



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

División de Nuevas Creaciones

**SOLICI
PATENTE DE I**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-222438-00000-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 166

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-035021-00008-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 166

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO

Isoxazolo[5,4-b]piridinas herbicidas

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF SE

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA

74. APODERADO

OSCAR CORREA

C.C. 79.524.624

22. BOGOTÁ, D.C.,

[illegible]

No. 14-222438- -00000-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCOR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 166

THE UNIVERSITY OF CHICAGO PRESS

No. 13-035021- -00006-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Ene: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 166

1. Identificación del Trámite

Conversión

División

Fusión

 Patente de Invención☐ Patente de Modelo de Utilidad☐ Registro de Diseño Industrial☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural

Persona Juridica

BASF SE

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal:

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Alemania	67056 Ludwigshafen, Alemania	Ludwigshafen
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
clientes@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

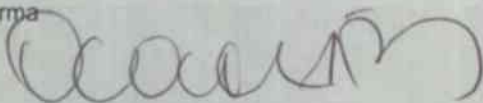
Apellidos y Nombre
CORREA Oscar

Documento de identificación
79.524.624

Tarjeta profesional
T.P.A. 71.027

Dirección y domicilio		Ciudad
Carrera 4° No. 72 –35		Bogotá
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
caveller@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

4. Datos del trámite		
CONVERSION Expediente _____ _____ _____ De: _____ A: _____	DIVISION Expediente : 13.035.021 De: _____ A: _____	FUSION Expediente _____ _____ _____ De: _____ A: _____
5. Recibo No 14-106279 Fecha: 2014/10/07 Recibo No 14-106278 Fecha: 2014/10/07		
6. Anexos		
☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación solicitud por \$464.000. ☒ Comprobante de pago por 4 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$124.000. ☒ Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación ☒ Documento que contiene la conversión, división o fusión de la solicitud ☐ Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético		
7. Firma		
Nombre y apellidos	Firma	
OSCAR CORREA		
C.C. 79.524.624 de Bogotá.	Tarjeta Profesional 23.555	

NOTA: Esta es una solicitud de división de la materia contenida originalmente en la solicitud de patente No. 13.035.021 .. La solicitud de división de la materia se hace como consecuencia de las observaciones hechas por ese Despacho y que fueron dadas a conocer al solicitante por medio del oficio No.6312 notificado por fijación en lista del 03 de junio de 2014. Por lo tanto pido que esta solicitud de división de materia sea tratada con el beneficio de presentación de la solicitud original, esto es 21 de febrero de 2013 y las prioridades que allí se reivindican el 22 de julio de 2010.

Nota: La copia básica original se encuentra en el expediente No. 13.035.021

Isoxazolo[5,4-b]piridinas herbicidas

La presente invención se refiere a isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula general I tal como se definen abajo y su uso como herbicidas. Además, la invención se refiere a composiciones para la fitosanidad y a un método para controlar vegetación indeseada.

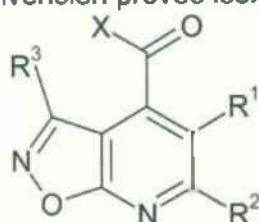
Compuestos que presentan una parte de isoxazolo[5,4-b]piridina son conocidos en la técnica. La US2009163545 describe tales compuestos como sustancias que modifican el intervalo de vida de organismos eucariotas. De acuerdo con la WO2009015208, determinados derivados de urea tienen efecto antibacteriano. Rutas potenciales para la síntesis de compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina se conocen de Elbannany et al, Pharmazie (1988) 43(2), 128-129 y Volochnyuk et al, Journal of Combinatorial Chemistry (2010) 12(4), 510-517.

En la agricultura hay una constante demanda de desarrollar novedosos ingredientes activos que complementan o son superiores a los métodos de tratamiento conocidos en cuanto a la actividad, selectividad y seguridad medioambiental.

Por tanto, la presente invención tiene por objeto proveer compuestos químicos, que son capaces como herbicidas. Especialmente, tiene por objeto identificar compuestos químicos con alta actividad herbicida, preferentemente, cuando se aplican en bajas cantidades, que al mismo tiempo no causan daños en las plantas deseadas, p.ej. plantas de cultivo.

Estos y otros objetos se alcanzan con las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I tal como se definen abajo y con sus sales útiles en la agricultura.

