



Asesoramiento ABN 161
de propiedad industrial

OK
PBF
QJ

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

07-56776

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO DERIVADOS DE PIRIDO-PIRAZINA UTILES COMO COMPUESTOS HERBICIDAS.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C07D 471/04

71. SOLICITANTE SYNGENTA LIMITED

DOMICILIO GUILDFORD, SURREY, REINO UNIDO DE LA GRAN BRETAÑA.

74. APODERADO DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

22. BOGOTÁ, D. C.,



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep: 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139

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

1

SOLICITUD DE:

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: **Syngenta Limited**

Dirección: Priestley Road, Surrey Research
Park, Guildford, Surrey GU2 7YH, Reino Unido
de la Gran Bretaña.

Nacionalidad o Domicilio: Guildford, Surrey,
Reino Unido de la Gran Bretaña

Lugar de Constitución : Reino Unido de la
Gran Bretaña.

Teléfono:

Fax:

E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO
(74)**

Nombre: **DILIA MARIA RODRIGUEZ
D'ALEMAN**

Dirección: Cra. 11 No. 86-53 piso 6

Teléfono: 6 162051/61 Fax: 6 161889

E-mail: clarkemodet@clarkemodet.com.co

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número 41.654.882 T.P. 20824
CSJ

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

Nombre: **VER ANEXOS**

Dirección:

Nacionalidad o domicilio:

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/GB2007/004662 Fecha 6 de diciembre de 2007

Publicación Internacional No. WO 2008/071918 A1 Fecha 19 de junio de 2008

6 **TÍTULO (54)** DERIVADOS DE PIRIDO-PIRAZINA ÚTILES COMO COMPUESTOS
HERBICIDAS.

7 **Clasificación Internacional (51)**

C07D 471/04

8 Prioridad

SI

☒

NO

☐

(33) País de Origen
GRAN BRETAÑA

(32) Fecha

12 de diciembre de 2006

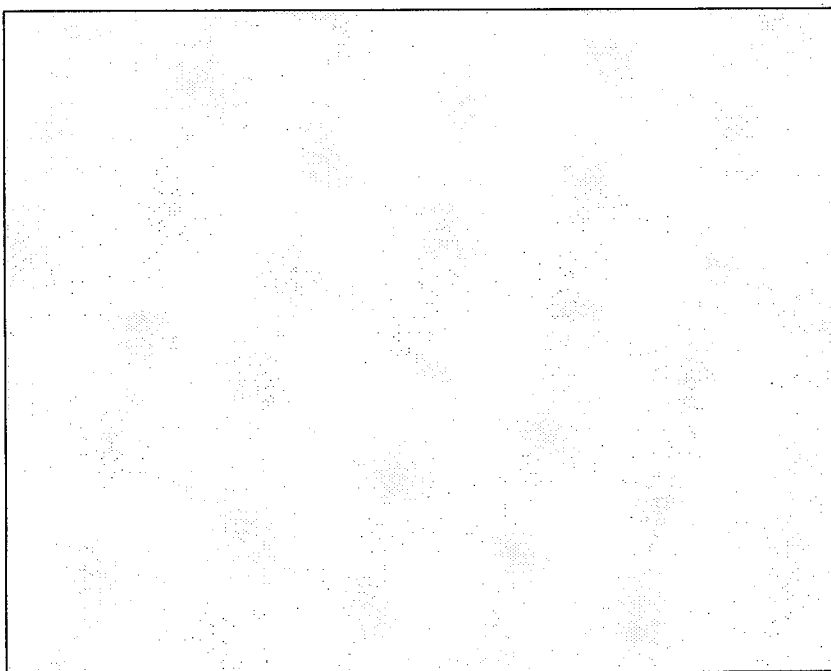
(31) Número de Solicitud

0624760.5

9 **Comprobante de pago No.** 09-30.661 // 09-30.709 // 09-25.225 // 09-25.309 // 9-8.780 // 09-34.867

Fecha 23/04/09 // 23/04/09 // 31/03/09 // 31/03/09 // 03/02/09 // 12/05/09

- ☒ 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 de 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 deposito 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 * Opinión escrita.

11 FIGURA CARACTERÍSTICA**12 Solicito la concesión de la patente****NOMBRE : DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D'ALEMAN****FIRMA:****C.C. 41.654.882****T.P. 20824****P-2204**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 30,661
FECHA : ABRIL 23 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139

**** CONSIGNACION ****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CLARKE MODEY Y CO. COLOMB	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	111781530	23/04/2009	69,685,000.00

**** CONCEPTO ****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-04	PRESENTACION DE OBSERVACIONES	
12		MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	287,000.00
		TOTAL :	\$ 287,000.00

SON: DOSCIENTOS OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

P-2204
2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08
Tra. 11 PATENTE I/II
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 139

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 30,709
FECHA : ABRIL 23 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CLARKE MODEY Y CD. COLOMB	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	111781530	23/04/2009	69,685,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	200,000.00
		TOTAL :	\$ 200,000.00

SON: DOSCIENTOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
PARA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
USADO PARA OTRO FIN SIN UN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 25,225
FECHA : MARZO 31 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CLARKE MODEY Y CO. COLOMB	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	111723194	31/03/2009	80,435,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	50,000.00
		TOTAL :	\$ 50,000.00

SOM: CINCUENTA MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 25,309

FECHA : MARZO 31 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CLARKE MODEY Y CO. COLOMB	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	111723194	31/03/2009	80,435,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	2,000.00
		TOTAL :	\$ 2,000.00

SON: DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

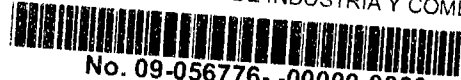
ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

5

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 9 - 8,780
FECHA : FEBRERO 3 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE I Y II Eve: 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ARKE MODET Y CO. COLOMB	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	108004750	02/02/2009	31,570,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	DTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		32 CARATULAS DE PATENTE	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL ASUNTO No.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Evs: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 34,867
FECHA : MAYO 12 DE 2009

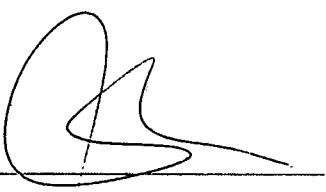
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CLARKE MODEY Y CO. COLOMB	DEVOLUCION TASA			831	12/05/2009	75,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO	
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	75,000.00
TOTAL :				\$ 75,000.00

SON: SETENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

P-2204
7

ANEXOS

INVENTORES

1.)

CARTER, Neil, Brian

(Syngenta Limited, Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY, Gran Bretaña);

2.)

CORDINGLEY, Matthew, Robert

(Syngenta Limited, Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY, Gran Bretaña);

3.)

CROWLEY, Patrick, Jeff (Va folio 140. Jelf)

(Syngenta Limited, Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY, Gran Bretaña);

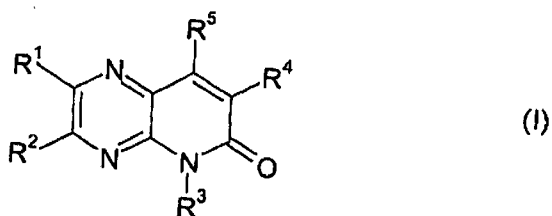
4.)

TURNBULL, Michael, Drysdale

(Syngenta Limited, Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY, Gran Bretaña).

RESUMEN

Título: Derivados de pirido-pirazina útiles como compuestos herbicidas



La presente invención hace referencia a compuestos de la fórmula (I): en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se definen en la reivindicación 1; o una sal o N-óxido del mismo. Adicionalmente, la presente invención se refiere a procesos para la preparación de compuestos de la fórmula (I), a métodos para el control de plantas y composiciones que comprenden los compuestos de la fórmula (I).

DERIVADOS DE PIRIDO-PIRAZINA ÚTILES COMO COMPUESTOS

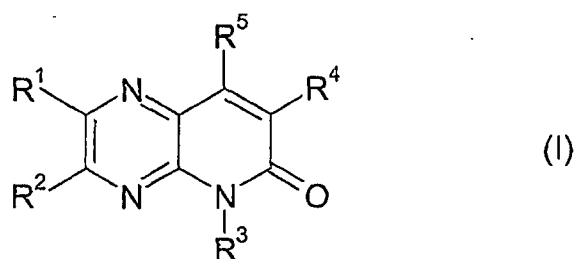
HERBICIDAS

La presente invención se refiere a novedosos, herbicidas 5-haloalquil-5*H*-pirido [2,3-*b*] pirazin-6-onas y 5-haloalquenil-5*H*-pirido [2,3-*b*] pirazin-6-onas, para los procesos para su preparación, a composiciones que comprenden estos compuestos, y para su utilización en el control de las plantas o en la inhibición de crecimiento de la planta.

Las pirido [2,3-*b*] pirazinas se dieron a conocer como productos intermedios en la síntesis de compuestos de fungicida, por ejemplo, en WO 04/056825, WO 05/123698 y WO 05/123733. Las pirido [2,3-*b*] pirazinas se dieron a conocer como fungicida compuestos en WO 05/010000.

Ahora ha sido encontrado sorprendentemente que algunos 5-haloalquil-5*H*-pirido [2,3-*b*] pirazin-6-onas y los 5-haloalquenil-5*H*-pirido [2,3-*b*] pirazin-6-onas demuestran unas propiedades excelentes de herbicidas y excelentes propiedades de inhibición del crecimiento.

La presente invención proporciona un compuesto de fórmula (I)



donde

R1 y R2 son independientemente hidrógeno, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, halo, ciano, hidroxí, C1-C4alcoxi, C1-C4alquiltio, arilo o arilo sustituido por uno a cinco R6, que puede ser el mismo o diferente, o heteroaril o heteroaril

sustituido por uno a cinco R6, que pueden ser iguales o diferentes; R3 es C1-C4haloalquil, C2-C4haloalquenil o C2-C4haloalquinil; R4 es arilo o arilo sustituido por uno a cinco R8, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroaril o heteroaril sustituido por uno a cuatro R8, que pueden ser iguales o diferentes;

R5 es hidroxil o un grupo que puede ser metabolizado al grupo hidroxil;

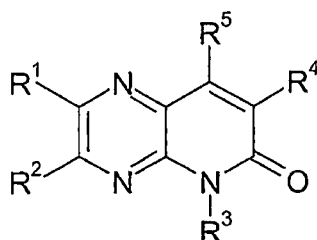
cada R6 y R8 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1-C4haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, hidroxil, C1-C10alcoxi, C1-C4haloalcoxi, C1-C10alcoxi-C1-C4alquil, C3-C7cicloalquil, C3-C7cicloalcoxi, C3-C7cicloalquil-C1-C4alquil, C3-C7cicloalquil-C1-C4alcoxi, C1-C6alquilcarbonil, formil, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4alquilcarboniloxi, C1-C10alquiltio, C1-C4haloalquiltio, C1-C10alquilsulfinil, C1-C4haloalquilsulfimil-, C1-C10alquilsulfonyl-, C1-C4haloalquilsulfonyl-, amino, C1-C10alquilamino-, di-C1-C10alquilamino-, C1-C10alquilcarbonilamino-, arilo o arilo sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril o heteroaril sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, aril-C1-C4alquil o aril-C1-C4alquil-donde la fracción arilo es sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril-C1-C4alquil - o heteroaril-C1-C4alquil donde la fracción heteroaril es sustituida por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, ariloxi-o ariloxi sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, heteroariloxi o heteroariloxi - sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, ariltio- o ariltio-sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroariltio o heteroariltio-sustituido por uno a tres R13, que puede ser el mismo o diferentes;

y

cada R13 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi, o una sal o *N*-óxido

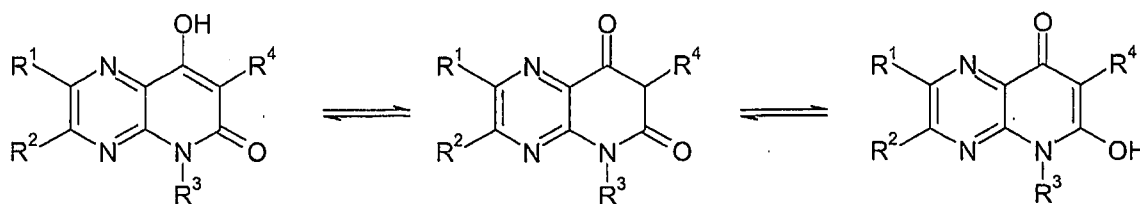
Los compuestos de fórmula (I) pueden existir en diferentes formas geométricas o isómeros ópticos o formas tautomericas. Esta invención se refiere a todos los isómeros y tautómeros y mezclas de los mismos en todas las proporciones así como formas isotópicas, tal como la forma de compuestos de deuterio.

Por ejemplo, un compuesto de fórmula (Ia), es decir, un compuesto de fórmula (I) donde R5 es una definición a los compuestos de fórmula (I), excepto hidroxí, que se pueden extraer en una sola forma tautomerica.



(Ia)

Considerando que un compuesto de fórmula (Ib), es decir, un compuesto de fórmula (I) donde R5 es hidroxí, se pueden sacar en tres formas tautomericas.



(Ib)

Cada fracción alquil (ya sea solo o como parte de un grupo más amplio, tal como alcoxi, alcoxycarbonil, alquilcarbonil, alquilaminocarbonil, dialquilaminocarbonil) es una cadena recta o ramificada y es, por ejemplo,

metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentil, *n*-hexilo, *iso*-propilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, *iso*-butilo, *tert*-butilo o *neo*-pentil. Los grupos alquilo son preferentemente grupos C1-C6 alquilo, más preferiblemente C1-C4 y más preferentemente grupos C1-C3alquilo grupos.

Las fracciones alquenil y alquinil (ya sea solo o como parte de un grupo más amplio, como alqueniloxi o alquiniloxi) puede ser en forma de cadenas rectas o ramificadas, y las fracciones alquenil, en su caso, puede ser de cualquiera de las dos configuraciones (E)- o (Z)-. Ejemplos de ello son vinilo, alilo, prop-2-enil y propargil. Los grupos alquenil y alquinil son de preferencia C2-C6alquenil o grupos alquinil, más preferiblemente C2-C4 y más preferiblemente C2-C3alquenil o grupos alquinil

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquil (ya sea solo o como parte de un grupo más amplio, como haloalcoxi o haloalquiltio) son los grupos alquil los cuales son sustituidos con uno o más de los mismos o diferentes átomos halógenos, y son, por ejemplo, -CF₃, -CF₂Cl, -CHF₂, -o CH₂CF₃-CH₂CHF₂. Los grupos haloalquenil y haloalquinil (ya sea solo o como parte de un grupo más amplio, como haloalqueniloxi o haloalquiniloxi) son grupos alquenil y alquinil, respectivamente, que son sustituidos por uno o más de los mismos o diferentes átomos halógenos, y son, por ejemplo, -CH=CF₂, -CC₁=CC₁F o -C=CC₁.

Los grupos cicloalquilo pueden ser de forma mono o bi-cíclica pueden ser opcional sustituidos por uno o más grupos metilo. Los grupos cicloalquilo contienen preferentemente de 3 a 8 átomos de carbono, más preferentemente de 3 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de grupos monocíclico cicloalquilo son ciclopropil, 1-metilciclopropil, 2-metilciclopropil, ciclobutil, ciclopentil y ciclohexil.

En el contexto de la presente especificación, el término "arilo" se refiere a un sistema de anillos que pueden ser mono-, bi- o tricíclico. Ejemplos de este tipo de anillos son fenil, naftalenil, antracenil, indenil o fenantrenil. Un grupo arilo preferido es fenilo.

El término "heteroaril" se refiere a un sistema de anillos aromáticos que contengan al menos un heteroatom y que consiste bien de un solo anillo o de dos o más anillos fundidos. Preferentemente, los anillos sencillos contendrán hasta tres sistemas y bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que preferiblemente se elegirán de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplo de tales grupos son piridil, piridazinil, pirimidinil, pirazinil, triazinil, furanil, tiofenil, oxazolil, isoxazolil, oxadiazolil, tiazolil, isotiazolil, tiadiazolil, pirrolil, pirazolil, imidazolil, triazolil y tetrazolil. Un grupo es preferido de heteroaril es piridina. Ejemplos de grupos benzotiofenil tricíclicos son, benzimidazolil, benzotiadiazolil, quinolinil, cinnolinil, quinoxalinil y pirazolo [1,5-a]pirimidinil.

El término "heterociclil" se define para incluir heteroaril y, además, sus análogos no saturados o parcialmente saturados, tales como 4,5,6,7-tetrahidro-benzotiofenil, chromen-4-onil, 9H-fluorenil, 3,4-dihidro-2H -benzo-1,4-dioxepinil, 2,3-dihidro-benzofuranil, piperidinil, 1,3-dioxolanil, 1,3-dioxanil, 4,5-dihidro-isoxazolil, tetrahidrofuranil y morfolinil.

El término "herbicida", tal como se utiliza en este documento significa un compuesto que controla o modifica el crecimiento de las plantas. El término "cantidad efectiva herbicidamente" se entiende como la cantidad de dicho compuesto o combinación de dichos compuestos que es capaz de producir un control o modificación de efecto en el crecimiento de las plantas. Controlar o modificar los efectos de desviación incluye todos las desviaciones naturales de

desarrollo natural, por ejemplo: la muerte, el retraso, la quemaduras de hojas, albinismo, enanismo y similares. El término "plantas" se refiere a todas las partes físicas de una planta, incluidas las semillas, plántulas, árboles jóvenes, raíces, tubérculos, tallos, tallos, follaje y frutos. El término "lugar" es la intención de incluir la tierra, semillas y plántulas, así como la vegetación establecida. El término "metabolismo", tal como se utiliza aquí significa la conversión o la distribución de una sustancia de una forma a otra por un organismo vivo, en particular en una planta (*in planta*).

Los valores preferidos de R1, R2, R3, R4, R5, R6, R8, R9, R10, R11, R12, R13 y R14 son, en cualquier combinación, como se indica a continuación.

Preferentemente R1 es hidrógeno, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, halo, ciano, hidroxilo o C1-C4alcoxi.

Más preferentemente R1 es hidrógeno, C1-C4alquil, halo, ciano o hidroxilo.

Aún más preferentemente R1 es hidrógeno, metilo, cloro o bromo.

Sin embargo, aún más preferiblemente R1 es hidrógeno o cloro.

Más preferentemente R1 es hidrógeno.

Preferentemente R2 es hidrógeno, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, halo, ciano, hidroxilo o C1-C4alcoxi.

Más preferentemente R2 es hidrógeno, C1-C4alquil, halo, ciano o hidroxilo.

Aún más preferentemente R2 es hidrógeno, metilo, cloro o bromo.

Sin embargo, aún más preferiblemente R2 es hidrógeno o cloro.

Más preferiblemente R2 es hidrogeno.

Preferentemente R3 es C1-C4haloalquil o C2-C4haloalquenil. Ejemplos de tales grupos preferidos para R3 son fluor-2-etil, 2,2-difluor-etilo, 2,2,2-trifluor-etil, 3-cloro-propil, 3,3,3-trifluor-propilo, 4-cloro-butilo, 4,4,4,3,3-pentafluor-butilo, 2-cloro-prop-2-en-1-il, 3,3-dicloro-prop-2-en-1-il, 2-fluor-prop-2-en-1-il, 3,3-difluoro-prop-2-en-1-il, 4,4-difluor-pero-3-en-1-il y el 3,4,4-trifluor-pero-3-en-1-il.

Más preferentemente R3 es C1-C3haloalquil, en particular cuando los átomos halógenos son fluorina. Ejemplos de tales grupos preferidos para R3 son fluor-2-etil, 2,2-Difluor-etilo, 2,2,2-trifluor-etil y 3,3,3-trifluor-propil.

Aún más preferentemente R3 es C1-C2haloalquil, en particular donde los átomos halógenos son fluorina. Ejemplos de este grupo más preferido de R3 son fluor-2-etil, 2,2-difluor-etil y 2,2,2-trifluor-etilo.

Más preferentemente R3 es 2,2-difluor-etilo.

Preferentemente R4 es arilo o arilo sustituido por uno a cinco R8, que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de tales grupos preferidos para R4 son 2,5-bis-(trifluormetil) - fenil, 3-bromo-2-cloro-6-fluor-fenil, 2-bromo-4-fluor-fenil, 5-bromo-2 - metoxi-fenil, 2-bromo-fenil, 2-bromo-4-trifluormetil-fenil, 2-cloro-3, 6 - Difluor-5-nitro-fenil, 2-cloro-3 ,6-difluor-fenil, 2 -- cloro-4 ,5-difluor-fenil, 2 - cloro-6-fluor-3-metil-fenil, 2-cloro-6-fluor-5-metil-fenil, 2-cloro-6-fluor-3-nitro - fenilo, 2-cloro-4-fluor-fenilo, 2-cloro-5-fluor-fenilo, 2-cloro-6-fluor-fenil, 2-cloro-fenil, 3-cloro-fenilo, 4-cloro-fenilo, 2-cloro-3-trifluormetil-fenil, 2-cloro-5-trifluormetil-fenil, 5-cloro-2-trifluormetil-fenil, 2-cloro-6-trifluormetil-fenil, 2,3-dicloro-6-fluor - fenilo, 2,4-dicloro-5-fluor-fenilo, 3,5-dicloro-2-metoxi-fenilo, 2,3-dicloro-fenilo, 2,4-dicloro-fenilo, 2,5-dicloro-fenilo, 2,6-dicloro-fenilo, 3,4-dicloro-fenilo, 2,6-dicloro-4-fenil-trifluormetoxi, 2,6-dicloro-4-trifluormetil-fenil-, 2,6-dietil-

4-metil-fenilo, 2-difluormetoxi-fenilo, 4,5-difluoro-2-metoxi-fenil, 2,3-dimetoxi-fenil, 2,4 - dimetoxi-fenil, 2,5-dimetil-fenil, 2-etil-fenil, 2-fluor-fenilo, 4-fluor-2-trifluormetil-fenil, 6-fluor-2-trifluormetil-fenil, 2-iodo-fenilo, 2-metoxi-fenil, 2-metoxi-5-fenil-trifluormetoxi, 6-metil-2-nitro-fenil, 2-metil-fenil, naft-2-il, naft-3-il, fenilo, 2-nitro-4-trifluormetil-fenil, 2,3,5-tricloro-fenil, 2, 3,6-tricloro-fenilo, 2-fenil-trifluormetoxi, 2-trifluormetil-fenil, 2,3,6-trifluor-fenilo y 2,4,6-trimetil-fenil.

Más preferentemente R4 es arilo sustituido por uno a cuatro R8, que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de tales grupos más preferido para R4 son 2,5-bis-(trifluormetil)-fenilo, 3-bromo-2-cloro-6-fluor-fenil, 2-cloro-3 ,6-difluoro-fenilo, 2-cloro-4-fluor-fenilo, 2-cloro-5-fluor-fenil, 2-cloro-fenil, 2-cloro-3-trifluormetil-fenil, 2-cloro-5-trifluormetil-fenil, 2-cloro-6-trifluormetil-fenil, 2,3 - dicloro-6-fluor-fenil, 2,4-dicloro-5-fluor-fenil, 3 ,5-dicloro-2-metoxi-fenil, 2,3-dicloro-fenilo, 2,4-dicloro-fenilo, 2,5-dicloro-fenilo, 2,6-dicloro-fenilo, 2,6-dicloro-4-trifluormetoxi-fenil, 2,6-dicloro-4-trifluormetil-fenil-, 2,6-dietil-4-metil-fenil, 2,3-dimetoxi-fenil, 2-fluor-fenil , 2-metoxi-fenil, 2-metoxi-5-trifluorometoxi-fenil, 2,3,6-tricloro-fenilo, 2-trifluormetoxi-fenil, 2-trifluormetil-fenil y 2,4,6-trimetil-fenil.

Más preferentemente R4 es arilo sustituido por dos a tres R8, que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de tales grupos más preferidos para R4 son 2,5-bis-(trifluormetil)-fenil, 3-bromo-2-cloro-6-fluor-fenil, 2-cloro-3 ,6-difluoro-fenil, 2-cloro-5-fluoro-fenilo, 2-cloro-5-trifluormetil-fenil, 2-cloro-6-trifluormetil-fenil, 2,3-dicloro-6-fluoro-fenilo, 2,6-dicloro-fenil, 2,6 -dicloro-4-trifluormetoxi-fenil y 2,3,6-tricloro-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2,5-bis-(trifluormetil)-fenil.

En una configuración preferida R4 es 3-bromo-cloro-fluoro-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2-cloro-3,6-difluoro-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2-cloro-5-fluoro-fenil.

En una configuración preferido R4 es 2-cloro-5-trifluormetil-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2-cloro-6-trifluormetil-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2,3-dicloro-6-fluor-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2,6-dicloro-fenil.

En una configuración preferida R4 es 2,6-dicloro-4-trifluormetoxi-fenil.

En una configuración preferido R4 es 2,3,6-tricloro-fenil.

Preferentemente R5 es hidroxi, R9-oxi-, R10-carboniloxi-, tri-R11-sililoxi- o R12-sulfoniloxi-, donde

R9 es C1-C10alquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil o aril-C1-C4alquil- o-aril-C1-C4alquil donde la fracción arilo es sustituida por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi;

R10 es C1-C10alquil, C3-C10cicloalquil, C3-C10cicloalquil-C1-C10alquil-, C1-C10haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, C1-C4alcoxi-C1-C10alquil-, C1-C4alquiltio-C1-C4alquil-, C1-C10alcoxi, C1-C10alqueniloxi, C2-C10alquiniloxi, C1-C10alquiltio-, *N*-C1-C4alquil-amino-, *N,N*-di-(C1-C4alquil)-amino-, arilo o arilo sustituido por uno a tres R14, que pueden ser la misma o diferentes, heteroaril o heteroaril sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, aril-C1-C4alquil o aril-C1-C4alquil- donde la fracción arilo es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril-C1-C4alquil o heteroaril-C1-C4alquil- donde la fracción de heteroaril es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariloxi-o-ariloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroariloxi-o-heteroariloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser

iguales o diferentes, ariltio-o-ariltio sustituido por una a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroariltio - o-heteroariltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes;

cada R11 es independientemente C1-C10alquil o fenilo o fenilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi; R12 es C1-C10alquil, C1-C10haloalquil, o fenilo o fenilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi; y

cada R14 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C10oalquil, C1-C4haloalquil, C1-C10alkoxi, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4haloalcoxi, C1-C10alquiltio-, C1-C4haloalquiltio-, C1-C10alquilsulfinil-, C1-C10haloalquilsulfinil-, C1-C4alquilsulfonyl-, C1-C4haloalquilsulfonyl-, arilo o arilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C5haloalquil o C1-C6alcoxi, o heteroaril o heteroaril sustituido por uno a cuatro sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi.

Más preferiblemente R5 es hidroxil, R9-oxi- o R10-carboniloxi-.

Aún más preferentemente R5 es hidroxil, C1-C4alkoxi, C1-C4alquilcarboniloxi-, C3-C6cicloalquilcarboniloxi-, C3-C10cicloalquil-C1-C10alquilcarboniloxi-, C1-C4haloalquil-carboniloxi-, C2-C4alquenilcarboniloxi-, C2-C4alquinilcarboniloxi-, C1-C4alcoxi-C1-C4alquilcarboniloxi-, C1-C4alquiltio-C1-C4alquilcarboniloxi-, C1-C4alcoxycarboniloxi-, C2-C4alqueniloxycarboniloxi-, C2-C4alquiniloxycarboniloxi-, C1-C4alquiltiocarbonil-oxi-, N-C1-C4alquilaminocarboniloxi-, N,N-di-(C1-C4alquil)-aminocarboniloxi-, aril - carboniloxi-o-

arilcarboniloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroarilcarboniloxi-o-heteroarilcarboniloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, aril-C1-C4alquilcarboniloxi-o aril-C1-C4alquilcarboniloxi donde la fracción arilo es sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril-C1-C4alquilcarboniloxi o heteroaril-C1-C4alquilcarboniloxi- donde la fracción de heteroaril es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariloxicarboniloxi-o-ariloxicarboniloxi sustituido por una a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroariloxicarboniloxi-o-heteroariloxicarboniloxi sustituido por un a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariltiocarboniloxi-o-ariltiocarboniloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroariltio-carboniloxi-o-heteroariltio-carboniloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser la misma o diferentes. Ejemplos de grupos preferidos para R5 son hidroxil, metoxil, etoxil, metilcarboniloxil-, etilcarboniloxil-, *iso*-propilcarboniloxil-, *n*-propil-carboniloxil-, but-2-ilcarboniloxil-, 2-metil-propilcarboniloxil-, *tert*-butilcarbonil-oxil-, ciclopropilcarboniloxil-, ciclopentil-metilcarboniloxil-, clorometilcarbonil-oxil-, trifluormetilcarboniloxil, alilcarboniloxil-, (E)-prop-1-en-1-ilcarboniloxil-, 2-metil-prop-1-en-1-ilcarboniloxil-, metoximetilcarboniloxil-, etoxicarboniloxil-, *tert*-butoxicarboniloxil-, but-2-in-1-iloxicarboniloxil-, etiltiocarboniloxil-, *N,N*-dietilaminocarboniloxil-, fenilcarboniloxil-, 3-metoxi-fenilcarboniloxil-, 4-nitro-fenilcarboniloxil-, benzilcarboniloxil-, furano-2-ilcarboniloxil-, 2,5-dimetil-furano-3-ilcarboniloxil-, tiofen-2-ilcarboniloxil-, 3,5-dimetil-isoxazol-4- ilcarbonil-oxil-, y 1-fenil-prop-1-ilcarboniloxil-.

