansprüche 1-5), herbizide Mittel, die diese Verbindungen (I) enthalten (Ansprüche 6-7), ein Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen mittels (I) (Anspruch 8) sowie deren Verwendung zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen (Ansprüche 9-11).

Die anmeldungsgemässen Verbindungen (I) bestehen aus einem eventuell substituier-ten Pyrimidin, an das in 2-Position eine Aryloxy- oder Heteroaryloxy-Gruppe O-Y und in 4-Position ein substituierter Pyrazol-1-yl-Rest gebunden ist.

Strukturell vergleichbare Verbindungen mit herbizider Wirkung sind in D1-D3 beschrieben; diese bestehen ebenfalls aus einer zentralen eventuell substituierten Pyrimidin-Gruppe, jedoch ist hier ein der anmeldungsgemässen O-Y-Gruppe vergleichbarer Rest in 4- und ein substituierter Pyrazol-1-yl-Rest in 2-Position an das Pyrimidin geknüpft.

Der Gegenstand der Ansprüche 1-11 ist daher neu im Sinne des Artikels 33(2) PCT.

Als nächster Stand der Technik kann D1 wie auch D2 oder D3 angesehen werden.

Aufgabe der vorliegenden Anmeldung war es, weitere Pyrimidin-Derivate mit herbizider Wirkung bereitzustellen.

Die Aufgabe wurde durch Vertreter der anmeldungsgemässen Verbindungen (I) gelöst, wie

durch die in der Beschreibung angegebenen Beispiele gezeigt wurde.

Um, ausgehend von den in D1-D3 offenbarten, zu den anmeldungsgemäßen Verbindungen (I) zu gelangen, wäre rein formal der Austausch der Substituenten in 2- und 4-Position gegeneinander erforderlich gewesen. Da die Substituenten der Pyrimidin-Derivate selbst in der generellen Offenbarung von D1-D3 jedoch in ihren speziellen Positionen festgelegt sind, hätte ein Fachmann, dem eines oder mehrere dieser Dokumente bekannt sind, keinen Anlass, die Modifikationen in Erwägung zu ziehen, die zu Vertretern der anmeldungsgemäßen Verbindungen (I) geführt hätten, d.h. letztere können gegenüber D1-D3 nicht als naheliegend angesehen werden.

Infolgedessen lässt sich für den Gegenstand der Ansprüche 1-11 eine erfinderische Tätigkeit im Sinne des Artikels 33(3) PCT anerkennen.

Beanstandungen:

Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1 a) ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in den Dokumenten D1-D2 offenbarte einschlägige Stand der Technik noch diese Dokumente angegeben.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP2005/002049

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A01N43/72 A01N43/48 C07D417/14 C07D409/14 C07D405/14
C07D403/04 C07D403/14 C07D401/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2004/013129 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12 February 2004 (2004-02-12) the whole document	1-11
A	WO 2004/013131 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12 February 2004 (2004-02-12) the whole document	1-11
A	WO 98/40379 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY; SELBY, THOMAS, P) 17 September 1998 (1998-09-17) cited in the application the whole document	1-11

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"I" document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document relating to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"d" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

30 May 2005

Date of mailing of the international search report

06/06/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Palantien 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fritz, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/002049

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2004013129	A	12-02-2004	DE 10234876 A1	05-02-2004
			AU 2003281853 A1	23-02-2004
			CA 2493749 A1	12-02-2004
			WO 2004013129 A1	12-02-2004
			EP 1527067 A1	04-05-2005
			US 2004082475 A1	29-04-2004
WO 2004013131	A	12-02-2004	DE 10234875 A1	05-02-2004
			AU 2003250942 A1	23-02-2004
			CA 2494593 A1	12-02-2004
			WO 2004013131 A2	12-02-2004
			EP 1527069 A2	04-05-2005
			US 2004072692 A1	15-04-2004
WO 9840379	A	17-09-1998	AU 725548 B2	12-10-2000
			AU 6863898 A	29-09-1998
			BR 9815453 A	23-10-2001
			CA 2280515 A1	17-09-1998
			EP 0970072 A1	12-01-2000
			WO 9840379 A1	17-09-1998
			US 6172005 B1	09-01-2001

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/002049

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A01N43/72 A01N43/48 C07D417/14 C07D409/14 C07D405/14
C07D403/04 C07D403/14 C07D401/14

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitr. Anspruch Nr.
A	WO 2004/013129 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12. Februar 2004 (2004-02-12) das ganze Dokument	1-11
A	WO 2004/013131 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12. Februar 2004 (2004-02-12) das ganze Dokument	1-11
A	WO 98/40379 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY; SELBY, THOMAS, P) 17. September 1998 (1998-09-17) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-11

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

30. Mai 2005

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts

06/06/2005

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 6818 Patentkan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-6040, Tx. 31 651 epe nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Fritz, M