Por tanto, la presente invención provee isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I



I

teniendo las variables en la fórmula I los significados abajo definidos:

R¹ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo, fenil-C₁-C₄-alquilo;

R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, fenil-C₁-C₄-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquilamino, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo; pudiendo las partes de heterociclilo de R² estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo;

o R¹ y R² forman juntos un C₃-C₅-alcanodiilo;

R³ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-

- cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- X es OR⁴, SR⁵; NR⁶R⁷;
- R⁴, R⁵ significan hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquil-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, N,N-di-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinil-C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, heterociclilo, fenilo, heterocicillocarbonilo, fenilcarbonilo, heterocicillocarbonil-C₁-C₆-alquilo, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, fenil-C₁-C₆-alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R⁴ y R⁵ están sin

sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxicarbonilo, heterociclilo, fenilo;

- 5 R⁶, R⁷ significan hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, fenil-C₁-C₆-alcoxi, fenilo, fenilo sustituido con halógeno, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, SO₂R⁸;
- 10 R⁸ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, fenilo; pudiendo las partes de fenilo de R⁸ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxicarbonilo, heterociclilo, fenilo;

y sus sales útiles en la agricultura;

- Adicionalmente, otro objeto de la presente invención es el uso de isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I como herbicidas, a saber, su uso para controlar plantas nocivas.
- 15

- La presente invención provee también composiciones que comprenden por lo menos una isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I y los auxiliares acostumbrados para la formulación de agentes fitosanitarios.
- 20

La presente invención provee además un método para controlar vegetación indeseada, en donde se hace actuar una cantidad efectiva como herbicida de por lo menos una isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I sobre plantas, sus semillas y/o su

hábitat. La aplicación se puede realizar antes, durante y/o después, preferentemente, durante y/o después de la emergencia de las plantas no deseadas.

Además, la invención se refiere a procesos para preparar las isoxazolo[5,4-b]piridinas
5 de la fórmula I.

Otras formas de realización de la presente invención son evidentes de las reivindicaciones, la descripción y los ejemplos. Cabe constatar, que las características mencionadas arriba y las que serán ilustradas en lo sucesivo sobre la materia de la
10 invención valen no solamente para las combinaciones indicadas en cada caso, sino que también para otras combinaciones sin apartarse del alcance de la invención.

En el sentido usado en la presente, los términos "controlar" y "combatir" son sinónimos.

15 En el sentido usado en la presente, los términos "vegetación indeseada" y "plantas nocivas" son sinónimos.

Cuando las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I descritas en la presente son capaces de formar isómeros geométricos, por ejemplo, isómeros E/Z, entonces se
20 puede usar ambos isómeros puros y sus mezclas en las composiciones de acuerdo con la invención.

Cuando las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I descritas en la presente tienen uno o varios centros de quiralidad y están presentes, por tanto, como enantiómeros o
25 diastereómeros, entonces se puede usar tanto los enantiómeros como también los

diastereómeros puros y sus mezclas en las composiciones de acuerdo con la invención.

Los términos usados para los grupos orgánicos en la definición de las variables, como
5 por ejemplo, la expresión "alquilo", son términos colectivos que representan los diferentes miembros de estos grupos de unidades orgánicas.

El prefijo C_x-C_y significa el número posible en cada caso de átomos de carbono.

halógeno: flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente, flúor, cloro o bromo;

alquilo y las partes de alquilo de grupos compuestos, tales como, alcoxi, alquilamino,
10 alquiltio, alcoxicarbonilo: radicales hidrocarburo saturados, lineales o ramificados, que tienen 1 a 10 átomos de carbono, preferentemente, C_1-C_6 -alquilo o C_1-C_4 -alquilo, como p.ej. metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-
15 metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo; heptilo, octilo, 2-etilhexilo e isómeros posicionales de los mismos; nonilo, decilo e isómeros posicionales de los mismos;
20 haloalquilo: grupos alquilo lineales o ramificados, que tienen 1 a 10 átomos de carbono (tal como se mencionan arriba), preferentemente, C_1-C_6 -haloalquilo o C_1-C_4 -haloalquilo, estando algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos reemplazados por átomos de halógeno, tal como se mencionan arriba. En una forma de realización, los grupos alquilo están sustituidos al menos una vez o completamente por un átomo de