Sin embargo, aún más preferiblemente R5 es hidroxil, C1-C4alquilcarboniloxil-, C3-C6ciclo-alquilcarboniloxil-, C2-C4alquenilcarboniloxil-,

C2-C4alquinilcarboniloxi-, C1-C4alcoxi-carboniloxi-, C2-C4alqueniloxicarboniloxi-, C2-C4alquiniloxicarboniloxi o C1-C4alquiltiocarboniloxi -. Ejemplos de los grupos más preferido para R5 son hidroxil-, metilcarboniloxi-, etilcarboniloxi-, *iso*-propilcarboniloxi-, *n*-propilcarboniloxi-, but-2-ilcarboniloxi-, 2-metil-propilcarboniloxi-, *tert*-butilcarboniloxi-, ciclo-propilcarboniloxi, alilcarboniloxi-, (E)-prop-1-en-1-ilcarboniloxi-, 2-metil-prop-1-en-1-ilcarboniloxi-, etoxicarboniloxi-, *tert*-butoxicarboniloxi-, but-2-in-1- iloxi-carboniloxi-, y etiltiocarboniloxi-.

Mas preferentemente R5 es hidroxil-, C1-C4alquilcarboniloxi-, C1-C4alcoxycarbonil-oxi- o C1-C4alquiltiocarboniloxi. Ejemplos de la mayoría de los grupos preferidos para R5 son hidroxil-, metilcarboniloxi-, etilcarboniloxi-, *iso*-propilcarboniloxi-, *n*-propilo-carboniloxi-, but-2-ilcarboniloxi-, 2-metil-propilcarboniloxi-, *tert*-butilcarbonil-oxi-, etoxicarboniloxi-, *tert*-butoxicarboniloxi-, y etiltiocarboniloxi-.

En una configuración preferido R5 es hidroxil-.

En una configuración R5 es R9-oxi-, en el que R9 es C1-C10alquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil o aril-C1-C4alquil-o aril-C1-C4alquil-donde la fracción arilo es sustituida por uno a cinco sustituyentes seleccionaron de forma independiente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi. Dichos grupos de R5 pueden ser metabolizados, de preferencia *in planta*, para dar el correspondiente compuesto donde R5 es hidroxil-.

En una configuración preferida R5 es R10-carboniloxi, donde R10 es C1-C10alquil, C2-C10cicloalquil, C3-C10cicloalquil-C1-C10alquil-, C1-C10haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, C1-C4alcoxi-C1-C10alquil -, C1-C4alquiltio-C1-C4alquil-, C1-C10alkoxi, C2-C10alqueniloxi, C2-

C10alquiniloxi, C1-C10alquiltio-, N-C1-C4alquil-amino-, N,N-di-(C1 -C4alquil)-amino-, arilo o arilo sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril o heteroaril sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, aril-C1-C4alquil o aril-C1-C4alquil donde la fracción arilo es sustituida por una a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril-C1-C4alquil-o heteroaril-C1-C4alquil- donde la fracción de heteroaril es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariloxi-o-ariloxi sustituido por una a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroariloxi-o-heteroariloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariltio-o-ariltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroariltio-o-heteroariltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes; y cada R14 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1 -C4haloalquil, C1-C10alcoxi, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4aloalcoxi, C1-C4alquiltio-, C1-C4haloalquiltio-, C1-C10alquilsulfinil-, C1-C4haloalquilsulfmil-, C1-C10alquilsulfonyl-, C1-C4haloalquilsulfonyl-, arilo o arilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados de forma independiente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi, o heteroaril o heteroaril sustituido por uno a cuatro sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, o C1-C6haloalquil C1-C6alcoxi. Dichos grupos R5 pueden ser metabolizados, de preferencia *in planta*, para dar el correspondiente compuesto donde R5 es hidroxil.

En una configuración preferida R5 es *iso*-propilcarboniloxi- o *tert*-butilcarboniloxi-.

En una configuración preferida R5 es C1-C4alquilsulfoniloxi. Ejemplos de tales grupos preferido para R5 son metilsulfoniloxi e *iso*-propilsulfoniloxi.

En una configuración preferida R5 es tri-(C1-C4alquil)-sililoxi-. Un ejemplo de un grupo preferido para R5 es dimetil-*tert*-butil-sililoxi-.

De preferencia cada R6 es independiente halo, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, C1-C4alcoxi o C1-C4haloalcoxi. Ejemplos de tales grupos preferidos para R6 son cloro, fluor, metilo, etilo, trifluormetil, metoxi o trifluormetoxi.

De preferencia cada R8 es independiente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1-C4haloalquil-, C1-C10alkoxi, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4haloalkoxi, C1-C10alquiltio-, C1-C4haloalquiltio-, C1-C10alquilsulfmil-, C1-C4haloalquilsulfinil-, C1-C10alquilsulfonil- o C1-C4haloalquilsulfonil.

Más de preferencia cada R8 es independiente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1-C4haloalquil, C1-C10alkoxi, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4haloalkoxi, C1-C10alquiltio o C1-C4haloalquiltio. Ejemplos de tales grupos preferidos para R8 son iodo, bromo, cloro, fluor, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluormetil, metoxi, metoxycarbonil, trifluormetoxi o trifluormetiltio.

Más de preferencia cada R8 es independientemente halo, C1-C10aquil, C1-C4haloalquil, C1-C10alcoxi o C1-C4haloalcoxi. Ejemplos de dichos grupos preferidos para R8 son bromo, cloro, fluor, metilo, etilo, trifluormetil, metoxi o trifluormetoxi.

En una configuración, R9 es preferentemente C1-C10alquil, más preferiblemente C1-C4alquil, aún más preferiblemente metilo o etilo, más preferiblemente metilo.

En otra configuración, R9 es preferentemente C2-C10alquenil, C2-C20alquinil, aril-C1-C4alquil o aril-C1-C4alquil- donde la fracción arilo es sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, más de preferencia C3-C4alquenil, o C3-C4alquinil, bencil o bencil donde la fracción de fenilo es sustituida por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, aún más preferiblemente alilo, propargil o bencílico, con mayor preferencia R9 es alilo.

Preferentemente R10 es C1-C10alquil, C3-C10cicloalquil, C1-C10haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, C1-C4alcoxi-C1-C10alquil-, C1-C4alquiltio-C1-C4alquil-, C1-C10alkoxi, C1-C10alquiltio-, *N*-C1-C4alquil-amino-, *N*, *N*-di-(C1-C4alquil)-amino-, fenilo o fenilo sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, bencil o bencil donde la fracción de fenilo es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, tienil o tienil sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, piridil o piridil sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, fenoxi o fenoxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, o feniltio o feniltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes.

Con mayoría de preferencia R10 es *iso*-propil o *tert*-butilo.

Preferentemente cada R11 es independiente C1-C4alquil.

Preferentemente R12 es C1-C4alquil o C1-C4-haloalquil.

Preferentemente cada R13 es independientemente halo, nitro, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil o C1-C4alcoxi. Ejemplos de tales grupos preferidos son cloro, fluor, nitro, metilo, etilo, metoxi y trifluormetil.

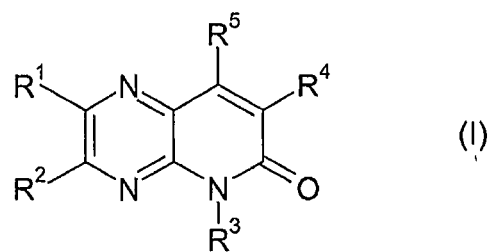
Preferentemente cada R14 es independientemente halo, nitro, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil-, C1-C4alcoxi o C1-C4haloalcoxi. Ejemplos de tales grupos preferidos son cloro, fluor, nitro, metilo, etilo, trifluormetil, metoxi y trifluormetoxi.

Más preferentemente cada R14 es independientemente halo, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil o C1-C4alcoxi.

Los compuestos en los tablas 1 al 27 que aparecen a continuación ilustran los compuestos de la invención.

Tabla 1:

La tabla 1 presenta 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2-cloro-3 ,6-difluoro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.



Numero de compuesto	R3	R5
1.001	2,2-difluoro-etil	-OH
1.002	2,2-difluoro-etil	-OCH ₃
1.003	2,2-difluoro-etil	-OCOCH ₃
1.004	2,2-difluoro-etil	-OCOCH ₂ CH ₃
1.005	2,2-difluoro-etil	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.006	2,2-difluoro-etil	-OCOC(CH ₃) ₃
1.007	2,2-difluoro-etil	-OCO-ciclo-CH ₃ H ₃
1.008	2,2-difluoro-etil	-OCO-C ₆ H ₅
Numero de compuesto	R3	R5

1.009	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ Cl
1.010	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ Cl
1.011	2,2-difluoro -etil	-OCOCF ₃
1.012	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.013	2,2-difluoro -etil	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.014	2,2-difluoro -etil	-O(CO)O H ₂ CH ₃
1.015	2,2-difluoro -etil	-O(CO)SC H ₂ CH ₃
1.016	2,2-difluoro -etil	-OH
Numero de compuesto	R3	R5
1.017	2,2-difluoro -etil	-OCH ₃
1.018	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₃
1.019	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ CH ₃

1.020	2,2-difluoro -etil	-OCOCH(C H ₃) ₂
1.021	2,2-difluoro -etil	-OCOC(C H ₃) ₃
1.022	2,2-difluoro -etil	-OCO- ciclo-C ₃ H ₅
1.023	2,2-difluoro -etil	-OCO- C ₆ H ₅
1.024	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
Numero de compuesto	R3	R5
1.025	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ Cl
1.026	2,2-difluoro -etil	-OCOCF ₃
1.027	2,2-difluoro -etil	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.028	2,2-difluoro -etil	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.029	2,2-difluoro -etil	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.030	2,2-difluoro -etil	-O(CO)SC H ₂ CH ₃

Tabla 2:

La tabla 2 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2-cloro-4-fluoro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 3:

La tabla 3 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2-cloro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 4:

La tabla 4 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 3,5-dicloro-2-metoxi-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 5:

La tabla 5 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,3-dicloro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 6:

La tabla 6 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,4-dicloro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 7:

La tabla 7 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,5-dicloro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 8:

La tabla 8 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,6-dicloro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 9:

La tabla 9 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,6-dicloro-4-trifluormetil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 10:

La tabla 10 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,6-dietil-4-metil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 11:

La tabla 11 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son ambos hidrógeno, R es 2-fluor-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 12:

La tabla proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es de 2-metoxi-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 13:

La tabla 13 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son ambos hidrógeno, R es 2-trifluorometil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 14:

La tabla 14 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es trifluormetil-2-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 15:

La tabla 15 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es de 3-bromo-2-cloro-6-fluor-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 16:

La tabla 16 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,3-dicloro-6-fluor-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 17:

La tabla 17 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,6-dicloro-4-fenil-trifluormetoxi y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 18:

La tabla 18 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son ambos hidrógeno, R es 2-cloro-6-trifluormetil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 19:

La tabla 19 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2-cloro-5-trifluormetil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 20:

La tabla 20 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2-cloro-5-fluor-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 21:

La tabla 21 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,4-dicloro-5-fluor-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 22:

La tabla 22 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es de 2-metoxi-5-trifluormetoxi-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 23:

La tabla 23 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,3-dimetoxi-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 24:

La tabla 24 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2-cloro-3-trifluormetil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 25:

La tabla 25 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,4,6-trimetil-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Tabla 26:

La tabla 26, 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,5-bis-(trifluormetil)-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

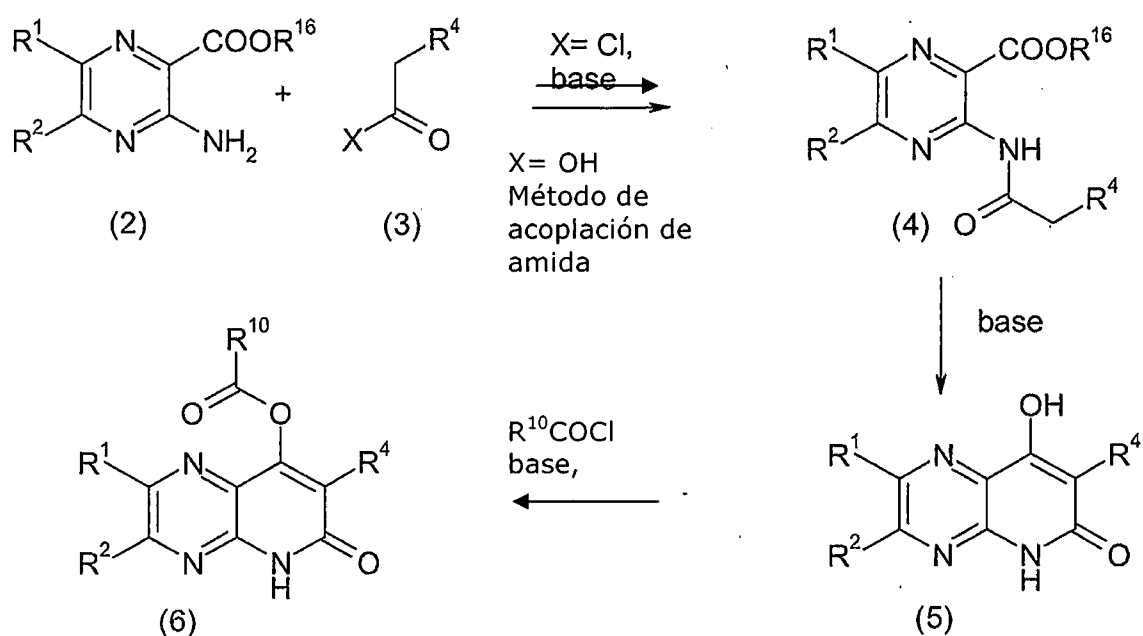
Tabla 27:

La tabla 27 proporciona 30 compuestos de fórmula (I), donde R1 y R2 son hidrógeno, R4 es 2,3,6-tricloro-fenil y R3 y R5 tienen los valores que figuran en la tabla 1.

Los compuestos de la invención pueden ser producidos por una variedad de métodos, por ejemplo, los métodos descritos en los Esquemas de 1 a 14.

Esquema 1

X=Cl,
base



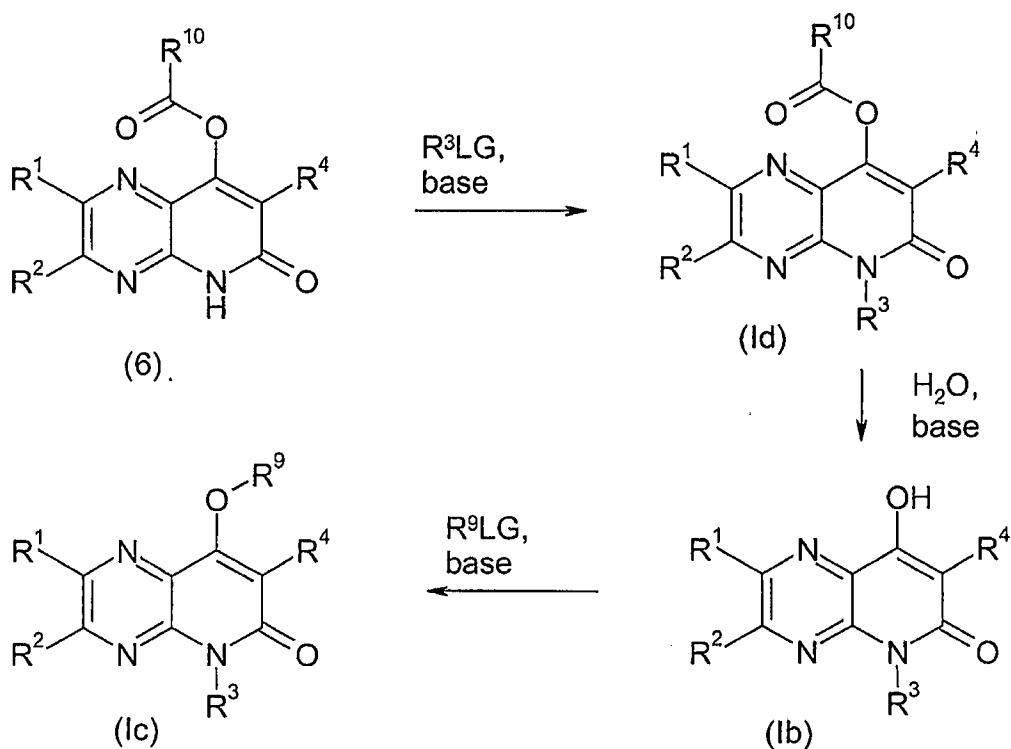
1) Compuestos de fórmula (4) en donde R₁, R₂ y R₄, son definidas para un compuesto de fórmula (I) y R₁₆ es C₁-C₆alquil puede hacerse mediante la reacción de un éster amino-pirazina de fórmula (2) en donde R₁ y R₂ estan definidos para un compuesto de fórmula (I) y R₁₆ que es C₁-C₆alquil con un derivado del ácido de fórmula (3) que R₄ es definido para un compuesto de fórmula (I) y X es halógeno o hidroxilo, como se muestra en Esquema 1. Por ejemplo, si (3) es un ácido clorhídrico (es decir, donde X es el cloro), la reacción puede ser llevado a cabo convenientemente opcionalmente en presencia de una base, como trietilamina o piridina, en un disolvente adecuado, como el acetonitrilo o diclorometano, opcionalmente mediante calentamiento por microondas. Por otra parte, si (3) es un ácido carboxílico (es decir, donde X es hidroxilo) la reacción puede ser conveniente llevada a cabo utilizando un método de acoplamiento de amida, por ejemplo por reacción con un agente de acoplamiento, como bis (2-oxo-3-oxazolidinil) cloruro fosfinico, en presencia de

una base, como trietilamina, en un disolvente adecuado, como el diclorometano, u otros métodos de acoplamiento de amida que se han revisado en Tetrahedron (2005), 61 (46), 10827-10852.

2) Compuestos de fórmula (5), en donde R1, R2 y R4, son definidos para un compuesto de fórmula (I), pueden ser preparados por el tratamiento de un compuesto de fórmula (4), tal como se define en 1) con una base en un disolvente adecuado, como carbonato de potasio en *N, N*-dimetilformamida o litio de hexametildisilazida en tetrahidrofurano, usando opcionalmente el calentamiento por microondas.

3) Compuestos de fórmula (6), en donde R1, R2, R4 y R10 se definen para un compuesto de fórmula (I), pueden prepararse por reacción de un compuesto de fórmula (5) tal como se define en 2), con ácido clorhídrico de fórmula $R_{10}COCl$ o un ácido anhídrido de fórmula $(R_{10}CO)_2O$ donde R10 se define para un compuesto de fórmula (I), opcionalmente en presencia de una base, como trietilamina o piridina, opcionalmente, en un disolvente adecuado, como por ejemplo diclorometano.

Esquema 2



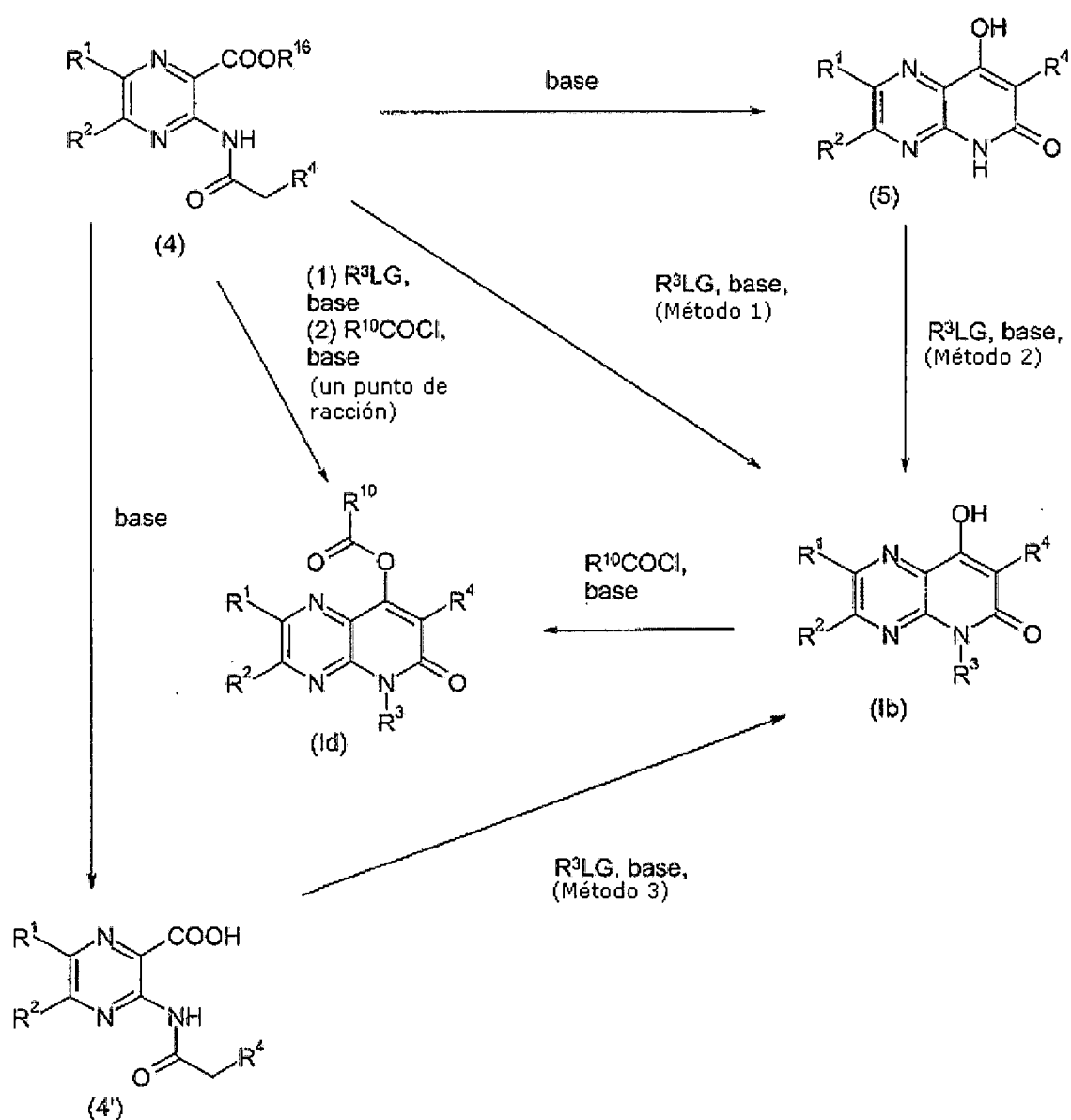
4) Compuestos de fórmula (Id), es decir, un compuesto de fórmula (I), donde R^5 es $-O-CO-R^{10}$, se pueden preparar a partir de un compuesto de fórmula (6), tal como se define en 3) por reacción con un compuesto de fórmula R^3LG donde R^3 es como se define para un compuesto de fórmula (I) y LG es un grupo de partida tal como un haluro, por ejemplo, bromuro o yoduro, o tosilato, mesilato o triflate, en presencia de una base, como carbonato de potasio, opcionalmente en presencia de un activador/yoduro, tal como yoduro de potasio, en un disolvente adecuado, como el acetonitrilo o *N,N*-dimetilformamida, opcionalmente mediante calentamiento por microondas, como se muestra en el **Esquema 2**.

5) Compuestos de fórmula (Ib), es decir, un compuesto de fórmula (I), donde R^5 es hidroxilo, puede ser preparado por el tratamiento de un compuesto

de fórmula (Id), tal como se define en 4) con una base, tal como hidróxido de sodio o carbonato de potasio, y agua en un disolvente adecuado, como el metanol o *N, N*-dimetilformamida.

6) Compuestos de fórmula (Ic), es decir, un compuesto de fórmula (I), donde R5 es -O-R9, puede ser preparado a partir de un compuesto de fórmula (Ib), como se define en 5) por reacción con un compuesto de fórmula R9LG donde R9 como se define para un compuesto de fórmula (I) y LG es un grupo de partida tal como un haluro, por ejemplo, bromuro o yoduro, o tosilato, mesilato o triflate, en presencia de una base, como carbonato de potasio, de manera adecuada, solventes, tales como *N,N*-dimetilformamida.

Esquema 3



7) Compuestos de fórmula (1d), tal como se define en 4), pueden adicionalmente ser preparados en un recorrido acortado directamente de un compuesto de fórmula (4), tal como se define en 1) por reacción con un compuesto de fórmula R^3LG tal como se define en 4), en la presencia de una base, como el sodio o de potasio hexametildisilazido, en un disolvente adecuado, como tetrahidrofurano, opcionalmente usando calentamiento por microondas, seguida de una reacción con un ácido clorhídrico de fórmula

R10COCl o un ácido anhídrido de fórmula (R10CO)₂O, tal como se definen en 3), opcionalmente en presencia de una base, como trietilamina, en el mismo recipiente de reacción, como se muestra en el **Esquema 3**.

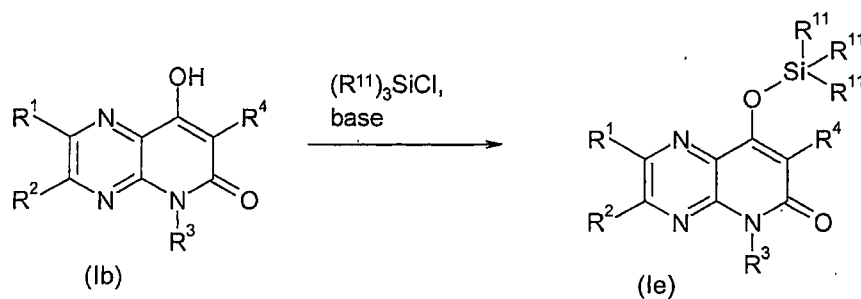
8) Por otra parte los compuestos de fórmula (Id), tal como se define en 4) se pueden hacer de un compuesto de fórmula (Ib), tal como se define en 5), por reacción con un ácido clorhídrico de fórmula R10COCl o un ácido anhídrido de fórmula (R10CO)₂O, tal como se define en 3), opcionalmente en presencia de una base, como trietilamina, opcionalmente, en un disolvente adecuado, como por ejemplo diclorometano.

9) Compuestos de fórmula (Ib), tal como se define en 5) se puede hacer por la reacción de un compuesto de fórmula (4), tal como se define en 1) con un compuesto de fórmula R3LG tal como se define en 4), en presencia de una base, tal como potasio hexametildisilazido, en un disolvente adecuado, como tetrahidrofurano, usando opcionalmente calentamiento por microondas (Método 1).

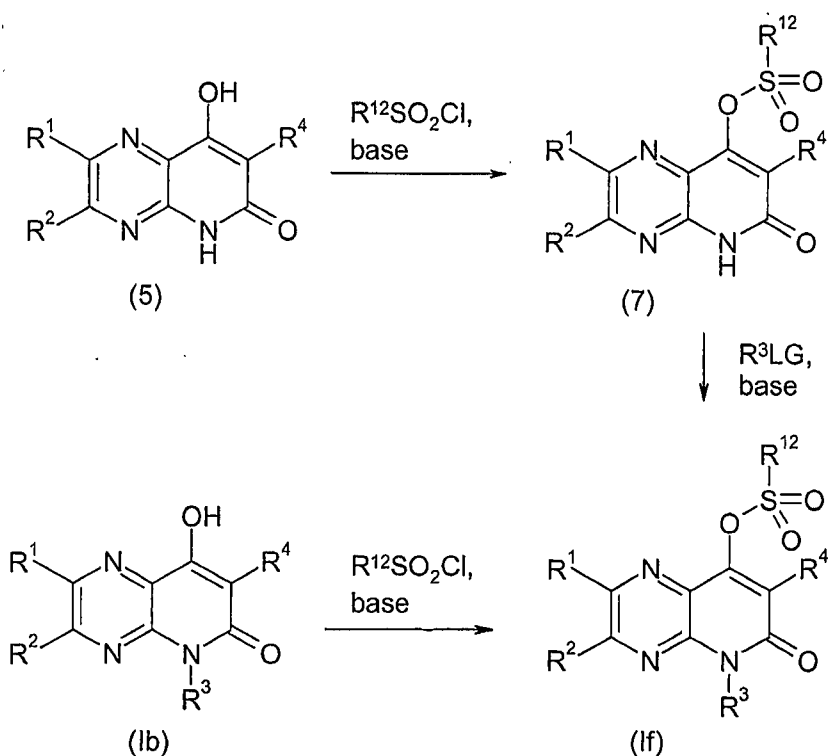
10) Compuestos de fórmula (Ib), definidos en 5) también pueden hacerse a partir de un compuesto de fórmula (5) tal como se define en 2) por reacción con un compuesto de fórmula R3LG según se define en 4), en presencia de una base, tal como potasio hexametildisilazida, en un disolvente adecuado, como tetrahidrofurano, usando opcionalmente calentamiento por microondas (Método 2). La síntesis de compuestos de fórmula (5) se describe en 2).