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abkürzungszeichen

PCT/EP2005/002049

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2004013129 A	12-02-2004	DE 10234876 A1	05-02-2004
		AU 2003281853 A1	23-02-2004
		CA 2493749 A1	12-02-2004
		WO 2004013129 A1	12-02-2004
		EP 1527067 A1	04-05-2005
		US 2004082475 A1	29-04-2004
WO 2004013131 A	12-02-2004	DE 10234875 A1	05-02-2004
		AU 2003250942 A1	23-02-2004
		CA 2494593 A1	12-02-2004
		WO 2004013131 A2	12-02-2004
		EP 1527069 A2	04-05-2005
		US 2004072692 A1	15-04-2004
WO 9840379 A	17-09-1998	AU 725548 B2	12-10-2000
		AU 6863898 A	29-09-1998
		BR 9815453 A	23-10-2001
		CA 2280515 A1	17-09-1998
		EP 0970072 A1	12-01-2000
		WO 9840379 A1	17-09-1998
		US 6172005 B1	09-01-2001

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RAD: 05-000030-0000-0000
Fee: 2008-08-07 16:58:05 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTE(I)
Eve: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION Folios: 110

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

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 trazado ☐
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☐

COMPLETA ☐

INCOMPLETA ☐


Firma Responsable

Fecha 07 SET. 2008

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@slc.gov.co
www.slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

OLARTERAISBECK

0611871



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 86-089830-00000-0000..
Fec: 2005-09-07 16:58:05 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra: 11 PATENTE/II
Eve: 379 FASENACIONALI
Act: 411 PRESENTACION Folios: 110

**PETITORIO - FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD
PATENTE PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

SOLICITUD DE:



Patente de Invención.



Patente de Modelo de Utilidad.



Capítulo I.



Capítulo II.



**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: BAYER CROPSCIENCE GMBHDirección: Brüningstrasse 50, 65929
Frankfurt, Alemania.Nacionalidad o Domicilio: ALEMANALugar de Constitución: ALEMANIA

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual _____

Número _____

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: CARLOS R. OLARTEDirección: World Trade Center Torre A,
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual _____

Número 79782747Bta
TP 74.295

**INVENTOR (ES)
(72)**

Nombre: VER PÁGINA ADJUNTADirección: VER PAGINA ADJUNTANacionalidad o Domicilio: VER PAGINA ADJUNTA

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/002049Fecha Febrero 26, 2005Publicación Internacional No. WO 2005/089551Fecha Septiembre 29, 2005Título (54) 4-(4-TRIFLUOROMETILPIRAZOLIL)-PIRIMIDINAS SUSTITUIDASClasificación Internacional (51) A01N 43/72, 43/48, C07D 417/14, 409/14,
405/14, 403/04, 403/14, 401/14.

Prioridad

SI



N



(33) País de Origen

DE

(32) Fecha

Marzo 10, 2004

(31) Número de Solicitud

10 2004 011 705.5

LISTA DE INVENTORES PCT/EP2005/002049

HOFFMANN, Michael, Gerhard
Jahnstrasse 6a, 65439 Flörsheim
Alemania
Nacionalidad: Alemana

HELMKE, Hendrik
Taunusstrasse 49, 65853 Liederbach
Alemania
Nacionalidad: Alemana

WILLMS, Lothar
Königsteiner Strasse 50,
65719 Hofheim
Alemania
Nacionalidad: Alemana

AULER, Thomas
Bonner Strasse 15,
65812 Bad Soden a. Ts.
Alemania
Nacionalidad: Alemana

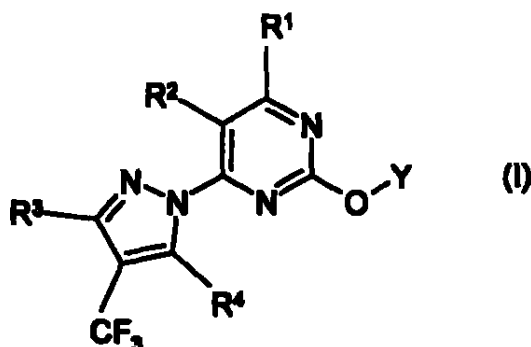
KEHNE, Heinz
Ittisweg 7a,
65719 Hofheim
Alemania
Nacionalidad: Alemana

HILLS, Martin
Am Itzelgrund 5b,
65719 Hofheim
Alemania
Nacionalidad: Británica

FEUCHT, Dieter
Am Burggraben 7a,
65760 Eschborn
Alemania
Nacionalidad: Alemana

Reivindicaciones de patente:

1. Compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales,

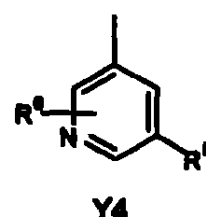
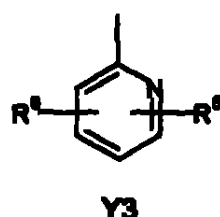
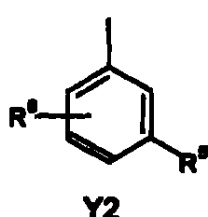
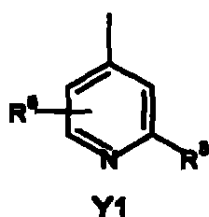


5

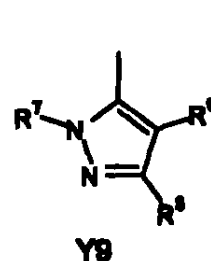
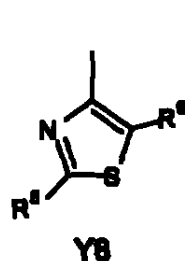
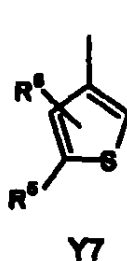
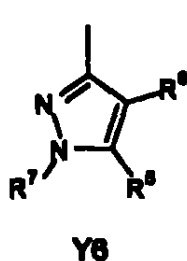
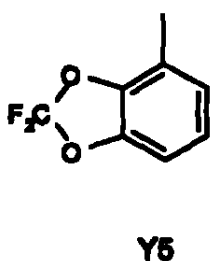
en la que los radicales e índices tienen los siguientes significados:

Y significa un radical seleccionado entre el conjunto formado por Y1 hasta Y9:

10



15



20

25

R¹ y R² significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, ciano, isociano, hidroxil, COOR⁹, COR⁹, CH₂OH, CH₂SH, CH₂NH₂, NO₂, CSNH₂, CONH₂, alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), halógeno-alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), alquienilo (C₂-C₄), alquiniilo (C₂-C₄), alqueniil (C₂-C₄)-oxi, alquiniil (C₂-C₄)-oxi, alquil (C₁-C₂)-tio-alquilo (C₁-C₂), S(O)_nR⁹, alquil

(C₁-C₂)-sulfonil-alkilo (C₁-C₂), amino, alkil (C₁-C₄)-amino, alkil (C₁-C₂)-carbonilamino, alkil (C₁-C₄)-sulfonilamino o di-alkil (C₁-C₄)-amino,

o

R¹ y R² en común significan CH₂-CH₂-CH₂, CH₂-CH₂-CH₂-CH₂ o OCH₂-CH₂-CH₂O;

5

R³ y R⁴ significan, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, clano, alkilo (C₁-C₄), halógeno-alkilo (C₁-C₄), alcoxí (C₁-C₄) o halógeno-alcóxí (C₁-C₄);

10

R⁵ significa halógeno, clano, alkilo (C₁-C₄), halógeno-alkilo (C₁-C₄), alcoxí (C₁-C₄), halógeno-alcóxí (C₁-C₄), halógeno-alkil (C₁-C₄)-tio, cicloalkilo (C₃-C₆), halógeno-cicloalkilo (C₃-C₆), SF₆, S(O)_nR⁶, alquénilo (C₂-C₄) o alquínilo (C₂-C₄);

R⁶ significa hidrógeno, halógeno, clano, alkilo (C₁-C₄), halógeno-alkilo (C₁-C₄), alcoxí (C₁-C₄), halógeno-alcóxí (C₁-C₄) o S(O)_nR⁶;

15

R⁷ significa alkilo (C₁-C₄);

R⁸ significa hidrógeno, alkilo (C₁-C₄) o halógeno-alkilo (C₁-C₄);

20

R⁹ significa hidrógeno o alkilo (C₁-C₄);

n significa 0, 1 o 2.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

25

R¹ y R² independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, clano, hidroxí, formilo, vinilo, alkilo (C₁-C₄), halógeno-alkilo (C₁-C₄), o alcoxí (C₁-C₄);

o

R¹ y R² significan en común CH₂CH₂CH₂;

30

R³ y R⁴ independientemente uno de otro, significan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxí;

Y significa un radical Y1, Y2, Y3, Y6, Y7, Y8 o Y9.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en los que

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
 2020

Doctor(a)
 OLARTE GARCIA CARLOS REINALDO

REFERENCIA	Radicación No.	6 89830
	Solicitud internacional	EP2005/002049
	Fecha inicio fase nacional	10/10/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio No.	11713

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. Si fuere el caso, el solicitante debe adjuntar la traducción de los anexos del reporte de examen preliminar internacional (Art. 36.2.b) del tratado PCT.
2. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.
3. La solicitud no contiene el poder debidamente otorgado, con el lleno de los requisitos exigidos por los artículos 63 y subsiguientes del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el documento que acredita la existencia y representación legal de la sociedad solicitante, cuando ésta fuere persona jurídica.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos 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 al presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
 Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior, requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 19 OCT. 2006
 adpall