- halógeno especial, preferentemente, flúor, cloro o bromo. En otra forma de realización, los grupos alquilo están parcial o completamente halogenados por diferentes átomos de halógeno. En el caso de sustituciones mixtas de halógeno, es preferida la combinación de cloro y flúor. Se da especial preferencia a (C₁-C₃)-haloalquilo, sobre todo, a (C₁-C₂)-
- 5 haloalquilo, como p.ej. clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo o 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;
- 10 alqueno y también las partes de alqueno en grupos compuestos, como p.ej. alqueniloxi: radicales hidrocarburo no saturados, lineales o ramificados, que tienen 2 a 10 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición. De acuerdo con la invención, puede ser preferido usar pequeños grupos alqueno, como p.ej. (C₂-C₆)-alqueno; por el otro lado, también puede ser preferido usar grupos alqueno más
- 15 grandes, como p.ej. (C₅-C₈)-alqueno. Ejemplos de grupos alqueno de C₂-C₈ son: etenoilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenoilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-
- 20 butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-
- 25 pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-

pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

alquínilo y las partes de alquínilo en grupos compuestos: grupos hidrocarburo lineales o ramificados, que tienen 2 a 10 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición, por ejemplo, C_2 - C_6 -alquínilo, como p.ej. etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

cicloalquilo y también las partes de cicloalquilo en grupos compuestos: grupos hidrocarburos saturados, mono o bicíclicos, que tienen 3 a 10, especialmente, 3 a 6, miembros anulares de carbono. Ejemplos de C_3 - C_6 -cicloalquilo son: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo. Ejemplos de bicyclic radicals comprise biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[3.1.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo y biciclo[3.2.1]octilo;

halocicloalquilo y las partes de halocicloalquilo en grupos compuestos: grupos hidrocarburo saturados monocíclicos, que tienen 3 a 10 miembros anulares de carbono (tal como se mencionan arriba), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno pueden estar reemplazados por átomos de halógeno tal como se

5 mencionan arriba, especialmente, flúor, cloro y bromo;

cicloalquenilo: grupos hidrocarburo monoinsaturados, monocíclicos, que tienen 3 a 10, 3 a 8, 3 a 6, preferentemente, 5 a 6, miembros anulares de carbono, como p.ej.

ciclopenten-1-ilo, ciclopenten-3-ilo, ciclohexen-1-ilo, ciclohexen-3-ilo, ciclohexen-4-ilo y similares;

10 alcoxi: un grupo alquilo, tal como se define arriba, que está ligado por medio de un oxígeno, preferentemente, uno que tiene 1 a 10, más preferentemente, 1 a 6 ó 1 a 4 átomos de carbono. Ejemplos son: metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi o 1,1-dimetiletoxi, y also por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-
15 etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi o 1-etil-2-metilpropoxi;

haloalcoxi: alcoxi, tal como se define arriba, estando algunos o todos los átomos de
20 hidrógeno en estos grupos reemplazados por átomos de halógeno, tal como se describe arriba para haloalquilo, especialmente, por flúor, cloro o bromo. Ejemplos son: OCH_2F , OCHF_2 , OCF_3 , OCH_2Cl , OCHCl_2 , OCCl_3 , clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-

dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, OC_2F_5 , 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, $\text{OCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{OCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, 1-(CH_2F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH_2Cl)-2-cloroetoxi, 1-(CH_2Br)-2-bromoetoxi, 4-
5 fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi; y también 5-fluoropentoxi, 5-cloropentoxi, 5-bromopentoxi, 5-yodopentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluorohexoxi, 6-clorohexoxi, 6-bromohexoxi, 6-yodohexoxi o dodecafluorohexoxi;

arilo: carbociclo aromático de 6 a 10-miembros, con 6, 7, 8, 9 ó 10 átomos de carbono.

Ejemplos de arilos preferidos son: fenilo o naftilo;

- 10 heterociclo: un anillo monocíclico o sistema de anillo bicíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático, de 5, 6, 7, 8, 9 ó 10 miembros, que contiene 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros de anillo, y que puede contener además uno o dos grupos CO, SO, SO_2 , como miembros de anillo, pudiendo el heterociclo en cuestión estar ligado por medio de un átomo de carbono, o, si está
15 presente, por medio de un átomo de. Especialmente:
- un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de tres, cinco o seis miembros, que comprende uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros de anillo: por ejemplo, un heterociclo monocíclico saturado o parcialmente insaturados, que además de miembros anulares de carbono,
20 comprende uno, dos o tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, por ejemplo, aziridina, oxirano, 2-tetrahidrofuranoilo, 3-tetrahidrofuranoilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo,

- 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo y también los correspondientes radicales -ilideno;