11) Compuestos de fórmula (Ib), definidos en 5) también pueden hacerse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (4') con un compuesto de fórmula R₃LG tal como se define en 4), en presencia de una base, como el sodio hexametildisilazida, en un disolvente adecuado, como tetrahidrofurano, usando opcionalmente calentamiento por microondas (Método 3). Compuestos de fórmula (4') se pueden hacer de un compuesto de fórmula (4) por reacción con una base, tal como litio hexametildisilazida, en un disolvente adecuado, como por ejemplo tetrahidrofurano o *N,N*-dimetilformamida, opcionalmente, mediante calentamiento por microondas.

Esquema 4



12) Compuestos de silano de fórmula (Ie), es decir, un compuesto de fórmula (I) donde R₅ es -O-Si (R₁)₃, se pueden hacer de un compuesto de fórmula (Ib), tal como se define en 5), por reacción con un trialquilsilil cloruro de fórmula (R₁)₃SiCl, en un disolvente adecuado, como por ejemplo tetrahidrofurano o acetonitrilo, en presencia de una base, como trietilamina, como se muestra en el **Esquema 4**.

Esquema 5

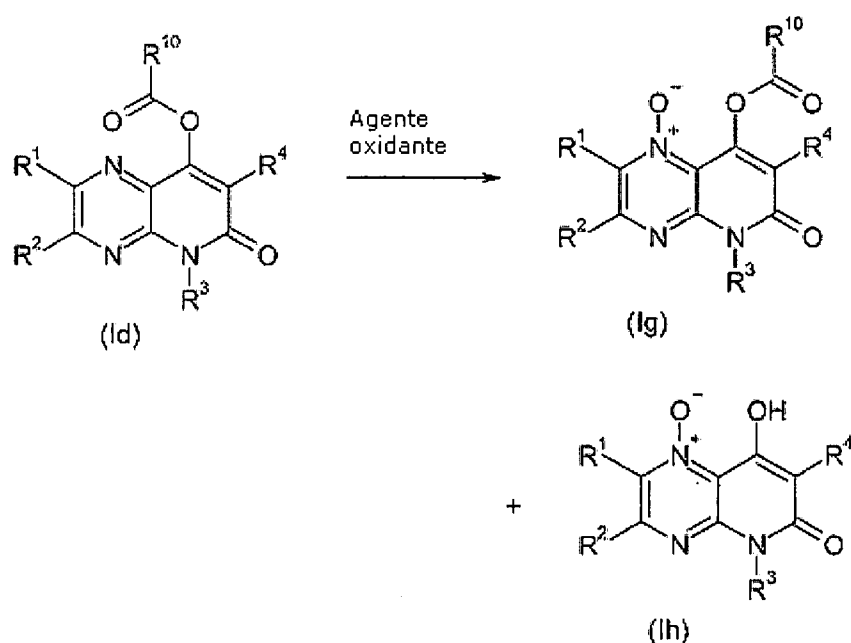
13) Compuestos de sulfonil de fórmula (7), en donde R^1 , R^2 , R^4 y R^{12} son como se definen para un compuesto de fórmula (I), pueden hacerse de un compuesto de fórmula (5) tal como se define en 2) por reacción con cloruro de sulfonil de fórmula $R^{12}SO_2Cl$ donde R^{12} se define para un compuesto de fórmula (I), en la presencia de una base, como trietilamina, en un disolvente adecuado, como por ejemplo tetrahidrofurano o cloruro de metileno, como se muestra en el **Esquema 5**.

14) Compuestos de sulfonil de fórmula (If), es decir, un compuesto de fórmula (I) donde R^5 es $-O-SO_2-R^{12}$, se pueden hacer por la reacción de un compuesto de fórmula (7), tal como se define en 13), con un compuesto de

fórmula R3LG tal como se define en el 4), en presencia de una base, como el sodio o potasio hexametildisilazida, en un disolvente adecuado, como tetrahidro-furano, opcionalmente, mediante calentamiento por microondas.

15) Por otra parte, los compuestos de fórmula (If), definidos en 14) se pueden hacer por la reacción de un compuesto de fórmula (Ib), tal como se define en 5), con sulfonil cloruro de fórmula R12SO2Cl tal como se define en 13), en presencia de una base, como trietilamina, en un disolvente adecuado, como por ejemplo tetrahydrofurano o diclorometano.

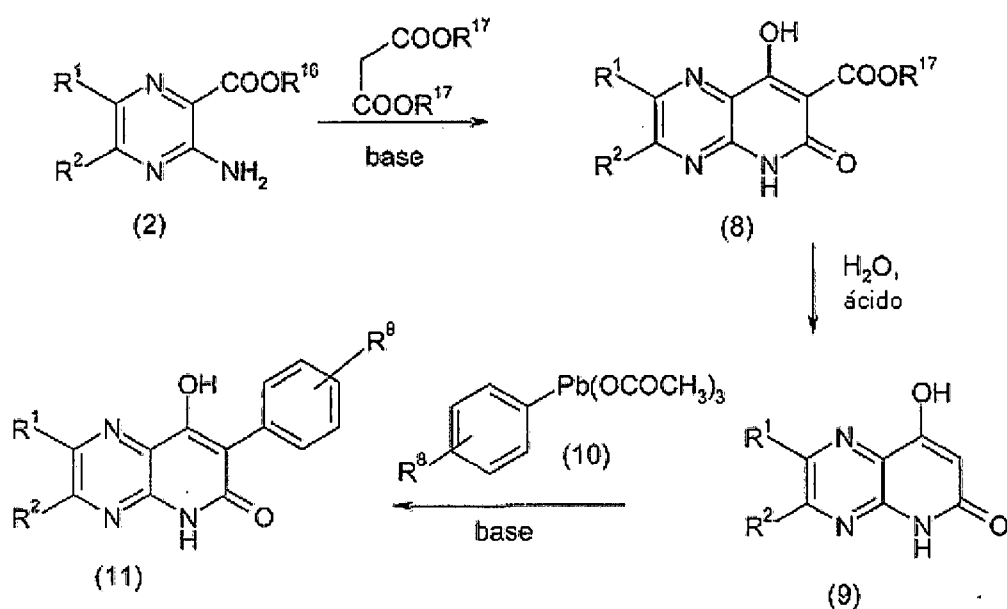
Esquema 6



16) Una mezcla de N-óxidos de fórmula (Ig), es decir, un compuesto de fórmula (I) donde 5-nitrógeno se oxida, y R5 es-O-CO-R10, y N-óxidos de fórmula (Ih), es decir, un compuesto de fórmula (I) donde 5-nitrógeno se oxida, y R5 es hidroxilo, se puede hacer por reacción de un compuesto de fórmula (Id),

tal como se define en 4), con un agente oxidante, por ejemplo, un per-ácido, como ácido per-trifluoroacético, generado *in situ* por ejemplo por anhídrido trifluoroacético y peróxido de hidrógeno sobre urea granulada, en un disolvente adecuado, como el cloruro de metileno, como se muestra en el **Esquema 6**.

Esquema 7



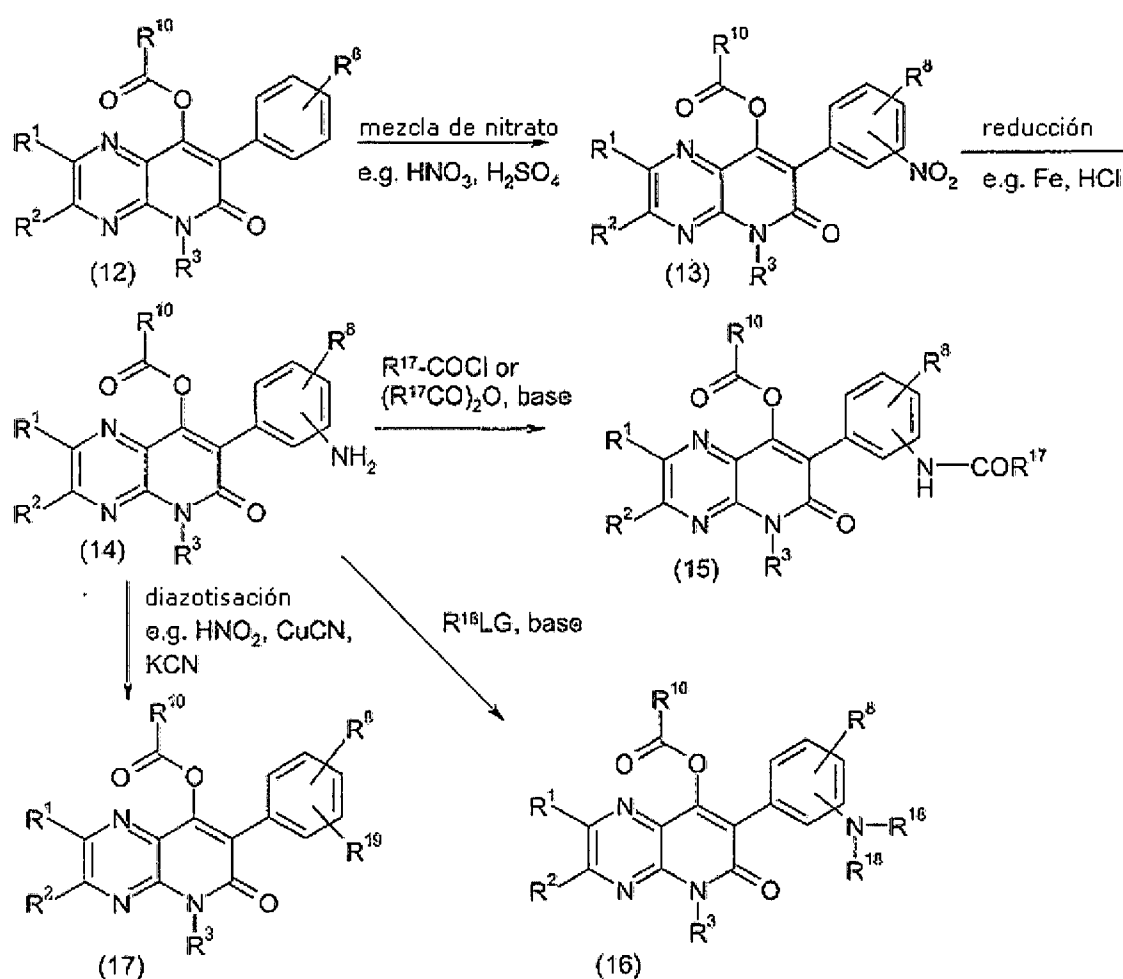
17) Compuestos de fórmula (8), donde R^1 y R^2 son definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R^{17} es C1-C6alquil, pueden hacerse mediante la reacción de aminopirazina éster de fórmula (2), tal como se define en el punto 1) con un dialquil malonato de fórmula $\text{CH}_2(\text{CO}_2\text{R}^{17})_2$ donde R^{17} es C1-C6alquil, en presencia de una base, como la metoxida de sodio, en un disolvente adecuado, como el metanol, a una temperatura de 20°C al reflujo, preferentemente, en el reflujo, como se indica en el **Esquema 7**.

18) Compuestos de fórmula (9), en donde R^1 y R^2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I), se pueden hacer por hidrólisis y decarboxilación

de un compuesto de fórmula (8), tal como se definen en 17) por el tratamiento con ácido fuerte acuoso, por ejemplo, ácido clorhídrico concentrado, o, alternativamente, por el tratamiento con ácido diluido acuoso, por ejemplo, ácido clorhídrico diluido, y el agua en un disolvente adecuado, como el etanol, usando opcionalmente el calentamiento por microondas.

19) Compuestos de fórmula (11), donde R1, R2 y R8 están definidos como para un compuesto de fórmula (I), pueden ser realizados por la reacción de un compuesto de fórmula (9), tal como se define en 18) con un compuesto de plomo de fórmula (10), donde R8 está definido como para un compuesto de fórmula (I), en la presencia de una base, como el 4-dimetilaminopiridina, y, en un disolvente adecuado, como el dimetil sulfóxido. Compuestos de plomo (10) son conocidos en la literatura y pueden ser hechos por los métodos que se describen en Aust. J. Chem., 1979, 32, 1561-6, y J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1990, 3, 715-20.

Esquema 8



20) Nitrocompuestos de fórmula (13), en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^8 y R^{10} están definidos como para un compuesto de fórmula (I), se pueden hacer por nitración de un compuesto de fórmula (12), en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^8 y R^{10} están definidos como para un compuesto de fórmula (I), con una mezcla de nitración, por ejemplo ácido nítrico fumante y ácido sulfúrico concentrado, como se indica en el **Esquema 8**.

21) Compuestos de amino de fórmula (14), en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^8 y R^{10} están definidos como para un compuesto de fórmula (I), se pueden hacer por la reducción de un compuesto de fórmula (13), tal como se define en 20),

mediante la reducción de las condiciones estándar, por ejemplo, limaduras de hierro en disolución acuosa de ácido clorhídrico.

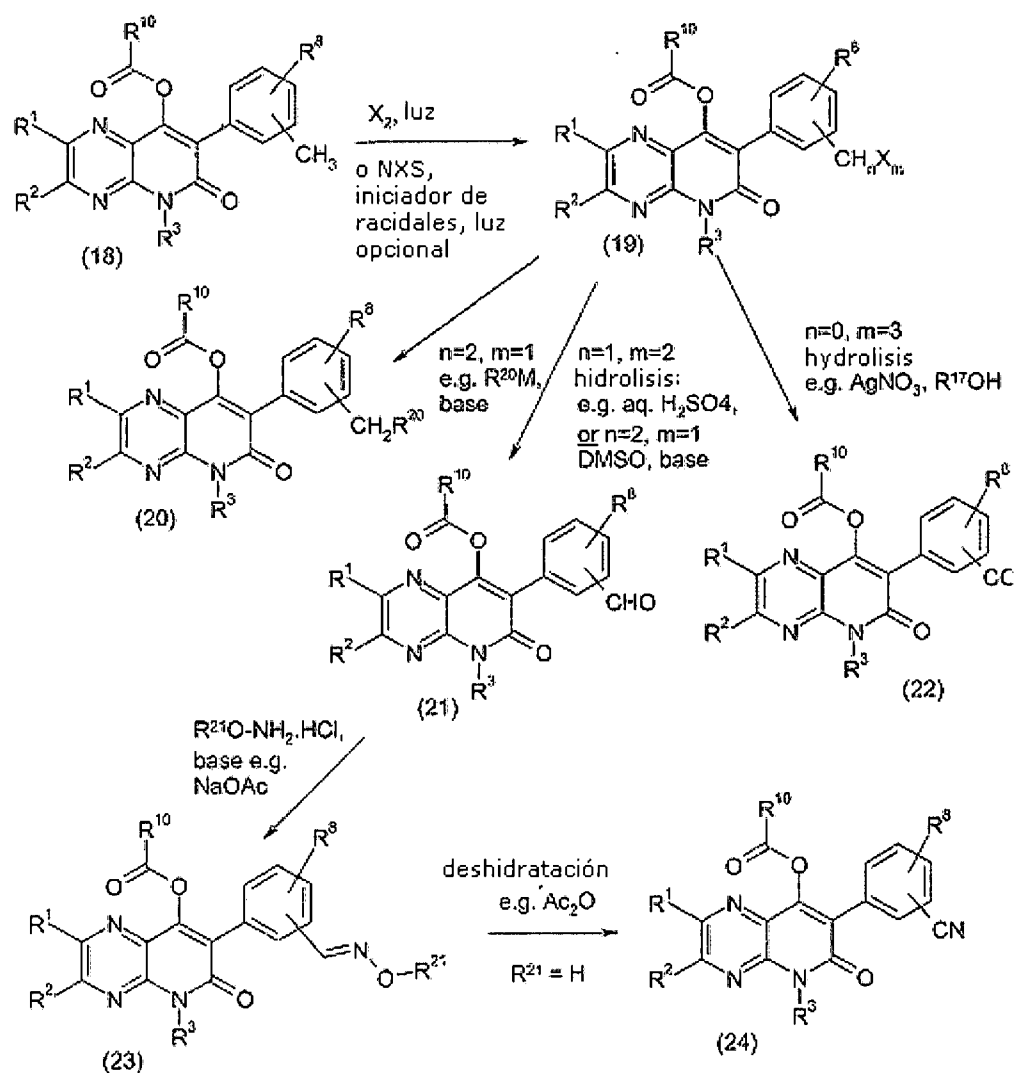
22) Compuestos acilados de fórmula (15), en donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R17 está definido como aparece en 17), se pueden hacer por acilación de un compuesto de fórmula (14), tal como se define en 21), por ejemplo, mediante una reacción con ácido clorhídrico de fórmula $R17COCl$ o un ácido anhídrido $(R17CO)_2O$ donde R17 está definido como aparece en 17), en presencia de una base, como trietilamina, en un disolvente adecuado, como por ejemplo diclorometano.

23) Compuestos alquilados de fórmula (16), en donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R18 es C1-C6alquil, se pueden hacer por la alquilación de un compuesto de fórmula (14) tal como se define en 21), por ejemplo, por reacción con un compuesto de fórmula $R18LG$, donde R18 es C1-C6alquil y LG es un grupo de partida tal como un haluro, por ejemplo, bromuro o yoduro, o tosilato, mesilato o triflato, opcionalmente en presencia de una base, como carbonato de potasio, en un disolvente adecuado, como el etanol o tolueno.

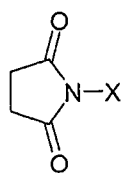
24) Compuestos de fórmula (17) en donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R19 es ciano, C1-C4alquiltio, halo, hidroxilo, pueden ser realizados por una reacción de un compuesto de fórmula (14), tal como se define en 21), por diazotización, por ejemplo, mediante una reacción con nitrito de alquilo, en presencia de un nucleófilo adecuado, por ejemplo, cianuro de potasio, en presencia de una sal

de cobre, por ejemplo cianuro de cobre, en un disolvente adecuado, como acetonitrilo.

Esquema 9



25) Compuestos de haloalquil de fórmula (19) en donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I), X es un halógeno y $n+m = 3$, se pueden hacer por la reacción de un compuesto de la fórmula (18) con un agente de halogenación, tal como halógenos de fórmula X2 donde X es cloro o bromo, en presencia de la luz, o un N-halosuccinimida de



fórmula donde X es cloro, bromo o yodo, en presencia de un iniciador de radicales, como el peróxido de benzoilo, en un disolvente adecuado, como tetracloruro de carbono, y opcionalmente en presencia de una fuente de luz, como una lámpara halógena de tungsteno de 500 vatios, en el reflujo, como se indica en el **Esquema 9**.

26) Compuestos de fórmula (20) en donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R20 es C1-C8alcoxi, C1-C8tioalcoxi, opcionalmente fenoxi sustituido, opcionalmente tiofenoxi sustituido, ciano, hidroxilo, C1-C4alquil-amino o di-(C1-C4alquil)amino, se pueden hacer por reacción de un compuesto de fórmula (19), tal como se define en 25) donde n = 2 y m = 1, con un compuesto de fórmula R20H donde R20 es C1-C8alcoxi, C1-C8tioalcoxi, opcionalmente fenoxi sustituido, opcionalmente tiofenoxi sustituido, un mono-(C1-C4alquil)amino o un di-(C1-C4alquil)amino, en presencia de una base, como carbonato de potasio o de hidruro de sodio, en un disolvente adecuado, como el etanol o *N,N*-dimetilformamida, o con un compuesto de fórmula R20M donde R20 es ciano y M es un metal, como el sodio, o donde R20 es hidroxilo y M es un metal, por ejemplo, de sodio, en un disolvente adecuado, como el etanol o *N,N*-dimetilformamida.

27) Aldehídos de fórmula (21) donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I), puede hacerse de un compuesto de fórmula (19), tal como se definen en 25), donde n = 1, m = 2, de

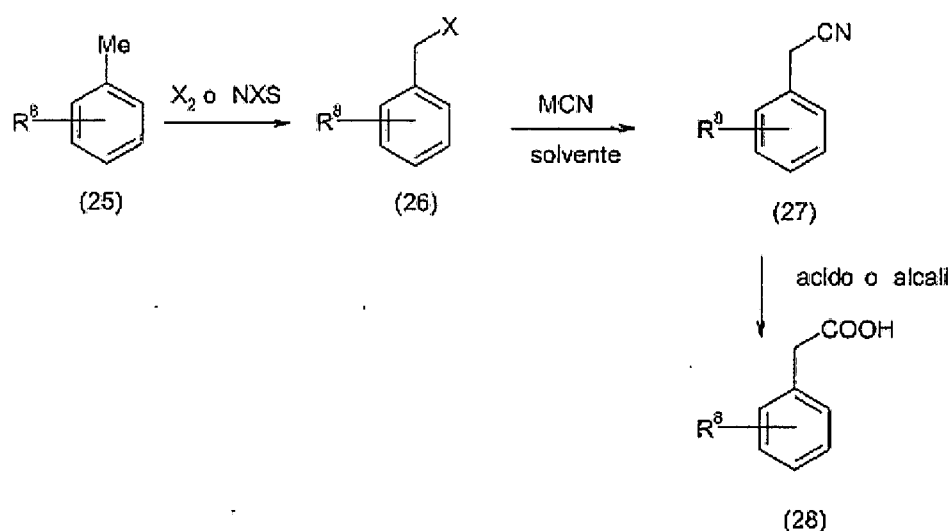
la hidrólisis de un ácido, por ejemplo ácido sulfúrico acuoso, o de un compuesto de fórmula (19), tal como se define en 25), donde $n = 2$ y $m = 1$, por reacción con dimetilsulfóxido en presencia de una base, como carbonato de potasio.

28) Compuestos de fórmula (22) donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R17 tal como se define en 17), puede hacerse de un compuesto de fórmula (19) como se define en 25), donde $n = 0$ y $m = 3$, de la hidrólisis con un alcohol de fórmula R17OH donde R17 se definen en 17), opcionalmente en presencia de una sal de plata, como el nitrato de plata.

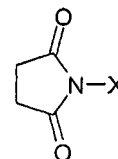
29) Compuestos de fórmula (23) donde R1, R2, R3, R8 y R10 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R21 es C1-C8alquil u opcionalmente bencílico sustituido, pueden hacerse de un aldehído de fórmula (21) según se define en 27) por reacción con una amina-hidroxilo R21O-NH₂ o su sal donde R21 es C1-C6alquil u opcionalmente bencílico sustituido, por ejemplo, el clorhidrato de sal, opcionalmente en presencia de una base, tales como acetato de sodio, en un disolvente apropiado, como el etanol.

30) Compuestos de fórmula (24) en donde R1, R2, R3, R8, R10, están definidos como para un compuesto de fórmula (I), puede hacerse de un compuesto de fórmula (23), tal como se define en 29) en el caso particular donde R21 es hidrógeno, por reacción con un agente de deshidratación, tales como el anhídrido acético.

Esquema 10



31) En determinados casos en que los ácidos aril acético no son comercialmente disponibles, es necesario hacerlos. Una síntesis típica se muestra en el **Esquema 10**. Los haloideos nencílico de fórmula (26) en donde R^8 está definido como para un compuesto de fórmula (I) y X es halógeno, se puede hacer por una reacción de un tolueno sustituido de formula (25) en donde R^8 está definido como para un compuesto de fórmula (I), con un agente de halogenación, tales como halógenos de fórmula X_2 donde X es cloro o

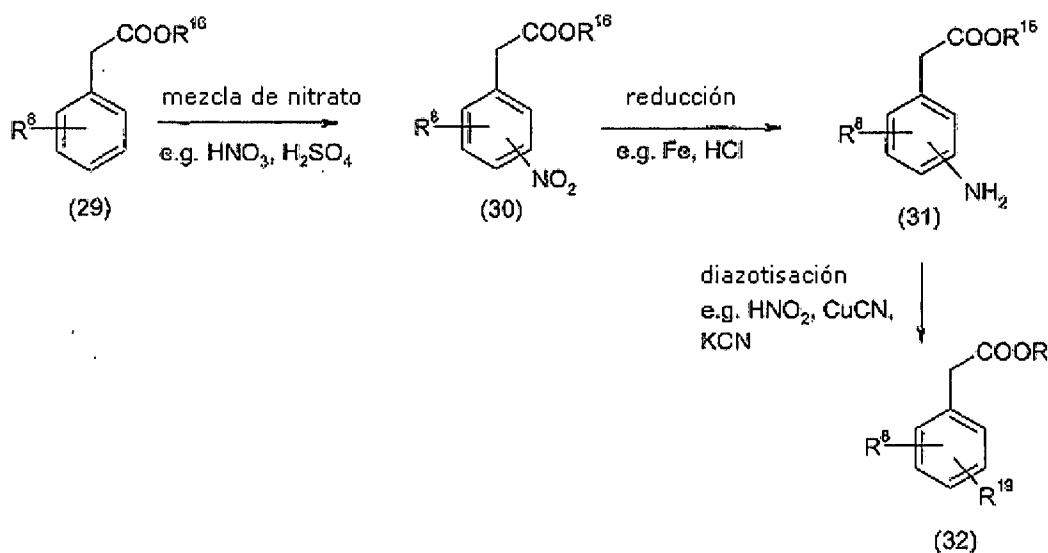


bromo, en presencia de la luz, o un N-halosuccinimido de fórmula donde X es cloro, bromo o yodo, en presencia de un iniciador de radicales, como el peróxido de benzoilo, en un disolvente adecuado, como el tetracloruro de carbono, y opcionalmente en presencia de una fuente de luz, como una lámpara halógena de 500 vatios de tungsteno , en reflujo.

32) Cianuros de bencílico de fórmula (27) en donde R8 está definido como para un compuesto de fórmula (I) pueden ser realizados por la reacción de un compuesto de fórmula (26), tal como se define en 31) con un metal de cianuro, como el cianuro de potasio, en un disolvente adecuado, como el etanol, en reflujo.

33) Ácidos fenil acéticos de fórmula (28), en donde R8 está definido como para un compuesto de fórmula (I), pueden ser realizadas por la reacción de un compuesto de fórmula (27), tal como se define en 32) de la hidrólisis usando ácido acuoso o alcalino, pero preferentemente ácido acuoso, tales como ácido sulfúrico acuoso, a reflujo.

Esquema 11



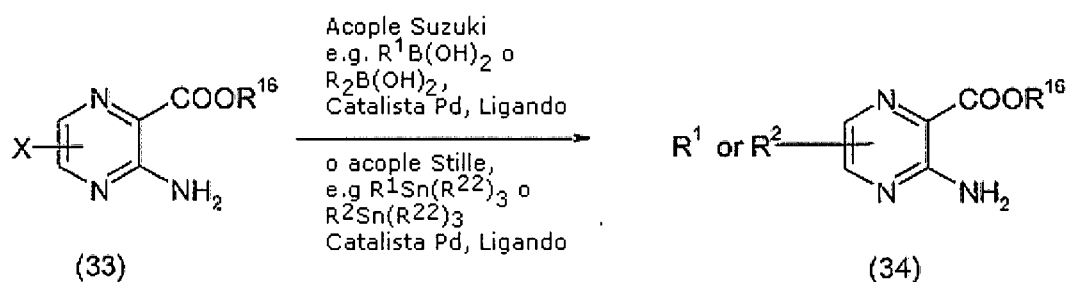
34) Nitrocompuestos de fórmula (30), en donde R8 está definido como para un compuesto de fórmula (1) y R16 tal como se define en 1), se pueden hacer por nitración de un compuesto de fórmula (29) en donde R8 está definido

como para un compuesto de fórmula (1) y R16 tal como se define en 1), con una mezcla de nitración, por ejemplo el ácido nítrico fumante y ácido sulfúrico concentrado, como se indica en el **Esquema 11**.

35) Amino compuestos de fórmula (31) en donde R8 está definido como para un compuesto de fórmula (1) y R16 tal como se define en 1), se pueden hacer por la reducción de un compuesto de fórmula (30), tal como se define en 34), utilizando la reducción de las condiciones estándar, por ejemplo, limaduras de hierro en disolución acuosa de ácido clorhídrico.