- un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de siete miembros, que comprende uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros de anillo: por ejemplo, heterociclos mono- y bicíclicos, que tienen 7 miembros de anillo, que además de miembros anulares de carbono, comprende uno, dos o tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre, por ejemplo, tetra- y hexahidroazepinilo, como p.ej. 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, hexahidroazepin-1-, -2-, -3- o -4-ilo, tetra- y hexahidrooxepinilo como p.ej. 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-ilo, hexahidroazepin-1-, -2-, -3- o -4-ilo, tetra- y hexahidro-1,3-diazepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-diazepinilo, tetra- y hexahidro-1,3-oxazepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-oxazepinilo, tetra- y hexahidro-1,3-dioxepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-dioxepinilo y los correspondientes radicales -ilideno;
- un heterociclo aromático de cinco o seis miembros (=radical heteroaromático), que contiene uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo que consiste de oxígeno, nitrógeno y azufre, por ejemplo, heteroarilo de cinco miembros, que está ligado por medio de carbono y contiene uno a tres átomos de nitrógeno o uno o dos átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros de anillo, como p.ej. 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-

16
 tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo; heteroarilo de cinco miembros, que está ligado por medio de nitrógeno y contiene uno a tres átomos de nitrógeno como
 5 miembros de anillo, como p.ej. pirrol-1-ilo, pirazol-1-ilo, imidazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo y 1,2,4-triazol-1-ilo; heteroarilo de seis miembros, que contiene dos o tres átomos de nitrógeno como miembros de anillo, como p.ej. piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo;

10

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I también pueden estar presentes en forma de los N-óxidos y/o sus sales útiles en la agricultura, siendo, generalmente sin importancia de naturaleza de la sal. Por lo general son apropiadas las sales de aquellos cationes y las sales de adición ácida de aquellos ácidos, cuyos cationes o
 15 aniones, respectivamente, no perjudican la actividad de las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula i.

Cationes apropiados son los iones de los metales alcalinos, preferentemente, de litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferentemente, de calcio y magnesio, y de los metales transitorios, preferentemente, de manganeso, cobre, cinc e hierro,
 20 además, amonio y amonio sustituido donde uno a cuatro átomos de hidrógeno están reemplazados por C₁-C₄-alquilo, hidroxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, hidroxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo o bencilo, preferentemente, amonio, metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutylamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxiet-
 25 1-oxi)et-1-ilamonio, di(2-hidroxiet-1-il)amonio, benciltrimetilamonio, benciltriethylamonio,

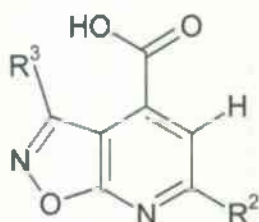
además, iones fosfonio, iones sulfonio, preferentemente, tri(C₁-C₄-alquil)sulfonio, como p.ej. trimetilsulfonio, e iones sulfoxonio, preferentemente, tri(C₁-C₄-alquil)sulfoxonio.

Aniones de sales de adición ácidas útiles son, sobre todo, cloruro, bromuro, fluoruro, yoduro, hidrogensulfato, metilsulfato, sulfato, dihidrogenfosfato, hidrogenfosfato,

- 5 nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y también los aniones de ácidos alcanoicos de C₁-C₄, preferentemente, formato, acetato, propionato y butirato.

10 Generalmente, las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I son apropiadas como herbicidas.

Los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I.a (fórmula I.a corresponde a la fórmula I, donde R¹ es hidrógeno, X es OR⁴ y R⁴ es hidrógeno)



I.a

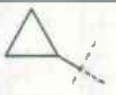
15

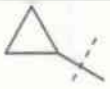
o sus sales útiles en la agricultura son especialmente útiles como herbicidas.

20 Formas de realización preferidas de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I.a son los compuestos 1.a.1 hasta 1.a.152 de acuerdo con la tabla 1, representando cada línea en la tabla 1 a un compuesto de la fórmula I:

Tabla 1: Compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina 1.a.1 hasta 1.a.152

No.	R ²	R ³
1.a.1.	CH ₃	H
1.a.2.	CH ₃	CH ₃
1.a.3.	CH ₃	CH ₂ CH ₃
1.a.4.	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.a.5.	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
1.a.6.	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
1.a.7.	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₃
1.a.8.	CH ₃	C(CH ₃) ₃
1.a.9.	CH ₃	OC(CH ₃) ₃
1.a.10.	CH ₃	
1.a.11.	CH ₃	
1.a.12.	CH ₃	
1.a.13.	CH ₃	
1.a.14.	CH ₃	C ₆ H ₅
1.a.15.	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
1.a.16.	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄
1.a.17.	CH ₃	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.18.	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.19.	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
1.a.20.	CH ₃	3-F-C ₆ H ₄
1.a.21.	CH ₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.22.	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.23.	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
1.a.24.	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
1.a.25.	CH ₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.26.	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.27.	CH ₃	2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
1.a.28.	CH ₃	2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
1.a.29.	CH ₃	2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
1.a.30.	CH ₃	2-F,3-F-C ₆ H ₃

No.	R ²	R ³
1.a.31.	CH ₃	2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
1.a.32.	CH ₃	2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
1.a.33.	CH ₃	2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
1.a.34.	CH ₃	2-F,4-F-C ₆ H ₃
1.a.35.	CH ₃	3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
1.a.36.	CH ₃	3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
1.a.37.	CH ₃	3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
1.a.38.	CH ₃	3-F,5-F-C ₆ H ₃
1.a.39.		H
1.a.40.		CH ₃
1.a.41.		CH ₂ CH ₃
1.a.42.		CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.a.43.		CH(CH ₃) ₂
1.a.44.		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.a.45.		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1.a.46.		C(CH ₃) ₃
1.a.47.		CF ₃
1.a.48.		
1.a.49.		
1.a.50.		

No.	R ²	R ³
I.a.51.		
I.a.52.		C ₆ H ₅
I.a.53.		2-Cl-C ₆ H ₄
I.a.54.		2-F-C ₆ H ₄
I.a.55.		2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.56.		2-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.57.		3-Cl-C ₆ H ₄
I.a.58.		3-F-C ₆ H ₄
I.a.59.		3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.60.		3-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.61.		4-Cl-C ₆ H ₄
I.a.62.		4-F-C ₆ H ₄
I.a.63.		4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.64.		4-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.65.		2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
I.a.66.		2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
I.a.67.		2-F,3-Cl-C ₆ H ₃

No.	R ²	R ³
I.a.68.		2-F,3-F-C ₆ H ₃
I.a.69.		2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
I.a.70.		2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
I.a.71.		2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
I.a.72.		2-F,4-F-C ₆ H ₃
I.a.73.		3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.74.		3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
I.a.75.		3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.76.		3-F,5-F-C ₆ H ₃
I.a.77.		H
I.a.78.		CH ₃
I.a.79.		CH ₂ CH ₃
I.a.80.		CH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.81.		CH(CH ₃) ₂
I.a.82.		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.83.		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.84.		C(CH ₃) ₃
I.a.85.		CF ₃

No.	R ²	R ³
I.a.86.		
I.a.87.		
I.a.88.		
I.a.89.		
I.a.90.		C ₆ H ₅
I.a.91.		2-Cl-C ₆ H ₄
I.a.92.		2-F-C ₆ H ₄
I.a.93.		2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.94.		2-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.95.		3-Cl-C ₆ H ₄
I.a.96.		3-F-C ₆ H ₄
I.a.97.		3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.98.		3-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.99.		4-Cl-C ₆ H ₄
I.a.100.		4-F-C ₆ H ₄
I.a.101.		4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.102.		4-CF ₃ -C ₆ H ₄

No.	R ²	R ³
I.a.103.		2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
I.a.104.		2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
I.a.105.		2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
I.a.106.		2-F,3-F-C ₆ H ₃
I.a.107.		2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
I.a.108.		2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
I.a.109.		2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
I.a.110.		2-F,4-F-C ₆ H ₃
I.a.111.		3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.112.		3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
I.a.113.		3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.114.		3-F,5-F-C ₆ H ₃
I.a.115.		H
I.a.116.		CH ₃
I.a.117.		CH ₂ CH ₃
I.a.118.		CH ₂ CH ₂ CH ₃

No.	R ²	R ³	No.	R ²	R ³
I.a.119.		CH(CH ₃) ₂	I.a.130.		2-F-C ₆ H ₄
I.a.120.		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	I.a.131.		2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.121.		CH ₂ CH(CH ₃) ₂	I.a.132.		2-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.122.		C(CH ₃) ₃	I.a.133.		3-Cl-C ₆ H ₄
I.a.123.		CF ₃	I.a.134.		3-F-C ₆ H ₄
I.a.124.			I.a.135.		3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.125.			I.a.136.		3-CF ₃ -C ₆ H ₄
I.a.126.			I.a.137.		4-Cl-C ₆ H ₄
I.a.127.			I.a.138.		4-F-C ₆ H ₄
I.a.128.		C ₆ H ₅	I.a.139.		4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
I.a.129.		2-Cl-C ₆ H ₄	I.a.140.		4-CF ₃ -C ₆ H ₄