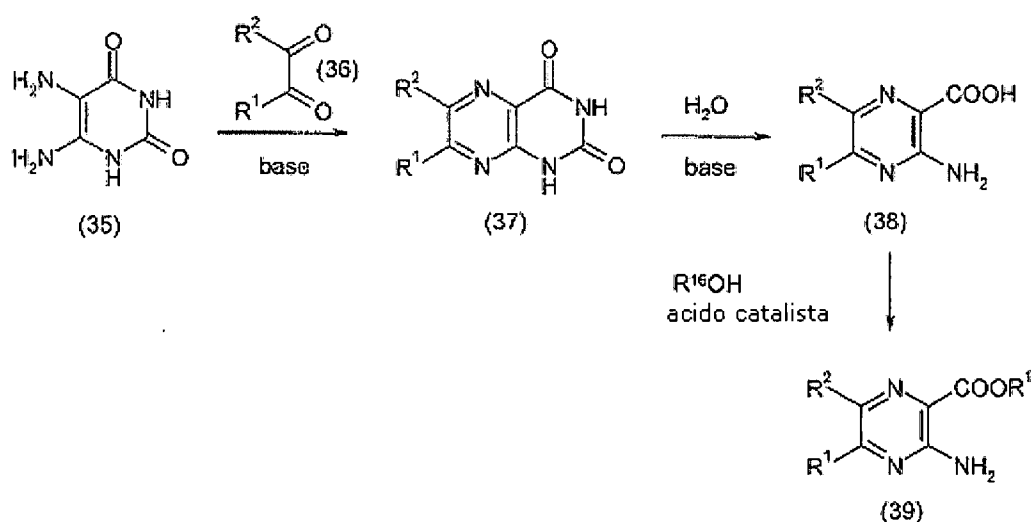
36) Compuestos de fórmula (32) en donde R8 está definido como para un compuesto de fórmula (1), R16 tal como se define en 1), y R19 es ciano, C1-C4alquiltio, halo, hidroxilo o, pueden ser realizados por una reacción de compuesto de fórmula (31), tal como se define en 35), por diazotización, por ejemplo, mediante una reacción con nitrito de alquilo, en presencia de un nucleófilo adecuado, por ejemplo, cianuro de potasio, en presencia de una sal de cobre, por ejemplo cianuro de cobre, en un disolvente adecuado, como acetonitrilo.

Esquema 12



37) Compuestos de fórmula (36) en donde R1 y R2 están definidos como para un compuesto de fórmula (I) y R16 se define como en 1), pueden hacerse de un compuesto de fórmula (33), donde X es halógeno, tal como el cloro, bromo o yodo, como se indica en el Esquema 12. Esto puede ser logrado por el acoplamiento Suzuki usando ácido borónico R1B (OH)₂ o R2B (OH)₂ en presencia de un catalizador de paladio, como acetato de paladio (II), en presencia de un ligando, como 2'-diciclohexilfosfino-2,6-dimetoxi-1, 1'-bifenil, en presencia de una base, como el fosfato de potasio, en un disolvente adecuado, tal como una mezcla de tolueno y agua, a una temperatura de 50°C a 150°C, preferentemente de 100°C a 120°C, opcionalmente, mediante calentamiento por microondas. Alternativamente, el acoplamiento Stille puede ser utilizado, mediante un reactivo de estaño R1Sn (R22)₃ o R2Sn(R22)₃ donde R22 es C1-C6alquil en presencia de un catalizador de paladio, como cloruro de paladio (II), en presencia de un ligando, como tri-terciario-butilfosfina, en un disolvente adecuado, como *N,N*-dimetilformamida o acetonitrilo, a una temperatura de 20°C a 150°C, preferentemente de 75°C a 120°C.

Esquema 13



(38) A pesar los ésteres de 3-amino-5-pirazinecarboxilato de fórmula (39) en donde R^1 y R^2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I) y R^{16} tal como se define en 1), son conocidos en la literatura, por ejemplo, en J. Med. Chem.. (1967), 10, 66; J. Med. Chem.. (1967), 10, 899, y J. Med. Chem.. (1967), 10, 598, existe la necesidad de hacer estos compuestos usando una síntesis más pequeña o más conveniente. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (37) en donde R^1 y R^2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I), pueden ser sintetizado por la condensación de diaminouracil de la fórmula (35) o una sal del mismo con una diketona o quetoaldehida de fórmula (36) en donde R^1 y R^2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I), en la presencia de una base, como el amoníaco acuoso.

(39) Un aminoácido pirazino de fórmula (38), en donde R^1 y R^2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I), puede estar formado por la apertura de anillo de un compuesto de fórmula (37) en donde R^1 y R^2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I), en la presencia de una base, como

el hidróxido de sodio, y agua, opcionalmente, mediante calentamiento por microondas.

40) Un compuesto de fórmula (39) en donde R1 y R2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I) y R16 tal como se define en 1), puede hacerse de un compuesto de fórmula (38) en donde R1 y R2 son los definidos para un compuesto de fórmula (I), por ejemplo, mediante la esterificación con un alcohol de fórmula R16OH donde R16 esta como se define en 1), tal como el metanol, en presencia de un catalizador ácido, como el cloruro de acetilo.

Los compuestos de fórmula (I), de acuerdo con la invención puede ser utilizados como herbicidas sin modificaciones, tal como se obtiene en la síntesis, pero por lo general se formulan en composiciones herbicidas de diversas maneras mediante la formulación de los adyuvantes, tales como los transportistas, los disolventes y las sustancias de superficie activa. Las formulaciones pueden estar en varias formas físicas, por ejemplo, en forma de polvos espolvoreados, geles, polvos mojables, gránulos dispersables en agua, tabletas dispersables en agua , gránulos efervescentes, concentrados emulsificantes, micro concentrados emulsionables, aceite en emulsiones de agua, aceites de flujo, dispersiones acuosas, dispersiones aceitosas, suspo - emulsiones, las suspensiones en cápsula, gránulos emulsificables, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o solvente orgánico miscible en agua como transportista), películas de polímeros impregnados o en otras formas conocidas, por ejemplo de Manual on Development and Use of

FAO Specifications for Plant Protection Products, 5^a Edición, 1999. Dichas fórmulas pueden utilizarse directamente o bien se diluyen antes de su uso. Las diluciones que se pueden hacer, por ejemplo, con el agua, los abonos líquidos, micronutrientes, los organismos biológicos, aceite o disolventes.

Las formulaciones pueden ser preparadas por ejemplo, mezclando el ingrediente activo en la formulación adyuvantes con el fin de obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, granulados, soluciones, emulsiones o dispersiones. El ingrediente activo puede ser formulado con otros adyuvantes, tal como los sólidos finamente divididos, aceites minerales, aceites de origen vegetal o animal, aceites modificados de origen vegetal o animal, disolventes orgánicos, el agua, la superficie-activos o combinaciones de los mismos. Los ingredientes activos también pueden ser contenidos en microcápsulas muy finas que consisten en un polímero. Las microcápsulas contienen los ingredientes activos en transportadores porosos. Esto permite a los ingredientes activos ser liberados en el medio ambiente en cantidades controladas (por ejemplo, de liberación lenta). Las microcápsulas suelen tener un diámetro de 0,1 a 500 micrones. Estas contienen ingredientes activos en un monto aproximado de 25 a 95% en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar en forma de un sólido monolítico, en forma de partículas finas en dispersión sólida o líquida o en forma de una solución adecuada. La membranas de encapsulación comprende, por ejemplo, cauchos naturales o sintéticos, celulosa, estireno/butadieno copolímeros, poliacrilonitrílicas, poliacrilato, poliéster, poliamidas, poliureas, poliuretano o los

polímeros modificados químicamente y xantatos de almidón o de otros polímeros que son conocidos por las personas con habilidades en el arte en este sentido. Alternativamente, las microcápsulas muy finas se pueden formar en el que el ingrediente activo está contenido en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de base de fondo, pero las microcápsulas no son encapsuladas así mismas.

Los adyuvantes de la formulación que son adecuados para la preparación de las composiciones según la invención se sabe *per se*. Como portadores de líquido pueden ser utilizado: el agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceites vegetales, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, ácido anhídrido, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butileno, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, alquil ésteres de ácido acético, alcohol diacetona, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenzeno, dietilenglicol, dietilenglicol abietato, dietilenglicol butil éter, dietilenglicol éter etílico, dietilenglicol metil éter, *N,N*-dimetilformamida, dimetil sulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, dipropilenglicol metil éter, dipropilenglicol dibenzoato, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, butil éter de glicol de etileno, etilenglicol metil éter, gamma-butirolactona, glicerina, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, glicol hexileno, isoamil acetato, acetato de isobornil, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, isopropil miristato, ácido láctico, laurilamine, óxido de mesitilo, metoxi-propanol, metilisoamilcetona,

metilisobutilcetona, laurato de metilo, metil octanoato, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, *n*-hexano, *n*-octilamina-, octa-ácido decanoico, octilamina acetato, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG400), ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, metil éter de glicol de propileno, p-xileno, tolueno, trietilo fosfato, trietilenglicol, ácido xilenesulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, propilenglicol metil éter, dietilenglicol metil éter, metanol, etanol, isopropanol, y alcoholes de mayor peso molecular, tal como alcohol de amilo, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, *N*-metil-2-pirrolidona y similares. El agua es generalmente el transportista de elección para diluir los concentrados. Los transportistas sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, pirofilita arcilla, sílice, arcilla atapulgita, diatomita, piedra caliza, carbonato de calcio, bentonita, montmorillonita de calcio, cáscaras de semilla de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, cáscaras de nuez molidas, lignina y sustancias similares, tal como se describe, por ejemplo, en CFR 180.1001. (c) & (d).

Un gran número de sustancias de superficie activa pueden ser utilizadas en ambas formulaciones líquidas y sólidas, especialmente en las formulaciones que se puede diluir con un transportista antes de su uso. Las sustancias de superficie activa pueden ser aniónicas, catiónicas, no iónicas o polímeros y que pueden ser utilizados como agentes emulsionantes, agentes humectantes o agentes de suspensión o para otros fines. Las sustancias de superficie activa

típicas incluyen las sustancias activas, por ejemplo, sales de sulfatos de alquilo, como dietanolammonium lauril sulfato; sales de alquilarilsulfonatas, como el calcio dodecilbenzenesulfonato; productos adicionales alquilfenol/óxido de alqueno, como los etoxilatos de nonilfenol; productos de adición alcohol/óxido de alqueno, tales como tridecilaalcohol etoxilato; jabones, tal como el estearato de sodio; sales de alquilnaftalenesulfonates, tales como el sodio dibutilnaftalenesulfonata; ésteres de dialquil de sales de silfuccinatos, tales como el sodio di(2-etilhexil)sulfosuccinato; ésteres de sorbitol, tales como el sorbitol oleato; aminas cuaternarias, tales como cloridos de lauriltrimetilamonio, polietileno glicol de ácidos grasos, tales como el polietilenglicol estearato; copolímeros de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno, y sales de mono-y di-ésteres alquifosfato, y también se describen por ejemplo, nuevas sustancias en "McCutcheon's Detergents y Emulsifiers Annual" MC Ediciones Corp., Ridgewood Nueva Jersey, 1981.

Más adyuvantes, que pueden ser utilizados en las formulaciones de pesticidas, incluyen inhibidores de cristalización, modificadores de viscosidad, agentes de suspensión, colorantes, antioxidantes, agentes espumantes, absorbentes de luz, auxiliares de mezcla, antiespumantes, agentes complejantes, sustancias o búferes neutralizadores o modificadores de pH, inhibidores de corrosión, fragancias, agentes humectantes, potenciadores de adopción, micronutrientes, plastificantes, glidantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas, y también los abonos líquidos y sólidos.

Las composiciones según la invención puede incluir además un aditivo compuesto por un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, alquil ésteres de estos aceites o mezclas de estos aceites y derivados del petróleo. La cantidad de aditivo de aceite en la composición según la invención es generalmente de 0,01 a 10%, sobre la base de la mezcla de atomización. Por ejemplo, el aceite aditivo se puede agregar a al tanque pulverización en la concentración deseada después de que la mezcla de atomización se ha preparado. Los aceites aditivos preferidos comprenden los aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo el aceite de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionante, como AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.), alquil ésteres de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados del metil, o de un aceite de origen animal, tales como el aceite de pescado o sebo de vacuno. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos fundamentalmente 80% en peso de alquil ésteres de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de colza desnaturalizado, y también el 5% en peso de emulsionantes personalizados o modificadores de pH. Los aditivos de aceite especialmente preferidos comprenden alquil ésteres de C8-C22 ácidos grasos, especialmente los derivados de metil de C12-C18 ácidos grasos, por ejemplo, los ésteres metílicos de ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico, siendo de importancia. Estos ésteres se conocen como metil laurato (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de ácido graso metil ester preferido es el Emery ® 2230 y 2231 (Cognis GmbH). Estos y otros derivados del petróleo

también son conocidos en el Compendium of Herbicide Adjuvants, 5^a Edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y la acción de los aditivos de aceite puede ser mejorada aún más gracias a la combinación de sustancias de superficie activa, tales como los surfactantes no-iónicos, aniónicos y catiónicos. Ejemplos de surfactantes no-iónicos, aniónicos y catiónicos se enumeran en las páginas 7 y 8 de WO 97/34485. Las sustancias de superficie activa preferidas son surfactantes aniónicos del tipo dodecilbenzilsulfonato, especialmente de los sales de calcio, y también surfactantes no ionicos del tipo etoxilato de alcoholes grasos. Se da preferencia especial a los alcoholes grasos etoxilados C12-C22 que tienen un grado de etoxilación de entre 5 y 40. Ejemplos de surfactantes disponibles comercialmente son los tipos Genapol (Clariant AG). También son preferidos los surfactantes de silicona, especialmente polialquil-óxido-heptametiltriloxanos modificados que están disponibles comercialmente, por ejemplo como Silwet L-77 ®, y también surfactantes perfluorados. La concentración de las sustancias de superficie activa al total aditivo es generalmente de 1 a 30% en peso. Ejemplos de aditivos de aceite que constan de mezclas de aceites de petróleo o de minerales o sus derivados con surfactantes son Edenor ME SU ®, Turbocharge ® (Syngenta AG, CH) o ActipronC (BP Oil UK Limited, GB).

Si se desea, también es posible para las sustancias de superficie activa mencionadas ser utilizadas en las fórmulas por su cuenta, es decir, sin aditivos de aceite.

Además, la adición de un solvente orgánico al aditivo al aceite/mezcla surfactante puede contribuir a una mejora de la acción. Disolventes adecuados son, por ejemplo, Solvesso ® (ESSO) o Aromatic Solvent ® (Exxon Corporation). La concentración de tales disolventes puede ser de 10 a 80% en peso del peso total. Los aditivos de aceite que están presentes en la mezcla con solventes se describen, por ejemplo, en US-A-4.834.908. Un aditivo de aceite disponible comercialmente reivindicado en este documento se conoce por el nombre de MERGE® (BASF Corporation). Otro aditivo de aceite que se prefiere de acuerdo con la invención es SCORE ® (Syngenta Crop Protection Canadá).

Además de los aditivos de aceite mencionados anteriormente, con el fin de mejorar la acción de las composiciones según la invención también es posible que las formulaciones de alquilpirrolidonas (por ejemplo, Agrimax ®) se añadan a la mezcla de atomización. Formulaciones de celosía sintética, por ejemplo, poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-p-menteno (por ejemplo, Bond ®, Courier® o Emerald®) también pueden ser utilizadas. También es posible que las soluciones que contienen ácido propiónico, por ejemplo Eurogkem Pen-e-trate ®, se añadan a la mezcla de atomización como agente de mejora de la acción.

Las composiciones herbicidas comprenden generalmente de 0,1 a 99% en peso, especialmente, desde el 0,1 al 95% en peso, de compuestos de fórmula (I) y de 1 a 99,9% en peso de la formulación de un adyuvante que incluye preferentemente de 0 a 25% en peso de una sustancia de superficie

activa. Ya que los productos comerciales podrían ser preferentemente formulados como concentrados, el usuario final normalmente empleara formulaciones de diluido.

Las tasas de aplicación de los compuestos de fórmula (I) puede variar dentro de largos límites y dependen de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (pre o post-emergencia; desinfectación de semillas ; aplicación en el surco de semillas, no aplicación de labranza, etc.), la planta del cultivo, la hierba o la maleza a ser controlada, las condiciones climáticas y otros factores que se rigen por el método de aplicación, el momento de la solicitud y el cultivo objetivo. Los compuestos de fórmula (I), de acuerdo con la invención son de aplicación general a un ritmo de 10 a 2000 g/ha, especialmente de 50a1000 g/ha.

Las formulaciones preferidas tienen, sobre todo las composiciones siguientes (% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

Ingrediente activo	1 a 95% preferentemente 60 a 90%
Agente de superficie activa	1 a 30% preferentemente 5 a 20%
Transportador liquido	1 a 80% preferentemente 1 a 35%

Polvos:

Ingrediente activo	0.1 a 10% preferentemente 0.1 a 5%
Transportador solido	99.9 a 90% preferentemente 99.9 a 90%

Concentrados de suspensión:

Ingrediente activo	5 a 75% preferentemente 10 a 50%
Agua	94 a 24% preferentemente 88 a 30%
Agente de superficie activa	1 a 40% preferentemente 2 a 30%

Polvos humectables:

Ingrediente activo	0.5 a 90% preferentemente 1 a 80%
Agente de superficie activa	0.5 a 20% preferentemente 1 a 15%
Transportador solido	5 a 95% preferentemente 15 a 90%

Granulados:

Ingrediente activo	0.1 a 30% preferentemente 0.1 a 15%
Transportador solido	99.5 a 70% preferentemente 97 a 90%

Los siguientes ejemplos ilustra, pero no se limitan, aún más la invención.

Ejemplos de formulación de herbicidas de fórmula (I) (% =% por peso)

<u>F1. Concentrados emulsionables</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5%	10%	25%	50%
dodecilbenzenesulfonato de calcio	6%	8%	6%	8%
aceite de ricino éter poliglicol	4%	-	4%	4%

(36 moles de oxido de etileno)

actifenol poliglicol éter	-	4%	-	2%
---------------------------	---	----	---	----

(7-8 moles de oxido de etileno)

NMP	-	-	10%	20%
-----	---	---	-----	-----

mezcla arom.hidrocarbon	85%	78%	55%	16%
-------------------------	-----	-----	-----	-----

C₉-C₁₂

Emulsiones de cualquier concentración deseada se puede obtener de esos concentrados de dilución con agua.

F2. Soluciones

	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5%	10%	50%	90%
1-metoxi-3-(3-metoxi-propoxi)- propano	-	20%	20%	-
polietileno glicol MW 400	20%	10%	-	-
NMP	-	-	30%	10%
mezcla arom.hidrocarbon	75%	60%	-	-
C ₉ -C ₁₂				

Las soluciones son adecuadas para su uso en la forma de microdrops.

F3. Polvos humectables

a)	b)	c)	d)
----	----	----	----

Ingrediente activo	5%	10%	50%	80%
lignosulfonato de sodio	4%	-	3%	-
sodio de sulfonato de lauril	2%	3%	-	4%
sodio de sulfonato de				
diisobutilnaftaleno	-	6%	5%	6%
actifenol poliglicol éter	-	1%	2%	-
(7-8 moles de oxido de etileno)				
acido silico altamente disperso	1%	3%	5%	10%
kaolin	86%	62%	35%	-

El ingrediente activo se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla es molida fuertemente en un molido adecuado, obteniendo polvos humectables que se puede diluir con agua para obtener la suspensión de cualquier concentración deseada.

F4. Gránulos recubiertos

	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0.1%	5%	15%
acido silico altamente disperso	0.9%	2%	2%
transportador inorgánico	99.0%	93%	83%

(diámetro 0.1- 1mm)

Por ejemplo CaCO_3 o SiO_2

El ingrediente activo es disuelto en cloruro de metileno y se aplica al transportador por medio de atomización, y el disolvente se evapora *in vacuo*.

<u>F5. Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0.1%	5%	15%
polietileno glicol MW 400	1.0%	2%	3%
acido silico altamente disperso	0.9%	1%	2%
transportador inorgánico	98.0%	92%	80%
(diámetro 0.1- 1mm)			
Por ejemplo CaCO_3 o SiO_2			

El ingrediente activo finamente molido se aplica de manera uniforme, en un mezclador, al transportador humedecido con glicol polietileno. Los gránulos recubiertos sin polvo se obtienen de esta manera.

<u>F6. Gránulos extruidos</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	0.1%	3%	5%	15%
lignosulfonato de sodio	1.5%	2%	3%	4%
carboximetilcelulosa	1.4%	2%	2%	2%
kaolin	97.0%	93%	90%	79%

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los adyuvantes, y la mezcla se

humedece con agua. Esta mezcla es extruida y luego secada en una corriente de aire.

<u>F7. Polvos</u>	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0.1%	1%	5%
talco	39.9%	49%	35%
kaolin	60.0%	50%	60%

Los polvos listos para usar se obtienen mezclando el ingrediente activo con los transportistas y moliendo la mezcla en un molino adecuado.

<u>F6. Concentrados de suspensión</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	3%	10%	25%	50%
elicol etileno	5%	5%	5%	5%
nonifenol poliglicol eter (15 moles de oxido de etileno)	-	1%	2%	-
lignosulfanato de sodio	3%	3%	4%	5%
carboximetilcelulosa	1%	1%	1%	1%
37% de solución formaldehida acuosa	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%
emulsion de aceite de silicona	0.8%	0.8%	0.8%	0.8%
agua	87%	79%	62%	38%

El ingrediente activo finamente molido está íntimamente mezclado con los adyuvantes, es decir, un concentrado de suspensión a partir de la cual la suspensión de cualquier concentración deseada se puede obtener por dilución con agua.

La invención se refiere también a un método de control de plantas que comprende aplicar a las plantas o al lugar del mismo una cantidad efectiva herbicidal de un compuesto de fórmula I.

La invención se refiere también a un método de inhibir el crecimiento de las plantas que comprende aplicar a las plantas o al lugar del mismo una cantidad efectiva herbicidal de un compuesto de fórmula I.

La invención se refiere también a un método de controlar selectivamente malezas y hierba mala en los cultivos de plantas útiles que comprenden aplicar a las plantas útiles o al lugar de las mismas, o para el área de cultivo una cantidad herbicidal efectiva de un compuesto de fórmula I.

Los cultivos de plantas útiles en el que la composición según la invención pueden ser utilizada, incluyen los cultivos perennes, tales como los cítricos, vid, frutos secos, de palma de aceite, aceitunas, frutas de pepita, frutas de hueso y caucho, y cultivos herbáceos anuales, como cereales, por ejemplo, la cebada y el trigo, el algodón, semillas oleaginosas silvestres, maíz, arroz, soja, remolacha azucarera, caña de azúcar, girasol, plantas ornamentales y hortalizas, especialmente el sector de los cereales y el maíz.

Las malezas y la hierba mala que se controlan pueden ser ambas especies, monocotiledonous, por ejemplo, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Bromus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sida* y *Sorgo*, y especies de dicotiledóneas, por ejemplo *Abutilon*, *Amarantus*, *Chenopodium*, *Crisantemo*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* y *Xanthium*.

Los cultivos han de entenderse como que incluya también a los cultivos que han sido tolerantes a los herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, ELA-, G-, EPSPS, PPO y inhibidores-HPPD) por métodos convencionales de reproducción o por la ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha hecho tolerante a imidazolinones, por ejemplo, imazamox, por métodos convencionales de reproducción es Clearfield ® colza de verano (canola). Ejemplos de cultivos que se han vuelto tolerantes a los herbicidas por métodos de ingeniería genética, por ejemplo glifosato y glufosinato de variedades de maíz resistentes comercialmente disponibles bajo los nombres comerciales de RoundupReady ® y LibertyLink ®.

Los cultivos también deben ser entendidos como aquellos que han quedado resistentes a los insectos nocivos por métodos de ingeniería genética, por ejemplo el maíz Bt (resistente a la polilla de maíz europea), el algodón Bt (resistente al picudo del algodón) y también las papas Bt (resistentes a la escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK ® (Semillas Singenta). La toxina Bt es una proteína que se forma naturalmente por la bacteria del suelo *Bacillus turingiensis*. Ejemplos de

toxinas, o de plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas, se describen en la EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427 529. Ejemplos de plantas transgénicas que comprenden uno o varios genes que codifican para una resistencia a insecticidas y exterioriza una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas o el material de semillas del mismo pueden ser resistentes a los herbicidas y, al mismo tiempo, resistentes a la alimentación de los insectos ("apiladas" eventos transgénicos). Por ejemplo, las semillas pueden tener la habilidad para secretar una proteína insecticida Cry3 y al mismo tiempo ser tolerantes al glifosato.

Los cultivos también se entienden que son los que se obtienen por métodos convencionales de reproducción o de la ingeniería genética y contienen las llamadas salidas de los rasgos (por ejemplo, mejora la estabilidad de almacenamiento, mayor valor nutritivo y mejora el sabor).

Las áreas bajo cultivación incluyen tierra en las que el cultivo de plantas ya está creciendo y tierras destinadas al cultivo de las plantas de cultivo.

Los compuestos de fórmula I según la invención también pueden utilizarse en combinación con uno o más herbicidas. En particular, las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I son importantes:

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con un auxina sintética (por ejemplo, compuestos de fórmula I + clopiralida (162), compuesto de fórmula I + 2,4-D (211), compuesto de fórmula I + dicamba (228), compuesto de fórmula I

+ MCPA (499), compuesto de fórmula I + quinclorac (712), o compuestos de fórmula I + aminopirialido (CAS RN 150114-71-9)).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con diflufenzopir (252).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I, con una acetanilida (por ejemplo, compuestos de fórmula I + acetoclor (5), compuesto de fórmula I + dimetenamida (260), compuesto de fórmula I + metolaclor (548), compuesto de fórmula I + S-metolacoloro (549), o compuestos de fórmula I + Pretilacolor (656)).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con flamprop-M (355).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con flufenacet (FOE BAY 5043) (369).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con piroxasulfono (CAS RN 447399-55 - 5).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con un triazina (por ejemplo, compuestos de fórmula I + Atrazina (37), o compuestos de fórmula I + terbutilazina (775)).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con un inhibidor de HPPD (por ejemplo, compuestos de fórmula I + isoxaflutola (479), compuesto de fórmula I + mesotriona (515), compuesto de fórmula I + piro-sulfotola (CAS RN 365400-11-9), compuesto de la fórmula I + sulcotriona (747), compuesto de fórmula I + tembotriona (CAS RN 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topramezona (CAS RN 210631-68-8), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi - 3 - [[2 - [(2-metoxietoxi) metil] -6 - (trifluorometil) -3-piridinil] carbonil] - biciclo [3.2.1] oct-3-en-2-ona (CAS RN 352010-68-5), o compuestos de fórmula I + 4 - hidroxi-

3 - [[2 - (3-metoxipropilo) -6 - (difluorometil) -3-piridinil] carbonil] - biciclo [3.2.1] oct-3-en-2-ona).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con un inhibidor de HPPD y una triazina.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con glifosato (419).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con glifosato y un inhibidor HPPD (por ejemplo, compuestos de fórmula I + glifosato + isoxaflutola, compuesto de fórmula I + glifosato + mesotriona, compuesto de fórmula I + glifosato + pirasulfotola (CAS RN 365400-11-9) , compuesto de fórmula I + glifosato + sulcotriona, compuesto de fórmula I + glifosato + tembotriona, compuesto de fórmula I + glifosato + topramezona, compuesto de fórmula I + glifosato + 4-hidroxi-3-[[2 - [(2-metoxietoxi)metil] -6 - (trifluorometil)-3-piridinil] carbonil]-biciclo [3.2.1] oct-3-en-2-ona, o compuestos de fórmula I + glifosato + 4-hidroxi-3-[[2 - (3-metloxiopropil) -6 - (difluorometilil) -3 - piridinil] carbonil]-biciclo [3.2.1] oct-3-en-2-ona) .

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con glufosinato de amonio (418).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con glufosinato de amonio y un inhibidor HPPD (por ejemplo, compuestos de fórmula I + glufosinato de amonio + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + mesotriona, compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + pirasulfotola (CAS RN 365400-11-9), compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + sulcotriona, compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + tembotriona,

compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + topramezona, compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + 4-hidroxi-3-[[2 - [(2 - metoxietoxi) metil] -6 - (trifluorometil) -3-piridinil] carbonil]-biciclo [3.2.1] oct-3 - en-2-ona, o compuesto de fórmula I + glufosinato de amonio + 4-hidroxi-3-[[2 - (3 - metoxipropilo) -6 - (difluorometil)-3-piridinil] carbonil]-biciclo [3.2.1] oct-3-en - 2-ona).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I, con un inhibidor ALS o un inhibidor de AHAS (por ejemplo, compuestos de fórmula I + bensulfuron-metil (64), compuesto de fórmula I + clorimuron-etil (135), compuesto de fórmula I + cloransulam-metil (164), compuesto de fórmula I + florasulam (359), compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio (364), compuesto de fórmula I + imazamox (451), compuesto de fórmula I + imazapir (453), compuesto de fórmula I + imazetapir (455), compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio (466), compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metil (514), compuesto de fórmula I + nicosulfuron (577), compuesto de fórmula I + penoxsulam (622), compuesto de fórmula I + piroxsulam (triflosulam) (CAS RN 422556-08-9), compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo (tiameturon-metilo) (795), compuesto de fórmula I + triasulfurón (817), compuesto de fórmula I + tribenurón-metil (822), compuesto de fórmula I + trifloxisulfuron-sodio (833), compuesto de fórmula I + tiencarbazona (4 - [(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo-1*H*-1,2,4-triazol-1-il) carbonilsulfamoil] -5 - metiltiofena-3-acido carboxílico, BAY636)), o compuestos de fórmula I + tiencarbazona-metil (metil-4 - [(4,5-dihidro - 3-metoxi-4-metil-5-oxo-1*H*-1,2,4 - triazol-1-il) carbonilsulfamoil]-5-metiltiofena-3-carboxilato, CAS RN 317815-83-1, BAY636-metil)).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con un inhibidor PPO (por ejemplo, compuestos de fórmula I + butafenacil (101), compuesto de fórmula I + carfentrazona-etil (121), compuesto de fórmula I + cinidón-etil (152), compuesto de fórmula I + flumioxazin (376), compuesto de fórmula I + fomesafen (401), o compuestos de fórmula I + [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il) fenoxi]-2-piridiloxi] éster etílico del ácido acético) (CAS RN 353292-31-6).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con un inhibidor ACCase (por ejemplo, compuestos de fórmula I + butroxidim (106), compuesto de fórmula I + cletodim (155), compuesto de fórmula I + clodinafop-propargil (156), compuesto de fórmula I + cicloxiidim (190), compuesto de fórmula I + cihalofop-butil (195), compuesto de fórmula I + diclofop-metil (238), compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etil (339), compuesto de fórmula I + fluazifop - butil (361), compuesto de fórmula I + fluazifop-P-butil (362), compuesto de fórmula I + haloxifop (427), compuesto de fórmula I + haloxifop-P (428), compuesto de fórmula I + propaquizafop (670) , compuesto de fórmula I + quizalofop (717), compuesto de fórmula I + quizalofop-P (718), compuesto de fórmula I + setoxidim (726), compuesto de fórmula I + tepraloxidim (771), compuesto de fórmula I + tralkoxidim (811)), o compuestos de fórmula I + pinoxaden (CAS RN 243973-20-8).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con prosulfocarb (683), o un compuesto de fórmula I con tri-allato (816).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con bromoxinil (95), un compuesto de fórmula I con cloridazon (134), un compuesto de fórmula I con clorotoluron (143), un compuesto de fórmula I con diurón (281), o un compuesto de fórmula I con (554).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con clomazona (159), un compuesto de fórmula I con diflufenican (251), un compuesto de fórmula I con flurocloridona (389), o un compuesto de fórmula I con flurtamona (392).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con pendimetalina (621) o un compuesto de fórmula I con trifluralin (836).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con difenzoquat metilsulfato (248).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con dicuat dibromuro (276).

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con paraquat dicloruro (614).

Los participantes de la mezcla de compuestos de fórmula I también pueden ser en forma de sales o ésteres, como se menciona por ejemplo, The Pesticide Manual, 13^a edición (BCPC), 2003. La referencia al glufosinato de amonio también se aplica a glufosinato, la referencia a cloransulam-metil también se aplica a cloransulam, la referencia a la dimetenamida se aplica también a la dimetenamida-P, la referencia a flamprop-M también se aplica a flamprop, y la referencia al piritiobac-sodio se aplica también al piritiobac, etc.

La proporción de mezcla del compuesto de fórmula I de la mezcla es preferentemente desde 1:100 a 1000:1.

Las mezclas pueden ser utilizados ventajosamente en las mencionadas fórmulas (en cuyo caso "ingrediente activo" se refiere a las respectivas mezclas de compuestos de fórmula I, con los participantes de la mezcla).

Además, uno o más de los siguientes herbicidas puede ser utilizado en combinación con un compuesto de fórmula I de acuerdo con la invención o en combinación con una mezcla, tal como se describe más arriba: Acifluorfen de sodio (7), aclonifen (8), acroleína (10), alacloro (14), alloxidim (18), ametrin (20), amicarbazona (21), amidosulfuron (22), amitrol (aminotriazola) (25), sulfamato de amonio (26), anilofos (31), asulam (36), aviglicina (39), azafenidina (CAS RN 68049-83-2), azimsulfurón (43), BAS 800H (CAS RN 372137-35-4), beflubutamida (55), benazolin (57), bencarbazona (CAS RN 173980-17 -1), benfluralin (59), benfuresato (61), bensulida (65), bentazona (67), benzfendizona (CAS RN 158755-95-4), benzobiciclon (69), benzofenap (70), bilanafos (bialafos) (77), bispiribaco en sodio (82), bórax (86), bromacil (90), bromobutida (93), bromofenoxim (CAS RN 13181-17-4), butaclor (100), butamifos (102), butralin (105), butilato (108), cafenstrola (110), carbetamida (117), clorbromuron (CAS RN 13360-45-7), clorflurenol-metil (133), ácido cloroacético (138), clorprofam (144), clorsulfuron (147), clortal-dimetil (148), cinmetilin (153), cinosulfuron (154), clomeprop (160), cumiluron (180), cianamida (182), cianazina (183), ciclanilida (186), cicloato (187), ciclosulfamuron (189), daimuron (213), dalapon (214), dazomet (216), desmedifam (225), desmetrin (CAS RN 1014-69-3), diclobenil (229), diclorprop (234), diclorprop-P (235), diclosulam (241), dimefuron (256), dimepiperato

(257), dimetacloro (258), dimetametrin (259), dimetipina (261), ácido dimetilarsinico (264), dinitramina (268), dinoterb (272), difenamida (274) , dipropetrin (CAS RN 4147-51-7), ditiopir (280), DNOC (282), DSMA (CAS RN 144-21-8), endotal (295), EPTC (299), esprocarb (303), etalfluralin (305), etametsulfuron-metil (306), etefon (307), etofumesato (311), etoxifen (CAS RN 188634-90-4), etoxifen-etilo (CAS RN 131086-42-5), etoxisulfurón (314), etobenzanida (318), fentrazamida (348), sulfato ferroso (353), flazasulfurón (356), fluazolato (isopropazol) (CAS RN 174514-07-9), flucetosulfuron (CAS RN 412928-75-7), flucloralin (365), flufenpir-etilo (371), fiumetralin (373), flumetsulam (374), flumiclorac-pentil (375), flumipropin (flumipropin) (CAS RN 84478-52-4), fluometuron (378), fluoroglicofen-etilo (380), flupoxam (CAS RN 119126-15-7), flupropacil (CAS RN 120890-70-2), flupropanato (383), flupirsulfaron-metil-sodio (384), flurenol (387), fluridona (388), fluroxipir (390), flutiacet-metil (395), foramsulfurón (402), fosamina (406), halosulfurón-metil (426), HC-252 (429), hexazinona (440), imazametabenz-metil (450), imazapic (452), imazaquin (454), imazosulfurón (456), indanofan (462), ioxinil (467), isoproturón (475) , isouron (476), isoxaben (477), isoxaclortola (CAS RN 141112-06-3), isoxapirifop (CAS RN 87757-18-4), karbutilato (482), lactofen (486), lenacil (487), linurón (489), MCPA-tioetil (500), MCPB (501), mecoprop (503), mecoprop-P (504), mefenacet (505), mefluidida (507), metam (519), metamifop (mefluoxafop) (520), metamitron (521), metazaclor (524), metabenzthiazurón (526), metazola (CAS RN 20354-26-1), ácido metilarsonico (536), metildimron (539), isotiocianato de metilo (543), metobenzuron (547),

metobromuron (CAS RN 3060-89-7), metosulam (552), metoxuron (553), metsulfurón-metilo (555), MK-616 (559), molinato (560), monolinurón (562), MSMA (CAS RN 2163-80-6), naproanilida (571), napropamida (572), naptalam (573), neburon (574), nipiraclofen (CAS RN 99662-11-0), n-metil-glifosato, ácido nonanoico (583), norflurazon (584), ácido oleico (ácidos grasos) (593), orbencarb (595), ortosulfamuron (CAS RN 213464-77-8), orizalin (597), oxadiargilo (599), oxadiazon (600), oxasulfurón (603), oxaziclomefona (604), oxifluorfen (610), pebulato (617), pentaclorofenol (623), pentanocloro (624), pentoxazona (625), petoxamida (627), aceites de petróleo (628), fenmedifam (629), picloram (645), picolinafeno (646), piperofos (650), primisulfuron-metil (657), prodiamine (661), profluazol (CAS RN 190314-43-3), profoxidim (663), prohexadiona calcio (664), prometon (665), prometrin (666), propacloro (667), propanil (669), propazina (672), profam (674), propisocloro (667), propoxicarbazona de sodio (procarbazona-sodio) (679), propizamida (681), prosulfurón (684), piraclonil (pirazogil) (CAS RN 158353-15-2), piraflufeno-etil (691), pirazolinato (692), pirazosulfuron-etilo (694), pirazoxifen (695), piribenzoxim (697), piributicarb (698), piridafol (CAS RN 40020-01-7), piridato (702), piriftalida (704), piriminobac-metil (707), pirimisulfan (CAS RN 221205-90-9), piritiobac-sodio (709), quinmerac (713), quinoclamina (714), rimsulfuron (721), sequestrena, siduron (727), simazina (730), simetrin (732), clorato de sodio (734), sulfentrazona (749), sulfometuron-metil (751), sulfosato (CAS RN 81591- 81-3), sulfosulfurón (752), ácido sulfúrico (755), aceites de alquitrán (758), TCA-sodio (760), tebutam (CAS RN 35256-85-0), tebutiuron (765),

tefurlitriona (CAS RN 473278 -76-1), terbacil (772), terbumeton (774), terbutrin (776), tenilcloro (789), tidiazimin (CAS RN 123249-43-4), tiazafuron (CAS RN 25366-23-8), tiazopir (793), tiobencarb (797), tiocarbazil (807), triaziflam (819), triclopir (827), trietazina (831), triflusulfuron-metil (837), trihidroxitriazina (CAS RN 108-80-5), trinexapac-etil (CAS RN 95266-40-3) y tritosulfurón (843).

Los participantes de la mezcla de compuesto de fórmula I también pueden ser en forma de sales o ésteres, como se menciona por ejemplo en, The Pesticide Manual, 13ª edición (BCPC), 2003. La referencia al acifluorfenato de sodio se aplica también al acifluorfenato, y la referencia al bensulfuron-metilo también se aplica a bensulfuron, etc.

La proporción de mezcla del compuesto de fórmula I de los participantes de la mezcla es preferentemente desde 1:100 a 1000:1.

Las mezclas pueden ser usadas ventajosamente en las formulaciones mencionadas anteriormente (en cuyo caso "ingrediente activo" se refiere a las respectivas mezclas de compuestos de fórmula I con los participantes de la mezcla).

Los compuestos de fórmula I según la invención también pueden utilizarse en combinación con uno o más aliviadores. Así mismo, las mezclas de un compuesto de fórmula I según la invención con uno o más herbicidas también se pueden utilizar en combinación con uno o más aliviadores. Los aliviadores pueden ser benoxacor (63), cloquintocet-mexil (163), ciometrinil (CAS RN 78370-21-5), ciprosumafida (CAS RN 221667-31-8), dicloromida (231), diciclonon (CAS RN 79260-71 -2), fenclorazola-etilo (331), fenclorim

(332), flurazola (386), fluxofenim (399), furilazola (413) y el correspondiente isómero R, isoxadifen-etilo (478), mefenpir-dietilo (506), anhídrido naftálico (CAS RN 81-84-5), y oxabetrinil (598). Particularmente son preferidas las mezclas de un compuesto de fórmula I con benoxacor y un compuesto de fórmula I con cloquintocet-mexil.

Los participes de los compuestos de fórmula I también pueden ser en forma de sales o ésteres, como se menciona por ejemplo en, The Pesticides Manual, 13^a edición (BCPC), 2003. La referencia al cloquintocet-mexil también se aplica al cloquintocet, y la referencia al fenclorazola-etil también se aplica al fenclorazola, etc.

Preferentemente, la proporción de mezcla de los compuestos de fórmula I del aliviador es de 100:1 a 1: 10, especialmente de 20: 1 a 1: 1.

Las mezclas pueden ser ventajosamente utilizadas en las fórmulas mencionadas anteriormente (en cuyo caso "ingrediente activo" se refiere a las respectivas mezclas de compuestos de fórmula I, con el aliviador). Es posible que el aliviador y un compuesto de fórmula I y uno o más herbicida(s), se apliquen simultáneamente. Por ejemplo, el aliviador, un compuesto de fórmula I y uno o más herbicidas(s), podrían aplicarse al lugar de pre-emergencia o pueden ser aplicados a la cosecha de post-emergencia. También es posible que el aliviador y un compuesto de fórmula I y uno o más herbicida (s), se apliquen secuencialmente. Por ejemplo, el aliviador puede ser aplicado antes de sembrar las semillas como un tratamiento de semillas y un compuesto de

fórmula I y uno o más herbicidas, en su caso, podrían aplicarse al lugar de pre-emergencia o pueden ser aplicados a los cultivos de post-emergencia.

Las mezclas preferidas de un compuesto de fórmula I con herbicidas y aliviadores incluyen:

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con una triacina y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con glifosato y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con glufosinato y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y triazina y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y glifosato y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y glufosinato y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y triazina y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona con glifosato y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y glufosinato y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y un protector.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y una triazina y un aliviador.

Las mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y glifosato y un aliviador.

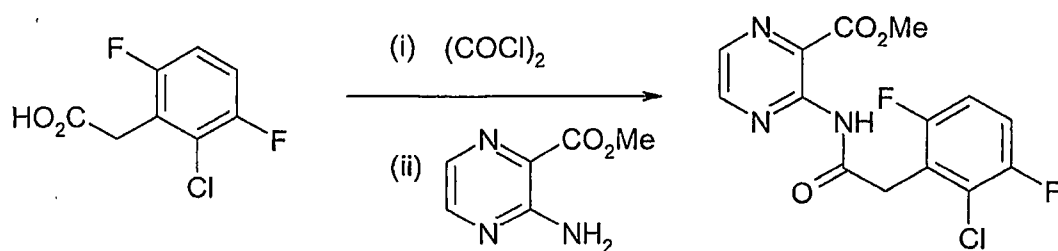
Las mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y glufosinato y un aliviador.

Los siguientes ejemplos ilustran, pero no se limitan, aún más la invención.

Ejemplos de preparación

1. Reacciones que están cubiertos por el Esquema 1

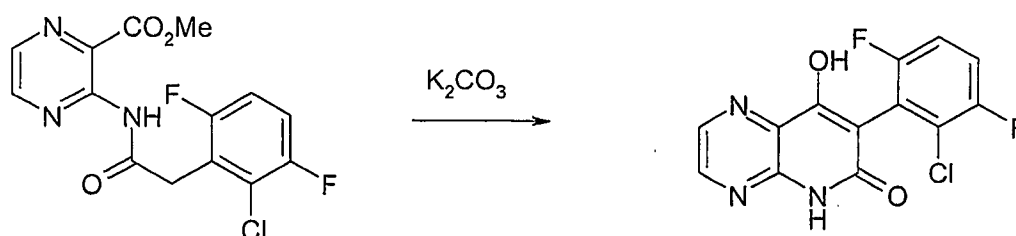
Ejemplo 1.1: Preparación de 3-F2-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-pirazina -2-carboxilic acido metil ester.



El oxalil cloruro (1,30 ml) fue añadido gota a gota a la solución de (2-cloro-3, 6-difluoro-fenil)- ácido acético (3,151 g) en diclorometano (20 ml) y una

gota de *N, N*-dimetilformamida fue añadida para iniciar la reacción. La mezcla de reacción fue agitada a temperatura ambiente durante 1 hora. El disolvente fue evaporado para producir un aceite incoloro que se disolvió en acetonitrilo (30 ml). Esta solución fue dividida en tres partes y cada parte fue añadida a una papilla de 3-amino-pirazina-2-carboxilica acido metil ester (0,76 g) en acetonitrilo (15 ml). La mezcla de reacción fue calentada en el microondas a 130°C durante 40 minutos para producir soluciones de color rojo oscuro que se almacenaron a temperatura ambiente durante 16 horas. Las muestras se combinaron y concentraron para producir 3-[2-(2-cloro-3 ,6-difluoro-fenil)-acetilamino]-pirazina-2-carboxilica acido metil ester como un sólido naranja oscuro (4,15 g). $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): 4,02 (s, 3H), 4,22 (s, 2H), 7.02-7.10 (m, 1H), 7.11-7.17 (m, 1H), 8,41 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 10,8 (s, 1H) ppm.

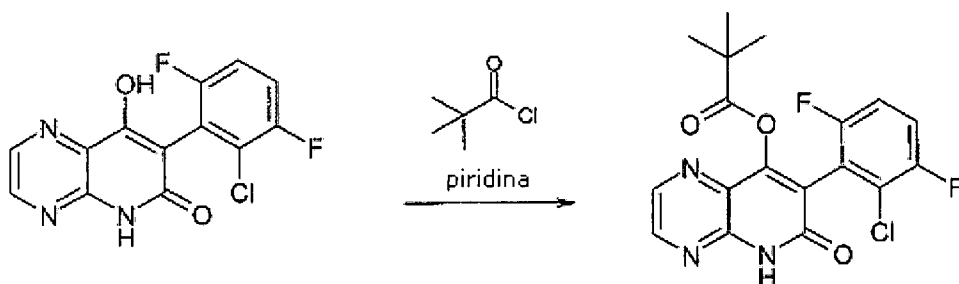
Ejemplo 1.2: Preparación de 7-(2-cloro-3 ,6-difluoro-fenil)-8-hidroxi-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona



El 3-[2-(2-cloro-3 ,6-difluoro-fenil)-acetilamino]-pirazina-2-carboxilica acido metil ester (4,15 g) (Ejemplo 1.1) fue calentado con carbonato de potasio (1,67 g) en *N, N*-dimetilformamida (50 ml) a 110°C durante 2 horas y almacenado a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió agua y la

mezcla de reacción fue acidificada con ácido clorhídrico acuoso (concentrado). Se formó un precipitado que se aisló por filtración. El residuo se lavó sucesivamente con agua y hexano para producir 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-8-hidroxi-5*H*-pirido [2,3-*b*] pirazin-6-ona como un sólido marrón (2,88 g). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): 7.34-7.42 (m, 1H), 7.51-7.59 (m, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,72 (d, 1H), 12,0 (bs, 1H) , 12,4 (s, 1H) ppm.

Ejemplo 1.3: Preparación de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-6-oxo-5,6-dihidro-pirido[2,3-*b*]pirazin-8-il éster

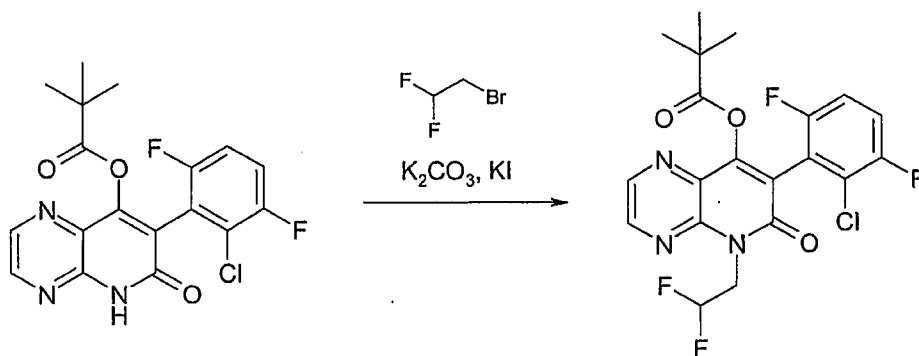


Una mezcla de 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-8-hidroxi-5*H*-pirido [2,3-*b*] pirazin-6-ona (0,20 g) (Ejemplo 1.2), cloruro de trimetilacetil (0,08 ml) y piridina (0,05 ml) en diclorometano (5 ml) fue agitado a temperatura ambiente durante dos horas. La mezcla de reacción fue diluida con acetato de etilo y agua. Las fases fueron separadas. La fase orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio y concentrado para producir un aceite amarillo semi-cristalino. Esto fue triturado en *iso*-hexano para producir 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-6-oxo-5,6-dihidro-pirido [2,3-*b*] pirazin-8-il éster como un polvo marrón pálido (0,113 g). ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 1,21 (s, 9H),

7.08-7.13 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 1H), 8.55-8.57 (m, 2H), 9,51 (s, 1H) ppm.

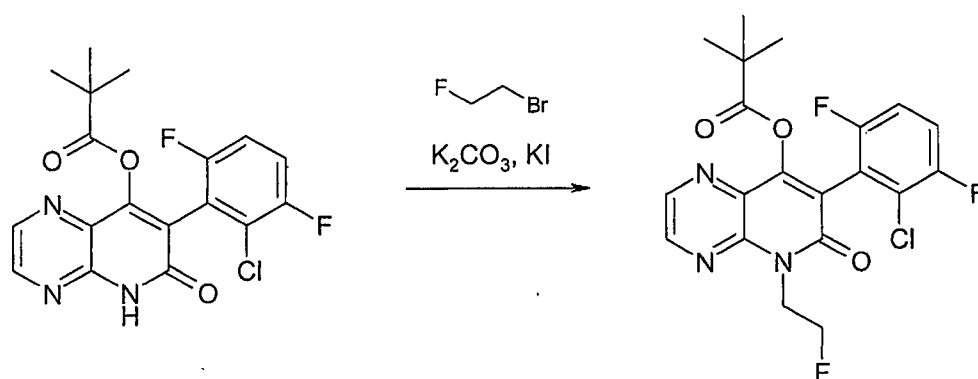
2. Reacciones que están cubiertos por el Esquema 2

Ejemplo 2.1: Preparación de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil) -5-(2,2-difluoro-etil) 6-oxo-5,6-dihidro-pirido [2,3-b]pirazin-8 -il éster (Compuesto N ° A2 de la tabla A)



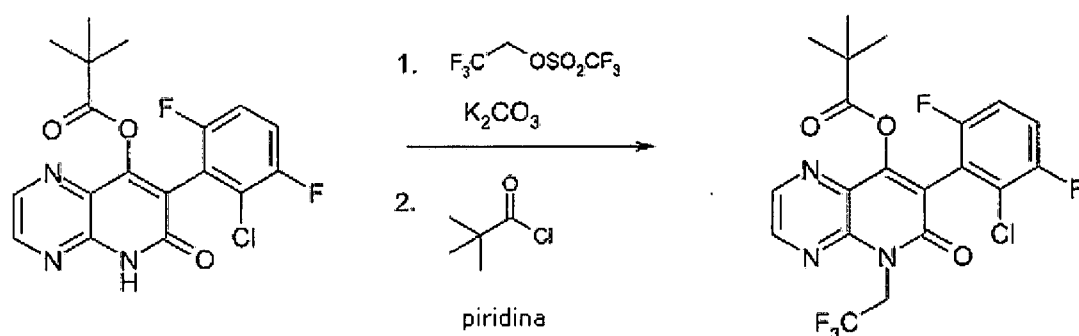
El 1-bromo-2,2-difluoroetano (0,113 g) fue añadido a una mezcla de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-6-oxo-5,6 dihidro-pirido[2,3-b] pirazin-8-il éster (Ejemplo 1,3) (0,126 g), carbonato de potasio (0,044 g) y yoduro de potasio (0,053 g) en acetonitrilo (5 ml). La mezcla de reacción fue calentada en el microondas durante 25 minutos a 120°C. La mezcla de reacción fue concentrada y el residuo fue purificado por medio de cromatografía columna sobre el gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo, 8:2 a 1:1) para dar Compuesto N ° A2 de la tabla A como un sólido amarillo (0,083 g).

Ejemplo 2.2: Preparación de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-5-(2-fluoro-etil)-6-oxo-5,6-dihidro-pirido [2,3-b] pirazin-8-il éster (compuesto N ° C9 de la Tabla C)



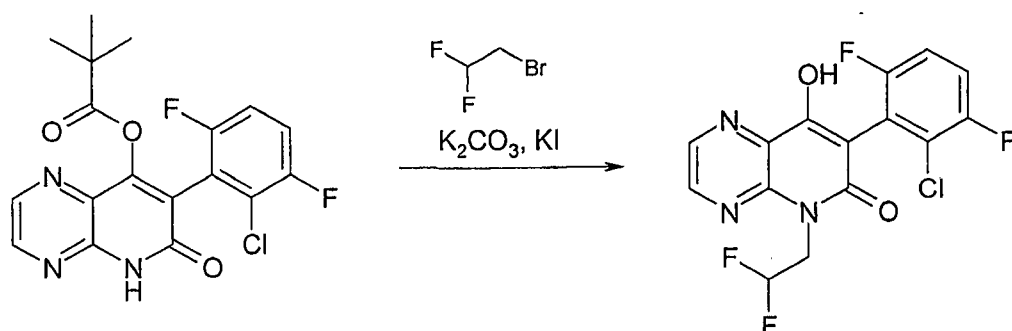
El 2-bromuro fluoroetil fue añadido a una mezcla de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3 ,6-Difluoro-fenil)-6-oxo-5,6-dihidro-pirido [2,3-b] pirazin-8-il éster (Ejemplo 1,3) (0,20 g), carbonato de potasio (0,207 g) y yoduro de potasio (cantidad catalítica) en *N,N*-dimetilformamida (10 ml). La mezcla de reacción fue calentada en el microondas durante 20 minutos a 120°C. La mezcla de reacción fue concentrada y el residuo fue purificado por cromatografía en columna sobre el gel de sílice (eluyente: acetato de etilo/hexano 1:1) para dar el compuesto N ° C9 de la Tabla C como un sólido amarillo (0,103 g).

Ejemplo 2.3: Preparación de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3 ,6-difluoro-fenil)-5-(2,2,2-trifluoro-etil)-6-oxo-5, 6-dihidro-pirido [2,3-b] pirazin-8-il éster (Compuesto N° C8 de la Tabla C)



Una mezcla de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil) - 6-oxo-5,6-dihidro-pirido [2,3-b] pirazin-8-il éster (esto es correcto o la reacción empezó con las especies no protegidas?) (Ejemplo 1,3) (0,10 g), carbonato de potasio (0,053 g) y 2,2,2-trifluoroetil triflato (0,130 g) fue calentada en un horno de microondas en 150°C durante 30 minutos y, a continuación, a 170°C durante 30 minutos. A la mezcla de reacción se le permitió enfriarse a temperatura ambiente y luego fue dividida entre diclorometano y ácido clorhídrico acuoso (2M). Las fases fueron separadas. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio y concentrada. El residuo fue disuelto en diclorometano y se trató con trimetilacetil cloruro (0,063 ml) y piridina (0,061 ml) y se agitó a temperatura ambiente. La mezcla de reacción fue concentrada y el residuo fue purificado por cromatografía en columna sobre el gel de sílice (eluyente: acetona/iso-hexano 0:10 a 1:9) para dar el compuesto N ° C8 de la Tabla C como un sólido de color beige (0,049 g).

Ejemplo 2.4: Preparación de 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-5-(2,2-difluoro-etil) -8 - hidroxí-5H-pirido [2,3-b]pirazin-6-ona (Compuesto N ° B2 de la Tabla B)

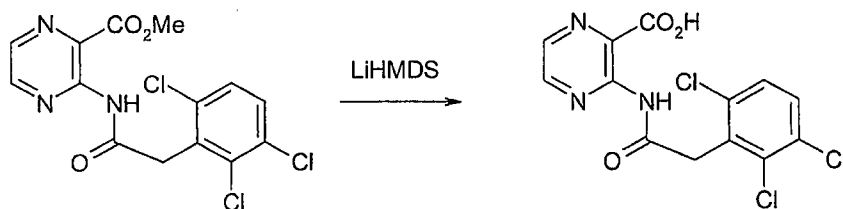


El 1-bromo-2,2-difluoroetano (0,754 g) fue añadido a una mezcla de 2,2-dimetil-ácido propiónico 7-(2-cloro-3,6-difluoro-fenil)-6-oxo-5,6 dihidropirido[2,3-b] pirazin-8-il éster (Ejemplo 1,3) (1,00 g), carbonato de potasio (1,76 g) y yoduro de potasio (cantidad catalítica) en *N,N* dimetilformamida anhídrido (15 ml). La mezcla de reacción fue calentada en el microondas durante 20 minutos a 120°C. A la mezcla de reacción se le permitió enfriarse a temperatura ambiente antes de diluirse con agua y acetato de etilo. Las fases fueron separadas. La fase orgánica fue lavada con agua, secada sobre sulfato de magnesio, y concentrada. El residuo fue disuelto en éter dietílico, y la solución fue lavada con agua. Se separaron las fases y la fase orgánica se concentró para dar el Compuesto N °B2 de la Tabla B como un aceite viscoso de color naranja (0,553 g).