22

No.	R ²	R ³
I.a.141.		2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
I.a.142.		2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
I.a.143.		2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
I.a.144.		2-F,3-F-C ₆ H ₃
I.a.145.		2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
I.a.146.		2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
I.a.147.		2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
I.a.148.		2-F,4-F-C ₆ H ₃
I.a.149.		3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.150.		3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
I.a.151.		3-F,5-Cl-C ₆ H ₃

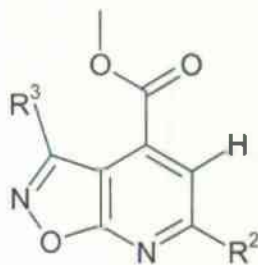
No.	R ²	R ³
I.a.152.		3-F,5-F-C ₆ H ₃

Adicionalmente, los siguientes compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I son especialmente útiles como herbicidas:

Tabla 2: Compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.b.1 a I.b.152

5

Los compuestos I.b.1 a I.b.152, que se distinguen de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.a.1 hasta I.a.152 de acuerdo con la tabla 1 solamente en cuanto a la variable R^4 , que significa CH_3 .



I.b

10

Tabla 3: Compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.c.1 a I.c.152

Los compuestos I.c.1 a I.c.152, que se distinguen de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.a.1 hasta I.a.152 de acuerdo con la tabla 1 solamente en cuanto a la variable R^4 , que significa CH_2OCH_3 .

15



I.c

Tabla 4: Compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.d.1 a I.d.152

Los compuestos 1.d.1 a 1.d.152, que se distinguen de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.a.1 hasta I.a.152 de acuerdo con la tabla 1 solamente en

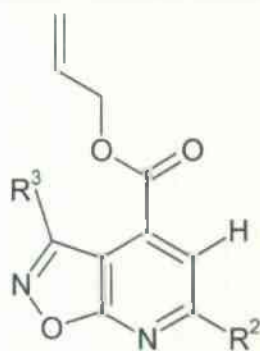
- 5 cuanto a la variable R^4 , que significa CH_2CN .



I.d

Tabla 5: Compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.e.1 a I.e.152

- 10 Los compuestos 1.e.1 a 1.e.152, que se distinguen de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.a.1 hasta I.a.152 de acuerdo con la tabla 1 solamente en cuanto a la variable R^4 , que significa $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$.

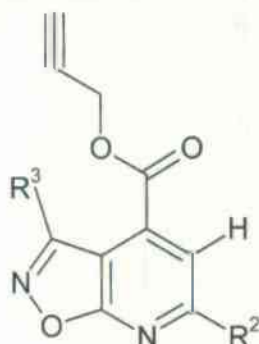


I.e

Tabla 6: Compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.f.1 a I.f.152

Los compuestos 1.f.1 a 1.f.152, que se distinguen de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina I.a.1 hasta I.a.152 de acuerdo con la tabla 1 solamente en cuanto a la

5 variable R^4 , que significa $CH_2C\equiv CH$.



I.f

De acuerdo con una forma de realización preferida de la invención también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

10

R^1 es hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo;

Son especialmente preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R^1 es hidrógeno.

15

De acuerdo con otra forma de realización preferida de la invención, también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

R^2 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_8 -alquenilo, C_2 - C_8 -alquinilo; y

20

especialmente, aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

R² es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo;

Son muy especialmente preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R² es C₃-C₆-cicloalquilo o C₃-C₆-halocicloalquilo, sobre todo, aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R² es ciclopropilo o 1-fluorociclopropilo.

De acuerdo con otra forma de realización preferida de la invención, también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo; pudiendo las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄-alquilamino, heterocíclico, fenilo;

Son especialmente preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi;

De acuerdo con otra forma de realización preferida de la invención, también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde X es OR⁴.

- 5 De acuerdo con otra forma de realización preferida de la invención, también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde, R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo.

10

Son especialmente preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, l-propilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, terc.-butilo, sobre todo, aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R⁴ es hidrógeno;

15

De acuerdo con otra forma de realización preferida de la invención, también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde X es SR⁵.

- 20 De acuerdo con otra forma de realización preferida de la invención, también son preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde, R⁵ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo.