Los compuestos mencionados de las Tablas A a D a continuación, se pueden preparar utilizando métodos análogos a los descritos en el Ejemplo 2.1, 2.2., 2.3 y 2.4.

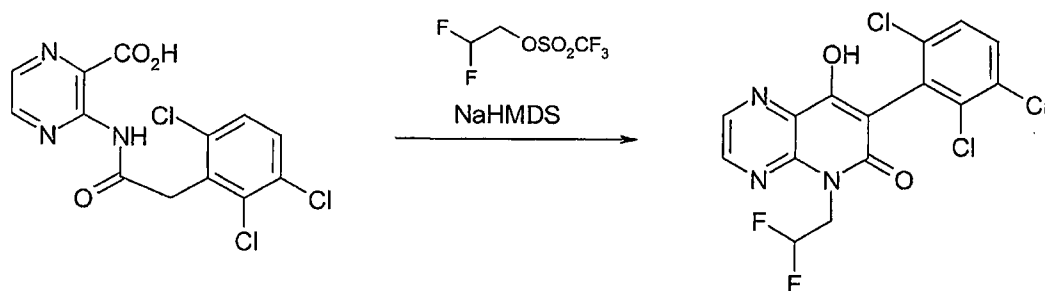
3. Reacciones que están cubiertos por el régimen de 3

Ejemplo 3.1: Preparación de 3-[2-(2,3,6-tricloro-fenil)-acetilaminol]-pirazina-2-ácido carboxílico



Hexametildisilazida de litio ("LiHMDS") (1M en THF) (2 ml) fue añadida gota a gota a la solución de 3-[2-(2,3,6-tricloro-fenil)-acetilamino]-pirazina-2-ácido carboxílico metil éster (0,373 g) (que se hizo como se describe en el Ejemplo 1.1) en tetrahidrofurano anhidro (10 ml). La mezcla de reacción fue agitada durante 30 minutos a temperatura ambiente y luego calentada a reflujo durante tres horas. A la mezcla de reacción se le permitió enfriarse a temperatura ambiente y acidificarse mediante la adición de ácido clorhídrico acuoso (1M). La mezcla se concentró. El residuo fue disuelto en éter y lavado con ácido clorhídrico acuoso (1M). La solución ácida fue extraída con acetato de etilo. Las fracciones orgánicas combinadas fueron secadas sobre sulfato de magnesio y fueron concentradas para dar 3-[2-(2,3,6-tricloro-fenil)-acetilamino]-pirazina-2-ácido carboxílico (0,225 g), que fue llevado al siguiente paso sin mayor purificación.

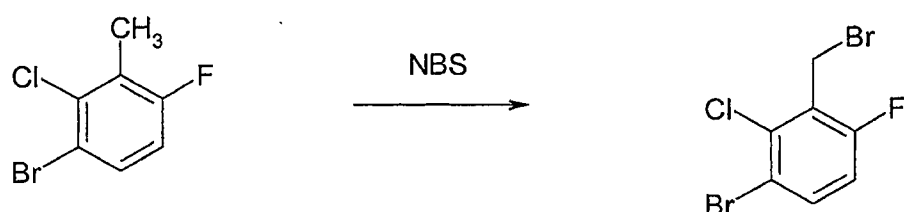
Ejemplo 3.2: Preparaciones alternativas de 5-(2,2-difluoro-etil)-8-hidroxi-7-(2,3,6 - tricloro-fenil)-5H-pirido [2,3-b] pirazin-6-ona (Compuesto N° BI I de la Tabla B)



La hexametildisilazida de sodio ("NaHMDS") (1M en THF) (1,4 ml) fue añadida gota a gota a la solución de 3-[2-(2,3,6-tricloro-fenil)-acetilamino]-pirazina-2- ácido carboxílico (Ejemplo 3,1) (0,225 g) en tetrahidrofurano anhidro (10 ml) en un periodo de 10 minutos. Luego difluoroetil triflato (0,270 g) fue añadido gota a gota y se le permitió a la mezcla de reacción agitarse a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, la mezcla de reacción fue calentada a reflujo durante 6 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente y se acidifico mediante la adición de ácido clorhídrico acuoso (1M). La mezcla se concentró. El residuo fue disuelto en éter y fue lavado con ácido clorhídrico acuoso (1M). La solución ácida fue extraída con acetato de etilo. Las fracciones orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y fueron concentradas. El residuo se purificó por fase reversa HPLC para dar el compuesto N° B11 de la Tabla B (0,034 g).

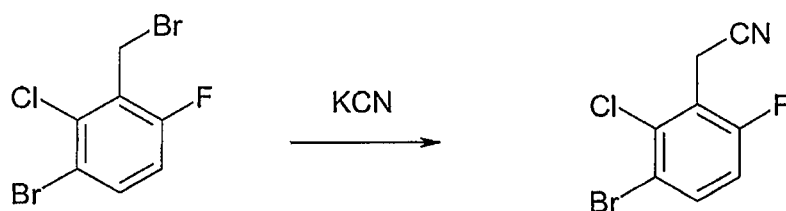
4. Reacciones que están cubiertos por el Esquema 10

Ejemplo 4.1: Preparación de 1-bromo-3-bromometil-2-cloro-4-fluoro-benceno



Una mezcla de 3-bromo-2-cloro-6-fluoro-tolueno (8,0 g), *N*-bromosuccinimida ("NBS") (6,42 g) y peróxido de benzoato (cantidad catalítica) en el tetracloruro de carbono (40 ml) fue calentada a reflujo. Una lámpara halógena de tungsteno de 500 vatios fue utilizada para iniciar la reacción. La mezcla de reacción fue calentada a reflujo e irradiada durante 30 minutos. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente y se filtró a continuación. El filtrado se concentró para dar un aceite incoloro que solidificó de pie para dar 1-bromo-3-bromometil-2-cloro-4-fluoro-benceno como un sólido blanco (10,7 g). $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): 4,64 (d, 2H), 6,94 (t, 1H), 7,58 (dd, 1H) ppm.

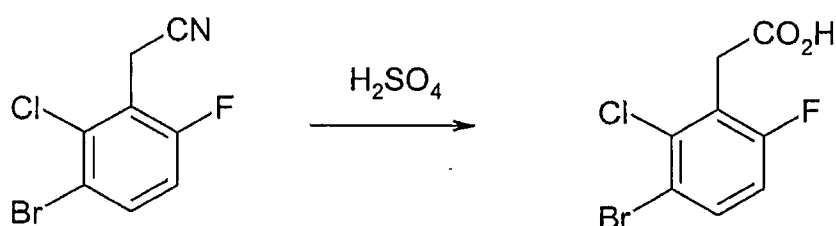
Ejemplo 4.2: Preparación de (3-bromo-2-cloro-6-fluoro-fenil)-acetonitrilo



Una solución de 1-bromo-3-bromometil-2-cloro-4-fluoro-benceno (9,945 g) (Ejemplo 4.2) en etanol absoluto (40 ml) fue añadida gota a gota en la solución de cianuro de potasio (2,38 g) en agua (2 ml) bajo calentamiento por un periodo de 30 minutos. La mezcla de reacción fue calentada a reflujo durante 7 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente

y se almacenó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla fue filtrada y el filtrado concentrado. El residuo fue disuelto en acetato de etilo, secado sobre sulfato de magnesio y se concentró para dar (3-bromo-2-cloro-6-fluorofenil)-acetonitrilo como un aceite amarillo pálido (8,19 g). $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): 3,89 (d, 2H), 7,00 (t, 1H) 5 7,64 (dd, 1H) ppm.

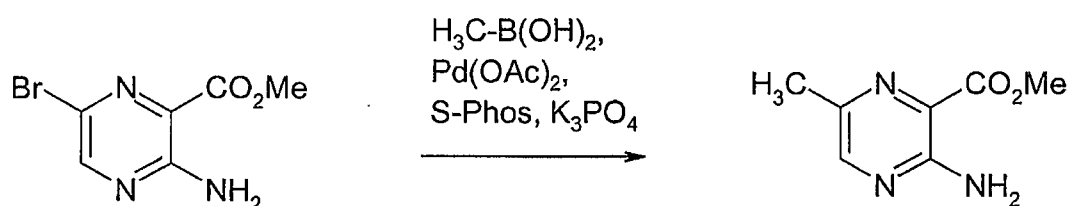
Ejemplo 4.3: Preparación de (3-bromo-2-cloro-6-fluorofenil)-ácido acético



El (3-bromo-2-cloro-6-fluorofenil)-acetonitrilo (8,15 g) (Ejemplo 4.3) fue disuelto en ácido sulfúrico concentrado (50% en peso en agua) (90 ml). La reacción llegó a ser muy caliente y entonces se calentó a reflujo durante 3 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente y se almacenó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla se extrajo con diclorometano dos veces. La fases orgánicas combinadas fueron secadas sobre sulfato de magnesio y se concentraron para dar (3-bromo-2-cloro-6-fluorofenil)-ácido acético como un sólido blanco (8,3 g). $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): 3,94 (d, 2H), 6,94 (t, 1H), 7,56 (dd, 1H) ppm.

5. Reacciones que están cubiertas por el Esquema 12

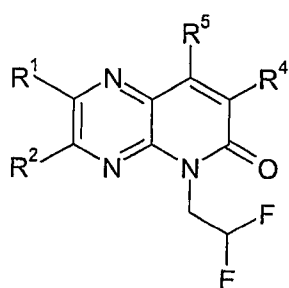
Ejemplo 5.1: Preparación de 3-amino-6-metil-pirazina-2-acido carboxílico metil ester



3-Amino-6-bromo-pirazina-2-acido carboxílico metil ester (1,0 g) (realizados de acuerdo con J. Org. Chem.. (1988), 59 (9), 2052-5), paladio (II), acetato (0,101 g) y 2'-diciclohexilfosfino-2 ,6-dimetoxi-I, I'-bifenil ("S-Fos") se colocaron en un frasco con tolueno (15 ml) y agua (3 gotas). Acido metil boronico (0,394 g) y fosfato de potasio (1,71 g) fueron añadidos y la mezcla de reacción fue calentada a reflujo durante 24 horas. Después de permitir que la mezcla de reacción se enfriara a temperatura ambiente, la mezcla, se diluyó con ácido clorhídrico acuoso (1M) y extraído con acetato de etilo. Los extractos orgánicos combinados se concentraron y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre el gel de sílice (eluyente: éter dietílico) para dar 3-amino-6-metil-pirazine-2-ácido carboxílico metil ester como un sólido amarillo (0,114 g). $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): 2,40 (s, 3H), 3,92 (s, 3H), 6.21 (bs, 2H), 8,03 (s, 1H) ppm.

Tabla A:

Compuestos de fórmula (Ia"), es decir, los compuestos de fórmula (I), donde R3 es 2,2-difluoro-etilo, y R1, R2, R4 y R5 tienen los valores, tal como se definen en la tabla siguiente.



(Ia'')

Compuesto No.	R1	R2	R4	R5	¹ H-NMR (400 MHz CDCl ₃ si no se indica de otra manera)
A1	H	H	2-F ₃ CO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.19 (s, 9H), 4.98 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.33-7.40 (m, 3H), 7.47-7.51 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
A2	H	H	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (s, 9H), 4.98 (dt, 2H), 6.27 (tt, 1H), 7.07-7.13 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A3	H	H	2-Cl-3,6-di-F-fenil	i-Pr-(CO)O-	1.17 (dd, 6H), 2.81 (sept, 1H), 4.98 (dt, 2H), 6.26 (tt, 1H), 7.08-7.14 (m, 1H), 7.21-7.28 (m, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
A4	H	H	2-Cl-3,F ₃ C-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.10 (d, 6H), 2.72 (d, 3H), 5.02 (m, 1H), 6.01-6.40 (tt, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.60 (m, 1H) 8.58 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A5	H	H	2-Cl-6-F-5-Me-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.17 (s, 9H), 2.27 (d, 3H), 3.87 (s, 3H), 7.19 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
A6	H	H	2-Cl-6-F-5-Me-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.10 (d, 3H), 1.11 (d, 3H), 2.27 (d, 3H), 2.77 (sept, 1H), 3.86 (s, 3H),

					7.19 (d, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
A7	H	H	2-Cl-6-F ₃ C-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.07 (d, 3H), 1.14 (d, 3H), 2.76 (sept, 1H), 4.97 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.65 (d, 2H), 8.56 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
A8	H	H	2-Cl-5-F ₃ C-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.16 (s, 9H), 4.97 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.64 (m, 2H), 8.56 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A9	H	H	2,6-di-Cl-4-F ₃ C-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.12 (s, 9H), 4.98 (m, 2H), 6.20 (tt, 1H), 7.68 (s, 2H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A10	H	H	2-Br-4-F ₃ C-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.16 (s, 9H), 4.94-5.02 (dt, 2H), 6.11-6.42 (tt, 1H), 7.40-7.42 (d, 1H), 7.65-7.67 (dd, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.48-8.49 (d, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H).
A11	H	H	2,6-di-Cl-4-F ₃ CO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (s, 9H), 4.96 (m, 2H), 6.22 (tt, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.48 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A12	H	H	2,6-di-Et-4-Me-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.00 (d, 6H), 1.10 (t, 6H), 2.34-2.42 (m, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.63-2.73 (m, 1H), 4.98 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 6.99 (s, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
A13	H	H	2-Cl-5-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.1 (d, 3H), 1.16 (d, 3H), 2.79 (sept, 1H), 4.57 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.03 (dd, 1H), 7.11 (m, 1H), 7.46 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A14	H	H	2-Cl-5-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.18 (s, 9H), 4.96 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.03 (dd, 1H), 7.10 (m, 1H),

					7.47 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
A15	H	H	2,3-di-MeO-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.09 (d, 3H), 1.14 (d, 3H), 2.57 (sept, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 4.95 (m, 2H), 6.25 (tt, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.99 (dd, 1H), 7.09 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.54 (d, 1H).
A16	H	H	2,3-di-MeO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.16 (s, 9H), 3.78 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 4.95 (m, 2H), 6.25 (tt, 1H), 6.77 (d, 1H), 6.98 (dd, 1H), 7.08 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.53 (d, 1H).
A17	H	H	2,4-di-Cl-5-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.22 (s, 9H), 4.95 (dt, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A19	H	H	2-Br-2-Cl-6-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.19 (s, 9H), 4.97 (dt, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.02 (t, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A20	H	H	2,4-di-Cl-5-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.15 (d, 3H), 1.20 (d, 3H), 2.81 (sept, 1H), 4.95 (dt, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A21	H	H	2-Br-2-Cl-6-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.14 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.79 (sept, 1H), 4.96 (dt, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.02 (t, 1H), 7.70 (dd, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A22	H	H	2,4,6-tri-Me-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.00 (d, 6H), 2.07 (s, 6H), 2.29 (s, 3H), 2.68 (sept, 1H), 4.97 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 6.91 (s, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.57

					(d, 1H).
A23	H	H	2-MeO-5-F ₃ CO-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.10 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.76 (sept, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.95 (m, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.06 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
A25	H	H	2,4,6-tri-Me-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.07 (s, 9H), 20.8 (s, 6H), 2.28 (s, 3H), 4.98 (dt, 2H), 6.26 (tt, 1H), 6.91 (s, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).
A26	H	H	2-F ₂ HCO-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.13 (d, 3H), 1.17 (d, 3H), 2.78 (sept, 1H), 4.95 (m, 2H), 6.23 (tt, 1H), 6.46 (dd, 1H), 7.29 (m, 3H), 7.46 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
A27	H	H	2-MeO-5-F ₃ CO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.17 (s, 9H), 3.85 (s, 3H), 4.95 (m, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.67 (dd, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
A28	H	H	2-F ₂ HCO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.19 (s, 9H), 4.95 (m, 2H), 6.23 (tt, 1H), 6.46 (dd, 1H), 7.29 (m, 3H), 7.45 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
A29	-Me	H	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.25 (s, 9H), 2.65 (s, 3H), 4.90-4.50 (m, 2H), 6.10-6.40 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.25 (m, 1H), 8.50 (s, 1H).
A30	H	-Me	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (s, 9H), 2.70 (s, 3H), 5.00 (m, 2H), 6.10-6.40 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.25 (m, 1H), 8.40 (s, 1H).
A31	-Ph	H	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.25 (s, 9H), 5.00 (m, 2H), 6.15-6.40 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.25 (m,

					1H), 7.50 (m, 3H), 8.00 (d, 2H), 9.05 (s, 1H).
A32	H	H	2,3-di-Cl-6-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.18 (s, 9H), 4.92-5.02 (m, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.08 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A33	H	H	2-Cl-4,5-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.22 (s, 9H), 2.95 (m, 2H), 6.35 (tt, 1H), 7.15 (dd, 1H), 7.30 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A34	H	H	2-Cl-6-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (s, 9H), 5.01 (m, 2H), 6.35 (tt, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.32-7.41 (m, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A35	H	-Me	2,6-di-Cl-4-F ₃ C-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.18 (s, 9H), 271 (s, 3H), 5.00 (m, 2H), 6.15-6.37 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.68 (s, 2H), 8.45 (s, 1H).
A36	H	H	2-I-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.15 (s, 9H), 5.02 (m, 2H), 6.37 (tt, 1H), 7.08 (ddd, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.41 (ddd, 1H), 7.96 (dd, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A37	H	H	5-Cl-2-F ₃ C-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.12 (s, 9H), 4.94 (m, 2H), 6.22 (tt, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A38	H	H	5-Br-2-MeO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (s, 9H), 3.76 (s, 3H), 4.94 (m, 2H), 6.24 (tt, 1H), 6.87 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.49 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.54 (d, 1H).
A41	H	H	2-Cl-6-F ₃ C-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.03 (d, 1H), 1.08 (d, 1H), 2.72 (sept, 1H), 4.96 (m, 2H), 6.22 (tt, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.71 (d, 2H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A42	H	H	2,5-di-Cl-	t-Bu-	1.19 (s, 9H), 4.96 (dt,

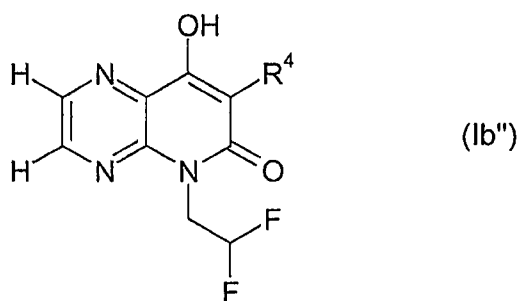
			fenil-	(CO)O-	2H), 6.25 (tt, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.5 (dd, 1H), 7.44 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
A43	H	H	2,5-di-Cl-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.08 (s, 9H), 4.95 (m, 2H), 6.22 (tt, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A44	H	H	4,5-di-F-2-MeO-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.22 (s, 9H), 3.74 (s, 3H), 4.94 (m, 2H), 6.23 (tt, 1H), 6.81 (dd, 1H), 7.07 (t, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).
A45	H	H	2-Et-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.01 (d, 3H), 1.06 (d, 3H), 1.16 (t, 3H), 2.40-2.59 (m, 2H), 2.67-2.74 (m, 1H), 4.91-5.02 (m, 2H), 6.26 (tt, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.21-7.26 (m, 1H), 7.34-7.39 (m, 2H), 8.54 (d, 1H), 8.59 (dm 1H).
A46	H	H	2,3-di-Cl-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.08 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.76 (m, 1H), 4.95 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 7.19 (dd, 1H), 7.28 (t, 1H), 7.54 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A47	H	H	2-Cl-6-F-F ₃ C-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.10 (s, 9H), 4.97 (m, 2H), 6.22 (tt, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.71 (d, 2H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A48	H	H	2,3-di-Cl-6-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (m, 6H), 2.82 (m, 1H), 4.98 (m, 2H), 6.12 (tt, 1H), 7.03 (t, 1H), 7.50 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).

Clave:

s = singlete, d = doblete, t = triplete; dd = doble doblete; ddd = doble doblete; dt = doble triplete; tt = triple triplete, q = cuarteto; sept = septeto, m = multiplete; Me = metilo ; Et = etilo; Pr = propilo; Bu = butilo; F = fenilo.

Tabla B:

Compuestos de fórmula (Ib''), es decir, los compuestos de fórmula (I) en donde R1 y R2 son hidrógeno, R3 es 2,2-difluoro-etilo, R5 es hidroxilo, R4 y tiene los valores como se definen en el tabla siguiente.



Compuesto No.	R4	¹ H-NMR (400 MHz, CDCL ₃ , si no se indica de otra manera)
B1	2-Cl-3-F ₃ C-fenil-	5.00 (m, 2H), 6.30 (tt, 1H), 7.05 (m, 2H), 7.21 (m, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).
B2	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	4.92 (dt, 2H), 6.09-6.40 (tt, 1H), 7.08-7.14 (m, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
B3	2-Cl-5-F ₃ C-fenil-	4.92 (m, 2H), 6.94 (tt, 1H), 7.59-7.67 (m, 3H), 8.51 (d, 1H), 8.71 (d, 1H).
B4	2,6-di-Et-4-Me-fenil-	1.00 (d, 3H), 1.10 (t, 3H), 2.34-2.42 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.63-2.73 (m, 1H), 4.98 (dt, 2H), 6.25 (tt, 1H), 6.99 (s, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
B5	2,4,6-tri-Me-fenil-	2.11 (s, 6H), 2.31 (s, 3H), 4.92 (dt, 2H), 6.24 (tt,

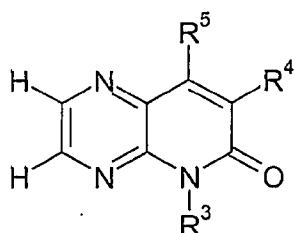
		1H), 6.98 (s, 2H), 7.87 (s, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
B6	3-Br-2-Cl-6-F-fenil-	4.92 (dt, 2H), 6.23 (tt, 1H), 7.03 (t, 1H), 7.69 (dd, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.71 (d, 1H).
B7	2-Cl-5-F-fenil-	4.91(m, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.48 (dd, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).
B8	2-MeO-5-F ₃ CO-fenil-	3.85 (s, 2H), 4.90 (m, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).
B9	2-Cl-6-F-3-O ₂ N-fenil-	(CD ₃ OD): 4.80 (m, 2H), 6.18 (tt, 1H), 7.42 (m, 1H), 8.03 (m, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.74 (d, 1H).
B10	5-Cl-2-F ₃ C-fenil-	4.89 (dt, 2H), 6.20 (tt, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
B11	2,3,6-tri-Cl-fenil-	(CD ₃ OD): 4.85 (m, 2H), 6.16 (m, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
B12	5-Br-2-MeO-fenil-	3.78 (s, 3H), 4.90 (m, 2H), 6.23 (tt, 1H), 6.90 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
B13	2-Cl-6-F ₃ C-fenil-	4.96 (dt, 2H), 6.20 (tt, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.73 (d, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
B14	2,3-di-Cl-6-F-fenil-	4.92 (2H, m), 6.25 (1H, m), 7.20 (1H, dd), 7.53 (1H, dd), 8.52 (1H, d), 8.71 (1H, d).
B15	2,3-di-Cl-fenil-	4.91 (m, 2H), 6.24 (tt, 1H), 7.31 (m, 2H), 7.54 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).

Clave:

s = singlete, d = doblete, t = triplete; dd = doble doblete; ddd = doble doblete; dt = doble triplete; tt = triple triplete; m = multiplete; Me = metilo ; Et = etilo.

Tabla C:

Compuestos de fórmula (Ia'), es decir, los compuestos de fórmula (I) donde R1 y R2 son hidrógeno y R3, R4 y R5 tienen los valores como se define en la siguiente tabla.



(Ia')

Compuesto No.	R3	R4	R5	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃ si no se indica de otra manera)
C1	4-cloro-butil-	2- F ₃ CO-fenil	t-Bu-(CO)O-	1.17 (s, 9H), 1.83-2.00 (m, 4H), 3.57-3.63 (m, 2H), 4.52-4.60 (m, 2H), 7.31-7.40 (m, 3H), 7.42-7.49 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C2	3,3,3-trifluoro-propil-	2- F ₃ CO-fenil	t-Bu-(CO)O-	1.17 (s, 9H), 2.56-2.69 (m, 2H), 4.74-4.87 (m, 2H), 7.39-7.41 (m, 3H), 7.43-7.50 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C3	4,4,4,3,3-pentafluoro-butil-	2- F ₃ CO-fenil	t-Bu-(CO)O-	1.18 (s, 9H), 2.50-2.66 (m, 2H), 4.80-4.93 (m, 2H), 7.33-7.41 (m, 3H), 7.44-7.51 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C4	4-cloro-	2-Cl-3,6-di-	t-Bu-	1.24 (s, 9H), 1.90-2.04

	propil-	F-fenil-	(CO)O-	(m, 4H), 3.64 (t, 2H), 4.60 (t, 2H), 7.09-7.16 (m, 1H), 7.22-7.29(m, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C5	3,3,3-trifluoro-propil-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.24 (s, 9H), 2.29-2.38 (m, 2H), 3.69 (t, 2H), 4.72 (, 2H), 7.09-7.16 (m, 1H), 7.22-7.29 (m, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C6	3,3,3-trifluoro-propil-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (s, 9H), 2.59-2.71 (m, 2H), 4.79-4.86 (m, 2H), 7.07-7.13 (m, 1H), 7.20-7.27 (m, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C7	4,4,4,3,3-pentafluoro-butyl-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (s, 9H), 2.53-2.68 (m, 2H), 4.84-4.90 (m, 2H), 7.07-7.14 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C8	2,2,2-trifluoro-etil-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (t, 9H), 5.28 (q, 2H), 7.07-7.28 (n, 2H), 8.58 (m, 1H), 8.61 (m, 1H).
C9	2-fluoro-etil	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (s,9H), 4.77 (t, 1H), 4.87-4.93 (m, 2H), 4.94-4.99 (m, 1H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C10	2,2,2-trifluoro-etil-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.16-1.17 (d, 6H), 2.78-2.85 (m, 1H), 5.25-5.31 (m, 2H), 7.07-7.12 (m, 1H), 7.21-7.26 (m, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C11	4,4,-difluoro-but-3-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (s, 9H), 2.51 (q, 2H), 4.21-4.32 (m, 1H), 4.59 (t, 2H), 7.06-7.27 (m, 1H), 7.19-7.27 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C12	3,4,4-trifluoro-but-3-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (s, 9H), 2.78-2.89 (m, 2H), 4.79 (t, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.19-

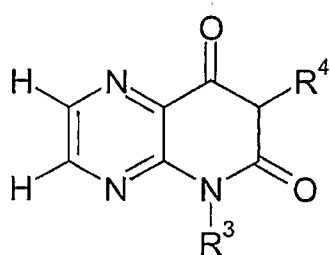
				7.27 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C13	3,3-dicloro-prop-2-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.21 (s, 9H), 5.28 (d, 2H), 6.06 (t, 1H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C14	3,3-dicloro-prop-2-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.17 (dd, 6H), 2.80 (sept, 1H), 5.28 (d, 2H), 6.07 (t, 1H), 7.07-7.12 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C15	2-fluoro-prop-2-en-1-il-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	1.20 (s, 9H), 4.47 (dd, 1H), 4.76 (dd, 1H), 5.29 (d, 2H), 7.05-7.12 (m, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C16	2-fluoro-prop-2-en-1-il-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.17 (dd, 6H), 2.81 (sept, 1H), 4.49 (dd, 1H), 4.77 (dd, 1H), 5.29 (d, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C17	2-cloro-prop-2-en-1-il-	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.17 (dd, 6H), 2.81 (sept, 1H), 5.20 (d, 1H), 5.32 (s, 2H), 5.35 (d, 1H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C18	3,3-difluoro-prop-2-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	1.17 (dd, 6H), 2.81 (sept, 1H), 4.57-4.67 (m, 1H), 5.17 (s, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).

Clave:

s = singlete, d = doblete, t = triplete; dd = doble doblete; q = cuarteto; sept = septeto, m: multiplete; Pr = propilo; Bu = Butilo.

Tabla D:

Compuestos de fórmula (Ib'), es decir, los compuestos de fórmula (I) en donde R1 y R2 son hidrógeno, R5 es hidroxilo, y R3 y R4 tienen los valores como se definen en el tabla siguiente.



(Ib')

Compuesto No.	R3	R4	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃ si no se indica de otra manera)
D1	2,2,2-trifluoroetil	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	5.27-5.34 (m, 2H), 7.21-7.26 (m, 1H), 7.35-7.41 (m, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).
D2	2-fluoroetil	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	4.74 (t, 1H), 4.83-4.88 (m, 2H), 4.89-4.95 (m, 1H), 7.06-7.13 (m, 1H), 7.18-7.25 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
D3	3,3-dicloro-prop-2-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	(d ₆ -DMSO): 5.02 (d, 2H), 6.19 (t, 1H), 7.31-7.37 (m, 1H), 7.47-7.54 (m, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.79 (d, 1H).
D4	3,3-dicloro-prop-2-en-1-il	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	(d ₆ -DMSO): 4.73-4.85 (m, 1H), 4.98 (d, 2H), 7.36-7.42 (m, 1H), 7.53-7.60 (m, 1H), 8.69 (d, 1H), 8.86 (d, 1H).

Clave:

d = doblete, t = triplete, m = multiplete.

Ejemplos Biológicos

Ejemplo B1: Acción Herbicida

Las semillas de una variedad de especie de ensayo se siembran en la norma de esterilización de semillas en el suelo cada una con 96 células. Después de la cultivación por 8 a 9 días de cultivo (de post-emergencia) en condiciones controladas en una cámara climática (cultivo en 23/17°C, día/noche, 13 horas de luz; 50-60% de humedad), las plantas fueron tratadas con una solución acuosa atomizada de 1000 mg/l del ingrediente activo disuelto en 10% de DMSO (dimetil sulfóxido, CAS RN 67-68-5) como disolvente, lo que equivale a 1000 g/ha. Las plantas fueron cultivadas en la cámara climática después de la aplicación a (24/19°C, día/noche, 13 horas de luz; 50-60% de humedad) y agua, dos veces al día. Después de 9 días hasta que la prueba fue evaluada (10 = número total de daños a la planta, 0 = sin daño a la planta)

Tabla B1: Aplicación post-emergencia

Comp. No.	Tasa (g/ga)	STEME	NAAOF	AMARE	SOLNI
A1	1000	7	8	0	6
A2	1000	9	9	4	6
A3	1000	9	7	6	5
A5	1000	7	5	4	2
A6	1000	7	7	5	0
A7	1000	8	7	4	5
A8	1000	7	7	6	6
B1	1000	5	6	0	6
B2	1000	8	8	6	5
C2	1000	0	0	0	4
C4	1000	1	0	0	4
C6	1000	3	0	0	1
C7	1000	0	0	0	3

STEME = *Stellaria media*; NAAOF = *Nasturtium officinale*; AMARE = *Amarantus retrofractus*; SOLNI = *Solanum nigrum*.

Los compuestos N ° CI, C3 y C5 se pusieron a prueba utilizando el mismo protocolo y no mostró ningún daño o muy poco daño a las plantas de prueba en las condiciones de prueba.

Ejemplo B2: Acción Herbicida

Las semillas de una variedad de especie de ensayo se sembraron en macetas en suelo estándar. Después de 8 días de cultivo (de post-emergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche, 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas fueron rociadas con una solución acuosa atomizada derivada de la formulación del ingrediente activo técnico en acetona/agua (50:50) solución con 0,5% de Tween 20 (polioxietileno monolaurato de sorbitán, CAS RN 9005-64-5). Las plantas de prueba fueron cultivadas en un invernadero bajo condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche, 14 horas de luz; 65% de humedad) y agua, dos veces al día. Después de 13 días, se evaluó la prueba (10 = número total de daños a la planta; 0 = sin daño a la planta).

Tabla B2: Aplicación post-emergencia

Comp. No.	Tasa (g/ga)	SOLNI	AMARE	SETFA	ECHCG	IPOHE
A9	1000	10	10	9	7	-
A10	1000	9	10	3	4	5
A11	1000	10	10	9	9	10
A12	1000	10	3	10	9	9
A13	1000	10	10	9	8	10
A14	1000	10	10	9	7	10
A15	1000	10	6	9	8	9
A16	1000	10	8	8	3	7

A17	1000	5	3	7	6	0
A19	1000	10	10	8	7	9
A20	1000	9	10	8	7	7
A23	1000	10	10	9	8	9
A25	1000	10	7	7	7	8
A26	1000	5	10	2	2	5
A27	1000	9	9	7	7	7
A28	1000	10	9	3	1	8
A32	1000	10	10	7	4	9
A33	1000	10	10	7	4	7
A34	1000	10	10	6	4	9
A35	1000	5	0	5	3	2
A37	1000	5	6	7	5	7
A38	1000	9	10	8	6	6
A41	1000	10	10	9	8	9
A42	1000	10	10	7	6	9
A43	1000	9	10	9	8	9
A44	1000	10	9	9	7	6
A45	1000	10	10	8	5	9
B3	250	9	10	7	7	8
B4	1000	10	7	9	8	10
B5	1000	10	7	8	8	10
B6	1000	10	10	8	8	10
B7	1000	9	10	7	7	9
B8	1000	9	10	9	9	9
B9	1000	9	9	7	8	8
B10	1000	10	10	9	9	10
B11	1000	10	10	9	8	10
B12	1000	9	9	6	6	6
B13	1000	10	10	9	9	10
B14	1000	10	10	7	6	10
C8	1000	10	10	4	1	10
C9	1000	4	7	0	0	5
C10	1000	10	10	6	3	10
C11	1000	2	5	0	0	0
C12	1000	3	6	0	0	1
C13	1000	3	0	0	0	1
C14	1000	8	8	0	0	1
D1	1000	10	10	6	5	10
D2	1000	7	6	2	1	5
D3	1000	7	9	3	0	7

SOLNI = *Solanum nigrum*; AMARE = *Amarantus retroflexus*; SETFA = *Setaria faberi*; ECHCG = *Echinocloa crus-galli*; IPOHE = *Ipomea hederaceae*.

Los compuestos N ° A29, A30 y A31 se pusieron a prueba utilizando el mismo protocolo y no mostró ningún daño o muy poco daño a las plantas de prueba en las condiciones de prueba.

Ejemplo B3: Acción Herbicida

Las semillas de una variedad de especie de ensayo se siembran en un compuesto esterilizado en pequeñas macetas. Después de siete días de cultivo (de post-emergencia) en condiciones controladas en el invernadero (a 24/16°C, día/noche, 14 horas de luz; 65% de humedad) las plantas fueron rociadas con 1 mg del ingrediente activo, formulado en solución 2,5 ml acetona/agua (50:50), la cual es equivalente a 1000 g/ha. Una vez que el follaje se seca, las macetas se mantuvieron en el invernadero (a 24/16°C, día/noche, 14 horas de luz; 65% de humedad), y fueron regadas dos veces al día. Después de 13 días se evaluó la prueba (10 = número total de daños a la planta, 0 = sin daño a la planta).

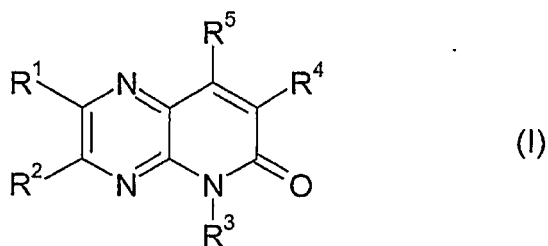
Tabla B3: Aplicación post-emergencia

Comp. No.	Tasa (g/ga)	AMARE	ALOMY	DIGSA	CHEAL
A4	1000	10	0	7	10
A36	1000	10	8	5	10

AMARE = *Amarantus retroflexus*; ALOMY = *Alopecurus myosuroides*; DIGSA = *Digitaria sanguinalis*; CHEAL = *Chenopodium album*.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de formula (I)



donde

R1 y R2 son independientemente hidrógeno, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, halo, ciano, hidroxil, C1-C4alcoxi, C1-C4alquiltio, arilo o arilo sustituido por uno a cinco R6, que puede ser el mismo o diferente, o heteroaril o heteroaril sustituido por uno a cinco R6, que pueden ser iguales o diferentes; R3 es C1-C4haloalquil, C2-C4haloalquenil o C2-C4haloalquinil; R4 es arilo o arilo sustituido por uno a cinco R8, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroaril o heteroaril sustituido por uno a cuatro R8, que pueden ser iguales o diferentes;

R5 es hidroxil o un grupo que puede ser metabolizado al grupo hidroxil;

cada R6 y R8 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1-C4haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, hidroxil, C1-C10alcoxi, C1-C4haloalcoxi, C1-C10alcoxi-C1-C4alquil, C3-C7cicloalquil, C3-C7cicloalcoxi, C3-C7cicloalquil-C1-C4alquil, C3-C7cicloalquil-C1-C4alcoxi, C1-C6alquilcarbonil, formil, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4alquilcarboniloxil, C1-C10alquiltio, C1-C4haloalquiltio, C1-C10alquilsulfinil, C1-C4haloalquilsulfimil-,

C1-C10alquilsulfonil-, C1-C4haloalquilsulfonil-, amino, C1-C10alquilamino-, di-C1-C10alquilamino-, C1-C10alquilcarbonilamino-, arilo o arilo sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril o heteroaril sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, aril-C1-C4alquil o aril-C1-C4alquil-donde la fracción arilo es sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril-C1-C4alquil - o heteroaril-C1-C4alquil donde la fracción heteroaril es sustituida por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, ariloxi-o ariloxi sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, heteroariloxi o heteroariloxi - sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, ariltio- o ariltio-sustituido por uno a tres R13, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroariltio o heteroariltio-sustituido por uno a tres R13, que puede ser el mismo o diferentes; y

cada R13 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi, o una sal o *N*-óxido

2. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1 donde R1 es hidrogeno, C1-C4alquil, C1-C4 haloalquil, halo, ciano, hidroxí o C1-C4alcoxi.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2 donde R2 es hidrogeno, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, halo, ciano, hidroxí o C1-C4alcoxi.

4. Un compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 3 donde R3 es C1-C4haloalquil o C2-C4haloalquenil.
5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 4 donde R3 es 2,2-difluoro-etil.
6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 5 donde R4 es aril o aril sustituto por uno a cinco R8, el cual puede ser igual o diferente.
7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 6 donde R5 es R5 es hidroxil, R9-oxi-, R10-carboniloxi-, tri-R11-sililoxi- o R12-sulfoniloxi-, donde
 R9 es C1-C10alquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil o aril-C1-C4alquil- o-aril-C1-C4alquil donde la fracción arilo es sustituida por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi;
 R10 es C1-C10alquil, C3-C10cicloalquil, C3-C10cicloalquil-C1-C10alquil-, C1-C10haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, C1-C4alcoxi-C1-C10alquil-, C1-C4alquiltio-C1-C4alquil-, C1-C10alcoxi, C1-C10alqueniloxi, C2-C10alquiniloxi, C1-C10alquiltio-, N-C1-C4alquil-amino-, N,N-di-(C1-C4alquil)-amino-, arilo o arilo sustituido por uno a tres R14, que pueden ser la misma o diferentes, heteroaril o heteroaril sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o

diferentes, aril-C1-C4alquil o aril-C1-C4alquil- donde la fracción arilo es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroaril-C1-C4alquil o heteroaril-C1-C4alquil- donde la fracción de heteroaril es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariloxi-o-ariloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, heteroariloxi-o-heteroariloxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, ariltio-o-ariltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, o heteroariltio - o-heteroariltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes;

cada R11 es independientemente C1-C10alquil o fenilo o fenilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi;

R12 es C1-C10alquil, C1-C10haloalquil, o fenilo o fenilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi; y

cada R14 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1-C4haloalquil, C1-C10alkoxi, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4haloalcoxi, C1-C10alquiltio-, C1-C4haloalquiltio-, C1-C10alquilsulfinil-, C1-C10haloalquilsulfinil-, C1-C4alquilsulfonyl-, C1-C4haloalquilsulfonyl-, arilo o arilo sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C5haloalquil o C1-C6alcoxi, o heteroaril o heteroaril sustituido por uno a cuatro sustituyentes seleccionados independientemente de halo, ciano, nitro, C1-C6alquil, C1-C6haloalquil o C1-C6alcoxi.

8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 7 donde cada R6 es independientemente halo, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, C1-C4alcoxi o C1-C4haloalcoxi.
9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 8 donde cada R8 es independientemente halo, ciano, nitro, C1-C10alquil, C1-C4haloalquil, C1-C10alcoxi, C1-C4alcoxycarbonil-, C1-C4haloalcoxi, C1-C10alquitio-, C1-C4haloalquitio-, C1-C10alquisulfinil-, C1-C4haloalquisulfinil-, C1-C10alquisolfonil- o C1-C4haloalquilsulfonil.
10. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 9 donde R9 es C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, aril-C1-C4alquil- o aril-C1-C4alquil- donde la fracción de aril es sustituida por uno o más R14, los cuales pueden ser los mismos o diferentes.
11. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 10 donde R10 es C1-C10alquil, C3-C10cicloalquil, C1-C10haloalquil, C2-C10alquenil, C2-C10alquinil, C1-C4alcoxi-C1-C10alquil-, C1-C4alquitio-C1-C4alquil-, C1-C10alkoxi, C1-C10alquitio-, N-C1-C4alquil-amino-, N, N-di-(C1-C4alquil)-amino-, fenilo o fenilo sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, bencil o bencil donde la fracción de fenilo es sustituida por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, tienil o tienil sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, piridil o piridil sustituido

por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, fenoxi o fenoxi sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes, o feniltio o feniltio sustituido por uno a tres R14, que pueden ser iguales o diferentes.

12. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 11 donde cada R11 es independientemente C1-C4alquil.

13. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 12 donde R12 es C1-C4alquil o C1-C4haloalquil.

14. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 13 donde cada R13 es independientemente halo, nitro, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil o C1-C4 alcoxi.

15. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 14 donde cada R14 es independientemente halo, nitro, C1-C4alquil, C1-C4haloalquil, C1-C4alcoxi o C1-C4haloalcoxi.

16. Un método para controlar las plantas el cual comprende aplicar a las plantas o al lugar de estas una cantidad efectiva de herbicida de un compuesto de formula (I) como se definió en una de las reivindicaciones de la 1 a la 15.

17. Una composición herbicida la cual comprende una cantidad herbicidalmente efectiva de un compuesto de formula (I) como se definió en cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 15 en adición a las adyuvantes de la formulación.

18. Una composición herbicida la cual comprende una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto de formula (I) como se definió en cualquiera de las reivindicaciones de la 1 a la 15, opcionalmente una o más herbicidas, y opcionalmente uno o más aliviadores.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/GB2007/004662

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D471/04 A01N43/90 A01P13/00

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)

C07D A01N A01P

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, 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	US 5 491 126 A (SELBY THOMAS P [US]) 13 February 1996 (1996-02-13) claims; tables	1-18
A	WO 2005/010000 A (BASF AG [DE]; WAGNER OLIVER [DE]; GROTE THOMAS [DE]; BLETNER CARSTEN) 3 February 2005 (2005-02-03) cited in the application claims; examples	1-18
A	WO 2005/123698 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; CROWLEY PATRICK JELF [GB]; MUELLER UR) 29 December 2005 (2005-12-29) the whole document	1-18

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family 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
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring 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.
- *G* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

3 March 2008

Date of mailing of the international search report

12/03/2008

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2260 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31-651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Bosma, Peter

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/GB2007/004662

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5491126 A	13-02-1996	NONE	
WO 2005010000 A	03-02-2005	AU 2004259269 A1 BR PI0412704 A CA 2532917 A1 CN 1826341 A EP 1648890 A2 KR 20060063892 A MX PA06000034 A US 2006160811 A1	03-02-2005 26-09-2006 03-02-2005 30-08-2006 26-04-2006 12-06-2006 21-03-2006 20-07-2006
WO 2005123698 A	29-12-2005	EP 1771423 A1	11-04-2007

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
19 June 2008 (19.06.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/071918 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 471/04 (2006.01) *A01P 13/00* (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)

6EY (GB). TURNBULL, Michael, Drysdale [GB/GB];
Syngenta Limited, Jealott's Hill International Research
Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY (GB).

(21) International Application Number:
PCT/GB2007/004662

(74) Agents: INTELLECTUAL PROPERTY DEPART-
MENT et al.; Syngenta Limited, P.O. Box 3538, Jealott's
Hill Research Centre, Bracknell RG42 6YA (GB).

(22) International Filing Date:
6 December 2007 (06.12.2007)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0624760.5 12 December 2006 (12.12.2006) GB

(71) Applicant (for all designated States except US): SYN-
GENTA LIMITED [GB/GB]; European Regional Centre,
Priestley Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey
GU2 7YH (GB).

(72) Inventors; and

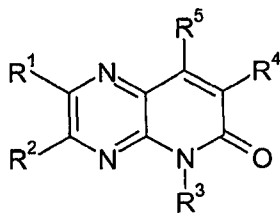
(75) Inventors/Applicants (for US only): CARTER, Neil,
Brian [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealott's Hill Interna-
tional Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY
(GB). CORDINGLEY, Matthew, Robert [GB/GB]; Syn-
genta Limited, Jealott's Hill International Research Centre,
Bracknell, Berkshire RG42 6EY (GB). CROWLEY,
Patrick, Jeff [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealott's Hill
International Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG,
ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW,
MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL,
PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA,
ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:
— with international search report

(54) Title: PYRIDO-PYRAZINE DERIVATIVES USEFUL AS HERBICIDAL COMPOUNDS



(I)

(57) Abstract: The present invention relates to compounds of formula (I): wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as defined in claim 1; or a salt or N-oxide thereof. Furthermore, the present invention relates to processes for preparing compounds of formula (I), to methods of controlling plants and compositions comprising compounds of formula (I).

WO 2008/071918 A1

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/GB2007/004662

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

INTELLECTUAL PROPERTY DEPARTMENT
Syngenta Limited
P.O. Box 3538
Jealott's Hill Research Centre
Bracknell RG42 6YA
ROYAUME-UNI

Date of mailing (day/month/year)

04 January 2008 (04.01.2008)

Applicant's or agent's file reference

PPD 71412/WO

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/GB2007/004662

International filing date (day/month/year)

06 December 2007 (06.12.2007)

International publication date (day/month/year)

Not yet published

Priority date (day/month/year)

12 December 2006 (12.12.2006)

Applicant

SYNGENTA LIMITED et al

1. By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
2. *(If applicable)* The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, **on the date of mailing of this Form**, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, **the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c)** which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
3. *(If applicable)* An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority datePriority application No.Country or regional Office
or PCT receiving OfficeDate of receipt
of priority document

12 December 2006 (12.12.2006)

0624760.5

GB

17 December 2007 (17.12.2007)

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Nora Lindner

e-mail PT02.PCT@WIPO.INT

Telephone No. +41 22 338 74 02

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Form PCT/IB/304 (October 2005)

1/DID8UK2Y0

RECORD

PCT

REQUEST

The undersigned requests that the present international application be processed according to the Patent Cooperation Treaty.

For receiving Office use only

PCT/GB 2007 / 0 0 4 6 6 2

International Application No.

0 6 DECEMBER 2007

International Filing Date

06-12-07.

UK Intellectual Property Office
PCT International Application

Name of receiving Office and "PCT International Application"

Applicant's or agent's file reference
(if desired) (12 characters maximum) PPD 71412/WO

Box No. I TITLE OF INVENTION	
HERBICIDAL COMPOUNDS	
Box No. II APPLICANT ☐ This person is also inventor	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)	
SYNGENTA LIMITED European Regional Centre Priestley Road Surrey Research Park Guildford, Surrey GU2 7YH, United Kingdom (GB)	
Telephone No. +44 (0)1344 414456	
Facsimile No. +44 (0)1344 481112	
Applicant's registration No. with the Office	
State (that is, country) of nationality: GB	State (that is, country) of residence: GB
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☒ all designated States except the United States of America ☐ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)	
☒ Further applicants and/or (further) inventors are indicated on a continuation sheet.	
Box No. IV AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE; OR ADDRESS FOR CORRESPONDENCE	
The person identified below is hereby/has been appointed to act on behalf of the applicant(s) before the competent International Authorities as: ☒ agent ☐ common representative	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)	
Intellectual Property Department Syngenta Limited PO Box 3538 Jealott's Hill Research Centre Bracknell, RG42 6YA, UNITED KINGDOM	
Telephone No. +44 (0)1344 414456	
Facsimile No. +44 (0)1344 481112	
Agent's registration No. with the Office	
☐ Address for correspondence: Mark this check-box where no agent or common representative is/has been appointed and the space above is used instead to indicate a special address to which correspondence should be sent.	

Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)*If none of the following sub-boxes is used, this sheet should not be included in the request.*

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)

CARTER, Neil Brian
Syngenta Limited,
Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell,
Berkshire, RG42 6EY, United Kingdom (GB)

This person is:

- ☐ applicant only
☒ applicant and inventor
☐ inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)

Applicant's registration No. with the Office

State (that is, country) of nationality:
GBState (that is, country) of residence:
GB

This person is applicant for the purposes of:

- ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)

CORDINGLEY, Matthew Robert
Syngenta Limited,
Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell,
Berkshire, RG42 6EY, United Kingdom (GB)

This person is:

- ☐ applicant only
☒ applicant and inventor
☐ inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)

Applicant's registration No. with the Office

State (that is, country) of nationality:
GBState (that is, country) of residence:
GB

This person is applicant for the purposes of:

- ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)

CROWLEY, Patrick Jelf
Syngenta Limited,
Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell,
Berkshire, RG42 6EY, United Kingdom (GB)

This person is:

- ☐ applicant only
☒ applicant and inventor
☐ inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)

Applicant's registration No. with the Office

State (that is, country) of nationality:
GBState (that is, country) of residence:
GB

This person is applicant for the purposes of:

- ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)

TURNBULL, Michael Drysdale
Syngenta Limited,
Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell,
Berkshire, RG42 6EY, United Kingdom (GB)

This person is:

- ☐ applicant only
☒ applicant and inventor
☐ inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)

Applicant's registration No. with the Office

State (that is, country) of nationality:
GBState (that is, country) of residence:
GB

This person is applicant for the purposes of:

- ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box

☐ Further applicants and/or (further) inventors are indicated on another continuation sheet.

Supplemental Box*If the Supplemental Box is not used, this sheet should not be included in the request.*

1. *If, in any of the Boxes, except Boxes Nos. VIII(i) to (v) for which a special continuation box is provided, the space is insufficient to furnish all the information: in such case, write "Continuation of Box No." (indicate the number of the Box) and furnish the information in the same manner as required according to the captions of the Box in which the space was insufficient, in particular:*
 - (i) *if more than one person is to be indicated as applicant and/or inventor and no "continuation sheet" is available: in such case, write "Continuation of Box No. III" and indicate for each additional person the same type of information as required in Box No. III. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below;*
 - (ii) *if, in Box No. II or in any of the sub-boxes of Box No. III, the indication "the States indicated in the Supplemental Box" is checked: in such case, write "Continuation of Box No. II" or "Continuation of Box No. III" or "Continuation of Boxes No. II and No. III" (as the case may be), indicate the name of the applicant(s) involved and, next to (each) such name, the State(s) (and/or, where applicable, ARIPO, Eurasian, European or OAPI patent) for the purposes of which the named person is applicant;*
 - (iii) *if, in Box No. II or in any of the sub-boxes of Box No. III, the inventor or the inventor/applicant is not inventor for the purposes of all designated States or for the purposes of the United States of America: in such case, write "Continuation of Box No. II" or "Continuation of Box No. III" or "Continuation of Boxes No. II and No. III" (as the case may be), indicate the name of the inventor(s) and, next to (each) such name, the State(s) (and/or, where applicable, ARIPO, Eurasian, European or OAPI patent) for the purposes of which the named person is inventor;*
 - (iv) *if, in addition to the agent(s) indicated in Box No. IV, there are further agents: in such case, write "Continuation of Box No. IV" and indicate for each further agent the same type of information as required in Box No. IV;*
 - (v) *if, in Box No. VI, there are more than three earlier applications whose priority is claimed: in such case, write "Continuation of Box No. VI" and indicate for each additional earlier application the same type of information as required in Box No. VI.*
2. *If the applicant intends to make an indication of the wish that the international application be treated, in certain designated States, as an application for a patent of addition, certificate of addition, inventor's certificate of addition or utility certificate of addition: in such a case, write the name or two-letter code of each designated State concerned and the indication "patent of addition," "certificate of addition," "inventor's certificate of addition" or "utility certificate of addition," the number of the parent application or parent patent or other parent grant and the date of grant of the parent patent or other parent grant or the date of filing of the parent application (Rules 4.11(a)(iii) and 49bis.1(a) or (b)).*
3. *If the applicant intends to make an indication of the wish that the international application be treated, in the United States of America, as a continuation or continuation-in-part of an earlier application: in such a case, write "United States of America" or "US" and the indication "continuation" or "continuation-in-part" and the number and the filing date of the parent application (Rules 4.11(a)(iv) and 49bis.1(d)).*

Continuation of Box No IV:

ANDREWS, Christopher John
 ELLIOTT, Kathryn
 GAAL, Jozsef Christopher
 LEE, Michael David
 OSBORN, Martin Keith
 PALMER, Sarah Louise
 SOUTHERN, David William
 WARD, Steven Paul
 WATERMAN, John Richard

Telephone: +44 (0)1344 424701
 Facsimile: +44 (0)1344 481112

All at:
 Intellectual Property Department
 Syngenta Limited
 P.O. Box 3538
 Jealott's Hill International Research Centre
 Bracknell
 Berks RG42 6YA
 UNITED KINGDOM

Box No. V DESIGNATIONS

The filing of this request constitutes under Rule 4.9(a), the designation of all Contracting States bound by the PCT on the international filing date, for the grant of every kind of protection available and, where applicable, for the grant of both regional and national patents. However,

- ☐ DE Germany is not designated for any kind of national protection
☐ JP Japan is not designated for any kind of national protection
☐ KR Republic of Korea is not designated for any kind of national protection
☐ RU Russian Federation is not designated for any kind of national protection

(The check-boxes above may only be used to exclude (irrevocably) the designations concerned if, at the time of filing or subsequently under Rule 26bis.1, the international application contains in Box No. VI a priority claim to an earlier national application filed in the particular State concerned, in order to avoid the ceasing of the effect, under the national law, of this earlier national application.)

Box No. VI PRIORITY CLAIM

The priority of the following earlier application(s) is hereby claimed:

Filing date of earlier application (day/month/year)	Number of earlier application	Where earlier application is:		
		national application: country or Member of WTO	regional application: regional Office	international application: receiving Office
item (1) 12/12/2006 12 December 2006	0624760.5	GB		
item (2)				
item (3)				

☐ Further priority claims are indicated in the Supplemental Box.

Transmit certified copy: the receiving Office is requested to prepare and transmit to the International Bureau a certified copy of the earlier application(s) (only if the earlier application was filed with the Office which for the purposes of this international application is the receiving Office) identified above as:

- ☐ all items ☐ item (1) ☐ item (2) ☐ item (3) ☐ other, see Supplemental Box

Restore the right of priority: the receiving Office is requested to restore the right of priority for the earlier application(s) identified above or in the Supplemental Box as item(s) (). (See also the Notes to Box No. VI; further information must be provided to support a request to restore the right of priority.)

Incorporation by reference: where an element of the international application referred to in Article 11(1)(iii)(d) or (e) or a part of the description, claims or drawings referred to in Rule 20.5(a) is not otherwise contained in this international application but is completely contained in an earlier application whose priority is claimed on the date on which one or more elements referred to in Article 11(1)(iii) were first received by the receiving Office, that element or part is, subject to confirmation under Rule 20.6, incorporated by reference in this international application for the purposes of Rule 20.6.