Son especialmente preferidos aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R^5 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo, sobre todo, aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde R^5 es C_1 - C_6 -alquilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo;

5

Son especialmente útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

R^1 es hidrógeno;

10 R^2 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo;

15 R^3 es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquil- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquil- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_1 - C_4 -alquil- C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquenilo, C_3 - C_6 -halocicloalquenilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo, heterociclilo- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -haloalquiltio, amino, C_1 - C_6 -alquilamino, N,N-di- $(C_1$ - $C_6)$ -alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R^3 estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales

20 seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alcoxycarbonilo, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, N,N-di- $(C_1$ - $C_4)$ -alquilamino, heterociclilo, fenilo;

25 X es OR^4 ;

- R^4 es hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, C_1-C_6 -hidroxialquilo, C_1-C_6 -cianoalquilo, C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalcoxi- C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo- C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -haloalquenilo- C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -alcoxycarbonil- C_1-C_6 -alquilo, aminocarbonil- C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -alquilo-aminocarbonil- C_1-C_6 -alquilo, N,N-di-(C_1-C_6 -alquilo)-aminocarbonil- C_1-C_6 -alquilo, [N-(C_3-C_6 -cicloalquilo)- C_1-C_6 -alquilo], N-(C_1-C_6 -alquilo)-aminocarbonil- C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -alcoxi-aminocarbonil- C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alqueno, C_2-C_6 -haloalqueno, C_2-C_6 -alquino- C_2-C_6 -alqueno, C_2-C_6 -alquino, C_2-C_6 -haloalquino, heterociclilo, fenilo, heterocicliocarbonilo, fenilcarbonilo, heterocicliocarbonil- C_1-C_6 -alquilo, fenilcarbonil- C_1-C_6 -alquilo, heterociclilo- C_1-C_6 -alquilo, fenil- C_1-C_6 -alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R^4 y R^5 están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo;
- y sus sales útiles en la agricultura;

Son especialmente útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula 1, en donde

- R^1 es hidrógeno;
- R^2 es hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, C_1-C_6 -hidroxialquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_3-C_6 -halocicloalquilo, C_2-C_6 -alqueno, C_2-C_6 -alquino;
- R^3 es C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo- C_1-C_6 -alquilo, C_3-C_6 -halocicloalquilo- C_1-C_6 -alquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_3-C_6 -halocicloalquilo, C_1-C_4 -alquilo- C_3-C_6 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -haloalcoxi, fenilo; pudiendo las partes de fenilo de R^3 estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales

seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄-alquilamino, heterociclilo, fenilo;

X es OR⁴;

R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-haloalqueno-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquil-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, N,N-di-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino-C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆-haloalquino, heterociclilo, fenilo, heterociclocarbonilo, fenilcarbonilo, heterociclocarbonil-C₁-C₆-alquilo, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, fenil-C₁-C₆-alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R⁴ y R⁵ están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo;

y sus sales útiles en la agricultura;

Son especialmente útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

R¹ es hidrógeno;

- R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino;
- R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo; pudiendo las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitrilo, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- X es OR⁴;
- R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino; is sobre todo, hidrógeno;
- y sus sales útiles en la agricultura;

Son especialmente útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

- R¹ es hidrógeno;
- R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino;
- R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo; pudiendo las

partes de fenilo de R^3 estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alcoxycarbonilo, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, N,N -di- $(C_1$ - C_4)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;

X es SR^5 ;

R^5 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo; is sobre todo, C_1 - C_6 -alquilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo;

10 y sus sales útiles en la agricultura;

Son aún más útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

R^1 es hidrógeno;

15 R^2 es C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo; sobre todo, ciclopropilo o 1-fluorociclopropilo;

R^3 es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquil- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquil- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_1 - C_4 -alquil- C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquenilo, C_3 - C_6 -halocicloalquenilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo, heterociclilo- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -haloalquiltio, amino, C_1 - C_6 -alquilamino, N,N -di- $(C_1$ - C_6)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R^3 estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales

- seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- 5 X es OR⁴;
- R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-haloalqueno-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquil-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, N,N-di-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino-C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆-haloalquino, heterociclilo, fenilo, heterocicliocarbonilo, fenilcarbonilo, heterocicliocarbonil-C₁-C₆-alquilo, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, fenil-C₁-C₆-alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R⁴ y R⁵ están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de
- 10 halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo; sobre todo, hidrógeno;
- 15 y sus sales útiles en la agricultura;

Son aún más útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

- 25 R¹ es hidrógeno;

R² es C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo; sobre todo, ciclopropilo o 1-fluorociclopropilo;

R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo; pudiendo las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄-alquilamino, heterociclilo, fenilo;

X es OR⁴;

R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino; sobre todo, hidrógeno;

y sus sales útiles en la agricultura;

Son máximamente útiles como herbicidas aquellos compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