Box No. VII INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

Choice of International Searching Authority (ISA) (if two or more International Searching Authorities are competent to carry out the international search, indicate the Authority chosen; the two-letter code may be used):

ISA / EP

Request to use results of earlier search; reference to that search (if an earlier search has been carried out by or requested from the International Searching Authority):

Date (day/month/year) Number Country (or regional Office)

Box No. VIII DECLARATIONS

The following declarations are contained in Boxes Nos. VIII (i) to (v) (mark the applicable check-boxes below and indicate in the right column the number of each type of declaration):

Number of
declarations

- | | | |
|---|--|---|
| ☐ Box No. VIII (i) | Declaration as to the identity of the inventor | : |
| ☐ Box No. VIII (ii) | Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and be granted a patent | : |
| ☐ Box No. VIII (iii) | Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to claim the priority of the earlier application | : |
| ☐ Box No. VIII (iv) | Declaration of inventorship (only for the purposes of the designation of the United States of America) | : |
| ☐ Box No. VIII (v) | Declaration as to non-prejudicial disclosures or exceptions to lack of novelty | : |

Box No. IX CHECK LIST; LANGUAGE OF FILING	
This international application contains: (a) on paper, the following number of sheets: request (including declaration and supplemental sheets) : 5 description (excluding sequence listing and/or tables related thereto) : 67 claims : 4 abstract : 1 drawings : 0 Sub-total number of sheets : 77 sequence listing : tables related thereto : (for both, actual number of sheets if filed on paper, whether or not also filed in electronic form; see (c) below) Total number of sheets : 77 (b) ☐ only in electronic form (Section 801(a)(i)) (i) ☐ sequence listing (ii) ☐ tables related thereto (c) ☐ also in electronic form (Section 801(a)(ii)) (i) ☐ sequence listing (ii) ☐ tables related thereto Type and number of carriers (diskette, CD-ROM, CD-R or other) on which are contained the ☐ sequence listing : ☐ tables related thereto : (additional copies to be indicated under items 9(ii) and/or 10(ii), in right column)	This international application is accompanied by the following item(s) (mark the applicable check-boxes below and indicate in right column the number of each item): 1. ☒ fee calculation sheet : 1 2. ☒ original separate power of attorney : 1 3. ☐ original general power of attorney : 4. ☐ copy of general power of attorney; reference number, if any: : 5. ☐ statement explaining lack of signature : 6. ☒ priority document(s) identified in Box No. VI as item(s): : 1 7. ☐ translation of international application into (language): : 8. ☐ separate indications concerning deposited microorganism or other biological material : 9. ☐ sequence listing in electronic form (indicate type and number of carriers) (i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under Rule 13ter only (and not as part of the international application) : (ii) ☐ (only where check-box (b)(i) or (c)(i) is marked in left column) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under Rule 13ter : (iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listing mentioned in left column : 10. ☐ tables in electronic form related to sequence listing (indicate type and number of carriers) (i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under Section 802(b-quater) only (and not as part of the international application) : (ii) ☐ (only where check-box (b)(ii) or (c)(ii) is marked in left column) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under Section 802(b-quater) : (iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the tables mentioned in left column : 11. ☐ other (specify): : Figure of the drawings which should accompany the abstract: Language of filing of the international application: ENGLISH
Box No. X SIGNATURE OF APPLICANT, AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE Next to each signature, indicate the name of the person signing and the capacity in which the person signs (if such capacity is not obvious from reading the request).  WARD, Steven Paul Date: 10 Dec 2007	

For receiving Office use only	
1. Date of actual receipt of the purported international application: 06 DECEMBER 2007 / 06-12-07	2. Drawings: ☐ received: ☐ not received:
3. Corrected date of actual receipt due to later but timely received papers or drawings completing the purported international application:	
4. Date of timely receipt of the required corrections under PCT Article 11(2):	
5. International Searching Authority (if two or more are competent): ISA /	6. ☐ Transmittal of search copy delayed until search fee is paid
For International Bureau use only	
Date of receipt of the record copy by the International Bureau:	

PATENT COOPERATION TREATY

WO 2008/071918
PCT/GB2007/004662

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

FIRST NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF
THE COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL
APPLICATION (TO DESIGNATED OFFICES WHICH
DO NOT APPLY THE 30 MONTH TIME LIMIT
UNDER ARTICLE 22(1))

(PCT Rule 47.1(c))

To:

INTELLECTUAL PROPERTY DEPARTMENT
Syngenta Limited
P.O. Box 3538
Jealott's Hill Research Centre
Bracknell RG42 6YA
ROYAUME-UNI

HEMICALS
ATTORNEY INITIALS MES
Date of mailing entered
08 AUG 2008

into Procedures.
IMPORTANT NOTICE
SCANNED ALL

PAID Date (day/month/year)
12 December 2008 (12.12.2006)

Date of mailing (day/month/year)
17 July 2008 (17.07.2008)

Applicant's or agent's file reference
PPD 71412/WO

International application No.
PCT/GB2007/004662

International filing date (day/month/year)
06 December 2007 (06.12.2007)

Applicant

SYNGENTA LIMITED et al

- ATTENTION:** For any designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002 (30 months from the priority date), **does apply**, please see Form PCT/IB/308(Second and Supplementary Notice) (to be issued promptly after the expiration of 28 months from the priority date).
- Notice is hereby given that the following designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does not apply**, has/have requested that the communication of the international application, as provided for in Article 20, be effected under Rule 93bis.1. The International Bureau has effected that communication on the date indicated below:
19 June 2008 (19.06.2008)

None

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(i), those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

- The following designated Offices, for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does not apply**, have not requested, as at the time of mailing of the present notice, that the communication of the international application be effected under Rule 93bis.1:

CH, LU, TZ, UG

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(ii), those Offices accept the present notice as conclusive evidence that the Contracting State for which that Office acts as a designated Office does not require the furnishing, under Article 22, by the applicant of a copy of the international application.

4. TIME LIMITS for entry into the national phase

For the designated Office(s) listed above, and unless a demand for international preliminary examination has been filed before the expiration of 19 months from the priority date (see Article 39(1)), the applicable time limit for entering the national phase will, **subject to what is said in the following paragraph**, be 20 MONTHS from the priority date.

In practice, time limits other than the 20-month time limit will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain of the designated Offices listed above. For regular updates on the applicable time limits (20 or 21 months, or other time limit), Office by Office, refer to the *PCT Gazette*, the *PCT Newsletter* and the *PCT Applicant's Guide*, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>.

It is the applicant's sole responsibility to monitor all these time limits.

VERIFY

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Dorothee Mülhausen

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail: pt01.pct@wipo.int

PATENT COOPERATION TREATY

WO 2008/071918
PCT/GB2007/004662

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

SECOND AND SUPPLEMENTARY NOTICE
INFORMING THE APPLICANT OF THE
COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL
APPLICATION (TO DESIGNATED OFFICES
WHICH APPLY THE 30 MONTH TIME
LIMIT UNDER ARTICLE 22(1))

(PCT Rule 47.1(c))

To:

INTELLECTUAL PROPERTY DEPARTMENT

Syngenta Limited
P.O. Box 3538
Jealott's Hill Research
Bracknell RG42 6YA
ROYAUME-UNI

IPD AGROCHEMICALS

ATTORNEY INITIALS MCH

Noted in observations.
30 APR 2009

SCANNED ALL
IMPORTANT NOTICE
PAGES

Date of mailing (day/month/year) 16 April 2009 (16.04.2009)		
Applicant's or agent's file reference PPD 71412/WO		
International application No. PCT/GB2007/004662	International filing date (day/month/year) 06 December 2007 (06.12.2007)	Priority date (day/month/year) 12 December 2006 (12.12.2006)
Applicant SYNGENTA LIMITED et al		

- ATTENTION:** For any designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002 (30 months from the priority date), **does not apply**, please see Form PCT/IB/308(First Notice) issued previously.
- Notice is hereby given that the following designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does apply**, has/have requested that the communication of the international application, as provided for in Article 20, be effected under Rule 93bis.1. The International Bureau has effected that communication on the date indicated below:
19 June 2008 (19.06.2008)

AU, AZ, BY, CN, CO, DZ, EP, HU, KG, KP, KR, MD, MK, MY, MZ, NA, NG, PG, RU, SY, TM, US

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(i), those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

- The following designated Offices, for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does apply**, have not requested, as at the time of mailing of the present notice, that the communication of the international application be effected under Rule 93bis.1:

AE, AG, AL, AM, AP, AT, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BZ, CA, CH, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, EA, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KM, KN, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LY, MA, ME, MG, MN, MW, MX, NI, NO, NZ, OA, OM, PH, PL, PT, RO, RS, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, TJ, TN, TR, TT, UA, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(ii), those Offices accept the present notice as conclusive evidence that the Contracting State for which that Office acts as a designated Office does not require the furnishing, under Article 22, by the applicant of a copy of the international application.

- TIME LIMITS for entry into the national phase**

For the designated or elected Office(s) listed above, the applicable time limit for entering the national phase will, **subject to what is said in the following paragraph**, be 30 MONTHS from the priority date.

In practice, **time limits other than the 30-month time limit** will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain of the designated or elected Office(s) listed above. For **regular updates on the applicable time limits** (30 or 31 months, or other time limit), Office by Office, refer to the *PCT Gazette*, the *PCT Newsletter* and the *PCT Applicant's Guide*, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>.

It is the applicant's **sole responsibility** to monitor all these time limits.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Dorothee Mülhausen
Facsimile No. +41 22 338 82 70	e-mail: pt01.pct@wipo.int

PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

PCT

To: SYNGENTA LIMITED Intellectual Property Department P.O. Box 3538 Jealott's Hill Research Centre Bracknell RG42 6YA GRANDE BRETAGNE		IPD AGROCHEMICALS ATTORNEY INITIALS Amend Claims 14 MAR 2008 12 May 2008 SCANNED AML PAGES		NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT AND THE WRITTEN OPINION OF THE INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY, OR THE DECLARATION	
VERIFY		Date of mailing (day/month/year)		(PCT Rule 44.1) 12/03/2008	
Applicant's or agent's file reference PPD 71112/WO		FOR FURTHER ACTION See paragraphs 1 and 4 below			
International application No. PCT/GB2007/004662		International filing date (day/month/year) 06/12/2007			
Applicant SYNGENTA LIMITED					

1. ☒ The applicant is hereby notified that the International search report and the written opinion of the International Searching Authority have been established and are transmitted herewith.

Filing of amendments and statement under Article 19:

The applicant is entitled, if he so wishes, to amend the claims of the International Application (see Rule 46):

When? The time limit for filing such amendments is normally two months from the date of transmittal of the International Search Report.

Where? Directly to the International Bureau of WIPO, 34 chemin des Colombettes, 1211 Geneva 20, Switzerland; Facsimile No.: (41-22) 368.82.70

For more detailed instructions, see the notes on the accompanying sheet.

2. ☐ The applicant is hereby notified that no International search report will be established and that the declaration under Article 17(2)(a) to that effect and the written opinion of the International Searching Authority are transmitted herewith.

3. ☐ With regard to the protest against payment of (an) additional fee(s) under Rule 40.2, the applicant is notified that:

- ☐ the protest together with the decision thereon has been transmitted to the International Bureau together with the applicant's request to forward the texts of both the protest and the decision thereon to the designated Offices.
- ☐ no decision has been made yet on the protest; the applicant will be notified as soon as a decision is made.

4. Reminders

Shortly after the expiration of **18 months** from the priority date, the International application will be published by the International Bureau. If the applicant wishes to avoid or postpone publication, a notice of withdrawal of the international application, or of the priority claim, must reach the International Bureau as provided in Rules 90bis.1 and 90bis.3, respectively, before the completion of the technical preparations for international publication.

The applicant may submit comments on an informal basis on the written opinion of the International Searching Authority to the International Bureau. The International Bureau will send a copy of such comments to all designated Offices unless an international preliminary examination report has been or is to be established. These comments would also be made available to the public but not before the expiration of 30 months from the priority date.

Within **19 months** from the priority date, but only in respect of some designated Offices, a demand for international preliminary examination must be filed if the applicant wishes to postpone the entry into the national phase until **30 months** from the priority date (in some Offices even later); otherwise, the applicant must, within **20 months** from the priority date, perform the prescribed acts for entry into the national phase before those designated Offices.

In respect of other designated Offices, the time limit of **30 months** (or later) will apply even if no demand is filed within 19 months.

See the Annex to Form PCT/IB/301 and, for details about the applicable time limits, Office by Office, see the *PCT Applicant's Guide*, Volume II, National Chapters and the WIPO Internet site.

Name and mailing address of the International Searching Authority  European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk Tel: (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Eva Bleijs
--	----------------------------------

NOTES TO FORM PCT/ISA/220

These Notes are intended to give the basic instructions concerning the filing of amendments under article 19. The Notes are based on the requirements of the Patent Cooperation Treaty, the Regulations and the Administrative Instructions under that Treaty. In case of discrepancy between these Notes and those requirements, the latter are applicable. For more detailed information, see also the *PCT Applicant's Guide*, a publication of WIPO.

In these Notes, "Article", "Rule", and "Section" refer to the provisions of the PCT, the PCT Regulations and the PCT Administrative Instructions, respectively.

INSTRUCTIONS CONCERNING AMENDMENTS UNDER ARTICLE 19

The applicant has, after having received the international search report and the written opinion of the International Searching Authority, one opportunity to amend the claims of the international application. It should however be emphasized that, since all parts of the international application (claims, description and drawings) may be amended during the international preliminary examination procedure, there is usually no need to file amendments of the claims under Article 19 except where, e.g. the applicant wants the latter to be published for the purposes of provisional protection or has another reason for amending the claims before international publication. Furthermore, it should be emphasized that provisional protection is available in some States only (see *PCT Applicant's Guide*, Volume I/A, Annexes B1 and B2).

The attention of the applicant is drawn to the fact that amendments to the claims under Article 19 are not allowed where the International Searching Authority has declared, under Article 17(2), that no international search report would be established (see *PCT Applicant's Guide*, Volume I/A, paragraph 296).

What parts of the international application may be amended?

Under Article 19, only the claims may be amended.

During the international phase, the claims may also be amended (or further amended) under Article 34 before the International Preliminary Examining Authority. The description and drawings may only be amended under Article 34 before the International Examining Authority.

Upon entry into the national phase, all parts of the international application may be amended under Article 28 or, where applicable, Article 41.

When? Within 2 months from the date of transmittal of the international search report or 16 months from the priority date, whichever time limit expires later. It should be noted, however, that the amendments will be considered as having been received on time if they are received by the International Bureau after the expiration of the applicable time limit but before the completion of the technical preparations for international publication (Rule 46.1).

Where not to file the amendments?

The amendments may only be filed with the International Bureau and not with the receiving Office or the International Searching Authority (Rule 46.2).

Where a demand for international preliminary examination has been/is filed, see below.

How? Either by cancelling one or more entire claims, by adding one or more new claims or by amending the text of one or more of the claims as filed.

A replacement sheet must be submitted for each sheet of the claims which, on account of an amendment or amendments, differs from the sheet originally filed.

All the claims appearing on a replacement sheet must be numbered in Arabic numerals. Where a claim is cancelled, no renumbering of the other claims is required. In all cases where claims are renumbered, they must be renumbered consecutively (Section 205(b)).

The amendments must be made in the language in which the international application is to be published.

What documents must/may accompany the amendments?

Letter (Section 205(b)):

The amendments must be submitted with a letter.

The letter will not be published with the international application and the amended claims. It should not be confused with the "Statement under Article 19(1)" (see below, under "Statement under Article 19(1)").

The letter must be in English or French, at the choice of the applicant. However, if the language of the international application is English, the letter must be in English; if the language of the international application is French, the letter must be in French.

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference PPD 71412/WO	FOR FURTHER ACTION	see Form PCT/ISA/220 as well as, where applicable, Item 5 below.
International application No. PCT/GB2007/004662	International filing date (day/month/year) 06/12/2007	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 12/12/2006
Applicant SYNGENTA LIMITED		

This International search report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This International search report consists of a total of 3 sheets.

☒ It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

1. Basis of the report

a. With regard to the **language**, the International search was carried out on the basis of:

- ☒ the international application in the language in which it was filed
☐ a translation of the international application into _____, which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1(b))

b. ☐ This International search report has been established taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 43.6bis(a)).

c. ☐ With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application, see Box No. I.

2. ☐ **Certain claims were found unsearchable** (See Box No. II).

3. ☐ **Unity of invention is lacking** (see Box No. III)

4. With regard to the **title**,

- ☐ the text is approved as submitted by the applicant
☒ the text has been established by this Authority to read as follows:

PYRIDO-PYRAZINE DERIVATIVES USEFUL AS HERBICIDAL COMPOUNDS

5. With regard to the **abstract**,

- ☒ the text is approved as submitted by the applicant
☐ the text has been established, according to Rule 38.2(b), by this Authority as it appears in Box No. IV. The applicant may, within one month from the date of mailing of this International search report, submit comments to this Authority

6. With regard to the **drawings**,

- a. the figure of the **drawings** to be published with the abstract is Figure No. _____
☐ as suggested by the applicant
☐ as selected by this Authority, because the applicant failed to suggest a figure
☐ as selected by this Authority, because this figure better characterizes the invention
- b. ☐ none of the figures is to be published with the abstract

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/GB2007/004662

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D471/04 A01N43/90 A01P13/00

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)

C07D A01N A01P

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, 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	US 5 491 126 A (SELBY THOMAS P [US]) 13 February 1996 (1996-02-13) claims; tables	1-18
A	WO 2005/010000 A (BASF AG [DE]; WAGNER OLIVER [DE]; GROTE THOMAS [DE]; BLETNER CARSTEN) 3 February 2005 (2005-02-03) cited in the application claims; examples	1-18
A	WO 2005/123698 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; CROWLEY PATRICK JELF [GB]; MUELLER UR) 29 December 2005 (2005-12-29) the whole document	1-18

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family 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

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

O document referring 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

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

3 March 2008

Date of mailing of the international search report

12/03/2008

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo-nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Bosma, Peter

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

International application No

PCT/GB2007/004662

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5491126	A	13-02-1996	NONE
WO 2005010000	A	03-02-2005	AU 2004259269 A1 03-02-2005 BR PI0412704 A 26-09-2006 CA 2532917 A1 03-02-2005 CN 1826341 A 30-08-2006 EP 1648890 A2 26-04-2006 KR 20060063892 A 12-06-2006 MX PA06000034 A 21-03-2006 US 2006160811 A1 20-07-2006
WO 2005123698	A	29-12-2005	EP 1771423 A1 11-04-2007

TRATADO DE COOPERACION EN MATERIA DE PATENTES

De: AUTORIDAD INTERNACIONAL DE EXAMINACIÓN PRELIMINAR

A: Ver forma PCT/ISA/220	PCT OPINION ESCRITA (PCT Regla 43bis.1)	
Referencia del solicitante o agente Ver formato PCT/ISA/220 Solicitud Internacional No. PCT/GB2007/004662	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 06 de diciembre de 2007	Fecha de prioridad (día/mes/año) 06 de diciembre de 2006
Fecha de Envío (día/mes/año) ver formato PCT/ISA/210 (segunda hoja) RESPUESTA VENCE dentro de 2 meses Vea el párrafo 2 abajo		
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC INV. C07D471/04 A01N43/90 A01P13/00		
Solicitante SYNGENTA LIMITED.		

1. Este opinión contiene indicaciones relacionadas con los siguientes puntos:

- I. ☒ Base de la opinion
- II. ☐ Prioridad
- III. ☐ El no-establecimiento de opinión en relación con la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial
- IV. ☐ Falta de unidad de invención
- V. ☒ Declaración motivada conforme a la Regla 43bis.1 (a)(i) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citaciones y explicaciones que soportan dicha declaración
- VI. ☐ Ciertos documentos citados
- VII. ☐ Ciertos defectos en la solicitud internacional
- VIII. ☐ Ciertas observaciones en la solicitud internacional

2. SIGUIENTE ACCIÓN

Si una solicitud de examen preliminar internacional es hecha, esta opinión será usualmente considerada como una opinión escrita de la autoridad del examen preliminar internacional. Sin embargo, esto no aplica si el solicitante escoge otra autoridad como IPEA y la escogida IPEA ha notificado a la oficina internacional bajo la regla 66.1 bis (b) que opiniones escritas de la autoridad de búsqueda internacional no serán considerados.

En esta opinión, como se indica arriba, será considerada como una opinión escrita de la IPEA, el solicitante es invitado a presentar a la IPEA una respuesta escrita junto con, si fuera apropiado, modificaciones antes de la expiración de tres meses desde la fecha de envío del formato PCT/ISA/220 o antes de la expiración de 22 meses de la fecha de prioridad, cualquiera que expire con posterioridad.

Para opciones adicionales, ver formato PCT/ISA/220.

3. Para opciones adicionales ver notas de la formato PCT/ISA/220.

Nombre y dirección de la autoridad encargada del examen preliminar internacional: Oficina de Patentes Europea P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk- Pays Bas Tel: +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo ni Fax: +31 70 340 - 3016	Fecha de finalización de esta opinión Ver formulario PCT/ISA/210	Oficial Autorizado/ Examinador Bosma, Peter Teléfono No.: +31 70 340-3665
--	--	---

I. BASE DEL INFORME

1. En relación con el **Idioma**, esta opinión ha sido establecida con base en la solicitud internacional como fue presentada, a menos que se indique lo contrario en este ítem.

____ Esta opinión fue establecida con base en la traducción de la lengua original al siguiente idioma____, que es el idioma de traducción prescrito para los presupuestos de la búsqueda internacional. (bajo las reglas 12. 3 y 23.1 (b)).

2. La opinión ha sido establecida teniendo en cuenta la rectificación de un error autorizado por o notificado a la autoridad bajo la regla 91 (regla 43bis.1(a)).

3. Respecto a cualquier secuencia **nucleótido y/o aminoácido** revelado en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional fue llevado a cabo con base en la lista de secuencias:

- a. tipo de material

____ lista de secuencias.

____ tabla relacionada con la lista de secuencias.

- b. formato del material.

____ en formato escrito.

____ en formato de computador leíble.

- c. tiempo de presentación

____ contenido en la solicitud internacional como fue presentado.

____ presentado con la solicitud internacional en computador y leíble a computador.

____ allegado subsiguientemente a esta autoridad para los propósitos de la búsqueda.

4. ____ En adición, en caso de que haya mas de una copia o versión de la lista de secuencias o/y tabla relacionada presentada, las requeridas opiniones relacionadas con que la información en la subsiguiente o adicionales copias son idénticas de aquellas de la solicitud como fue presentada y que no van mas allá de la solicitud como fue presentada, fueron proporcionadas.

5. Comentarios adicionales:

V. Declaración motivada conforme a la Regla 43bis.1 (a)(i) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citas y explicaciones que sustentan dicha declaración

1. Declaración

Novedad (N)	SI:	Reivindicaciones	1-18
	NO:	Reivindicaciones	
Nivel inventivo (IS)	SI:	Reivindicaciones	1-18
	NO:	Reivindicaciones	
Aplicación Industrial (IA)	SI:	Reivindicaciones	1-18
	NO:	Reivindicaciones	

2. Citas y explicaciones

Ver hoja separada

Re Ítem V.

1 Se realiza referencia a los siguientes documentos:

D1: US-A-5 491 126 (SELBY THOMAS P [US]) 13 de febrero de 1996 (1996-02-13)

D2: WO 2005/010000 A (BASF AG [DE];) 3 de febrero de 2005 citado en la solicitud

2 El documento D1, el cual es considerado para representar el estado del arte más relevante, divulga derivados de pirido[2,3-b]pirazina útiles como herbicidas.

A partir de esto, la materia objeto de las presentes reivindicaciones 1-18 difieren en que se relaciona a derivados de pirido[2,3-b]pirazina-**6-ona** útiles como herbicidas, los cuales son sustituidos en la 5ª quinta posición por **haloalquil, haloalquenil o un grupo haloalquinil**. Los compuestos de D1 no tienen sustituyentes en esta posición (átomo-N). Además los compuestos de D1 tienen una porción de fenil unida en la 8ª posición en contraste al presente grupo fenil sustituido en la 7ª posición de la estructura bicíclica de núcleo.

D2 divulga derivados de pirido[2,3-b]pirazina muy relacionados estructuralmente que no tienen sustituyentes en la 5ª posición del sistema bicíclico de núcleo. Los compuestos de D2 están indicados para ser fungicidas. La materia objeto de las reivindicaciones 1-18 por lo tanto es novedosa (Artículo 33(2) PCT).

3 El problema a ser resuelto por medio de la presente invención puede ser considerado como la provisión de compuestos adicionales útiles como herbicidas.

La solución a este problema propuesta en las reivindicaciones 1-18 de la presente solicitud se considera que involucra un nivel inventivo (Artículo 33(3) PCT) por las siguientes razones:

La característica novedosa de la presente solicitud recae en el grupo R3 unido en la 5ª posición del sistema de anillo bicíclico de pirido[2,3-b]pirazina-**6-ona**. No existían incentivos en ninguno de los documentos del arte previo disponibles del mismo campo herbicida o de un campo circundante (fungicidas) que llevan a los presentes derivados de pirido[2,3-b]pirazina-**6-ona** herbicida que tienen dicho grupo R3 en la 5ª posición.

PATENT COOPERATION TREATY

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

PCT

To:

see form PCT/ISA/220

WRITTEN OPINION OF THE INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY (PCT Rule 43*bis*.1)

Date of mailing
(day/month/year) see form PCT/ISA/210 (second sheet)

Applicant's or agent's file reference
see form PCT/ISA/220

FOR FURTHER ACTION
See paragraph 2 below

International application No.
PCT/GB2007/004662

International filing date (day/month/year)
06.12.2007

Priority date (day/month/year)
12.12.2006

International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC
INV. C07D471/04 A01N43/90 A01P13/00

Applicant
SYNGENTA LIMITED

1. This opinion contains indications relating to the following items:

- ☒ Box No. I Basis of the opinion
- ☐ Box No. II Priority
- ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
- ☒ Box No. V Reasoned statement under Rule 43*bis*.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- ☐ Box No. VI Certain documents cited
- ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
- ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

2. FURTHER ACTION

If a demand for international preliminary examination is made, this opinion will usually be considered to be a written opinion of the International Preliminary Examining Authority ("IPEA") except that this does not apply where the applicant chooses an Authority other than this one to be the IPEA and the chosen IPEA has notified the International Bureau under Rule 66.1*bis*(b) that written opinions of this International Searching Authority will not be so considered.

If this opinion is, as provided above, considered to be a written opinion of the IPEA, the applicant is invited to submit to the IPEA a written reply together, where appropriate, with amendments, before the expiration of 3 months from the date of mailing of Form PCT/ISA/220 or before the expiration of 22 months from the priority date, whichever expires later.

For further options, see Form PCT/ISA/220.

3. For further details, see notes to Form PCT/ISA/220.

Name and mailing address of the ISA:



European Patent Office - P.B. 5618 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas
Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl
Fax: +31 70 340 - 3016

Date of completion of
this opinion:

see form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

Bosma, Peter

Telephone No. +31 70 340-3665



**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/GB2007/004662

Box No. I Basis of the opinion

1. With regard to the **language**, this opinion has been established on the basis of:
 - ☒ the international application in the language in which it was filed
 - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1 (b)).
2. ☐ This opinion has been established taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 43bis.1(a))
3. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application and necessary to the claimed invention, this opinion has been established on the basis of:
 - a. type of material:
 - ☐ a sequence listing
 - ☐ table(s) related to the sequence listing
 - b. format of material:
 - ☐ on paper
 - ☐ in electronic form
 - c. time of filing/furnishing:
 - ☐ contained in the international application as filed.
 - ☐ filed together with the international application in electronic form.
 - ☐ furnished subsequently to this Authority for the purposes of search.
4. ☐ In addition, in the case that more than one version or copy of a sequence listing and/or table relating thereto has been filed or furnished, the required statements that the information in the subsequent or additional copies is identical to that in the application as filed or does not go beyond the application as filed, as appropriate, were furnished.
5. Additional comments:

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/GB2007/004662

**Box No. V Reasoned statement under Rule 43b/s.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or
Industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	<u>1-18</u>
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	<u>1-18</u>
	No: Claims	
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	<u>1-18</u>
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

Re Item V.

1 Reference is made to the following documents:

D1: US-A-5 491 126 (SELBY THOMAS P [US]) 13 February 1996 (1996-02-13)
D2: WO 2005/010000 A (BASF AG [DE]) 3 February 2005 cited in the application

2 Document D1, which is considered to represent the most relevant state of the art, discloses pyrido[2,3-b]pyrazine derivatives useful as herbicides.

From this, the subject-matter of the present claims 1-18 differs in that it relates to pyrido[2,3-b]pyrazin-6-one derivatives useful as herbicides, which are substituted on the 5-position by haloalkyl, haloalkenyl or a haloalkynyl group. The D1 compounds have no substituent at this position (N-atom). Furthermore the D1 compounds have a phenyl moiety attached at the 8-position in contrast to the present substituted phenyl group at the 7-position of the bicyclic core structure.

D2 discloses structurally very related pyrido[2,3-b]pyrazine derivatives having no substituent at the 5-position of the bicyclic core system. The D2 compounds are indicated as being fungicides.

The subject-matter of claims 1-18 is therefore novel (Article 33(2) PCT).

3 The problem to be solved by the present invention may be regarded as the provision of further compounds useful as herbicides.

The solution to this problem proposed in claims 1-18 of the present application is considered as involving an inventive step (Article 33(3) PCT) for the following reasons:

The novel feature of the present application recites in the group R³ attached at the 5-position of the pyrido[2,3-b]pyrazin-6-one bicyclic ring system.

There were no incentives in any of the available prior art documents from the same herbicidal field or from a neighbouring field (fungicides) leading to the present herbicidal pyrido[2,3-b]pyrazin-6-one derivatives having such a R³ group at the 5-position.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

**REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN 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 ☐

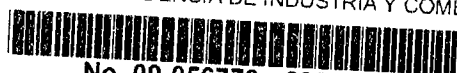
INCOMPLETA ☐

Sandra Padilla
Firma Responsable

Fecha junio 20 09

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 0840
Fax: 3505220
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-056776- -00000-0000

Fecha: 2009-06-02 16:03:08 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACION Folios: 139