20 R¹ es hidrógeno;

R² es ciclopropilo;

R³ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalqueno, C₃-C₆-

25

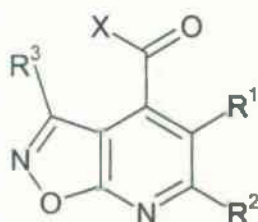
- haicicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloaiquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloaiquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las
- 5 partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-
- 10 alquilamino, heterociclilo, fenilo;

X es OR⁴;

R⁴ es hidrógeno;

y sus sales útiles en la agricultura;

- 15 Mientras que compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina son conocidos en el arte, los especiales compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I son novedosos. Por tanto, son materia de la presente invención también los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



(I)

20

en donde

R¹ es hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo;

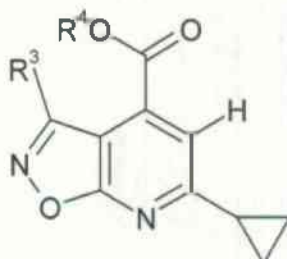
- R^2 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo;
- R^3 hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquil- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquil- C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_1 - C_4 -alquil- C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquenilo, C_3 - C_6 -halocicloalquenilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo, heterociclilo- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -haloalquiltio, amino, C_1 - C_6 -alquilamino, N,N-di-
 10 (C_1 - C_6)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R^3 estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alcoxycarbonilo, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -
 15 alquilsulfinilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, N,N-di-(C_1 - C_4)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- X es OR^4 ;
- R^4 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -cianoalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo;
- 20 haloalquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo;

y sus sales útiles en la agricultura con excepción de los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, en donde

R^1 es hidrógeno, R^2 es ciclopropilo, R^3 es CH_3 , X es OR^4 y R^4 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, cianometilo, o 2-cl-2-propen-1-ilo; y

- R^1 es hidrógeno, R^2 es ciclopropilo, R^3 es $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, ciclopropilo, fenilo, 2-F-fenilo, 4-F-fenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxifenilo, 2-furano-ilo, 1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo, 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-ilo, X es OR^4 y R^4 es hidrógeno, metilo o etilo; y
- 5 R^1 es hidrógeno, R^2 es metilo, R^3 es CH_3 , $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, ciclopropilo, fenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-fluorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2-furano-ilo, 1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo, 1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-ilo, X es OR^4 y R^4 es hidrógeno, metilo o etilo; y
- 10 R^1 es hidrógeno, R^2 es etilo, R^3 es CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, ciclopropilo, 1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo, X es OR^4 y R^4 es hidrógeno, metilo o etilo; y
- R^1 es hidrógeno, R^2 es i-propilo, R^3 es CH_3 , $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, ciclopropilo, fenilo, 3-metoxifenilo, 2-furano-ilo; X es OR^4 y R^4 es hidrógeno, metilo o etilo; y
- 15 R^1 es cloro, R^2 es metilo, ciclopropilo, R^3 es metilo, X es OR^4 y R^4 es hidrógeno o metilo.

También son objeto de la presente invención los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I,



20 en donde

R^1 es hidrógeno;

- R² es ciclopropilo;
- R³ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de
- heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- X es OR⁴;
- R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquil-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, N,N-di-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinil-C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, heterociclilo, fenilo, heterociclitocarbonilo, fenilcarbonilo,

heterociclillocarbonil-C₁-C₆-alquilo, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, fenil-C₁-C₆-alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R⁴ están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxicarbonilo, heterociclilo, fenilo; sobre todo, hidrógeno;

y sus sales útiles en la agricultura; con excepción de:

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-fluorofenil)-metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-[4-(metoxycarbonil)-3,5-dimetil-1H-pirrol-2-il]-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(3-metil-2-quinoxalínil)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2-metoxi-4-metilfenil)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-[5-(2-furanoil)-3-isoxazolil]metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(4-etoxifenoxi)etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-1-(5-fenil-1,3,4-oxadiazol-2-il)etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(5-etil-2-tienil)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-cloro-2-propen-

1-il éster;

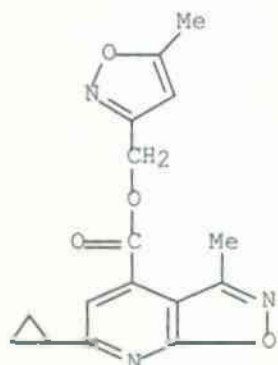
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(3,4-dihidro-1(2H)-quinolinil)-1-metil-2-oxoetil éster;
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(3,4-dimetoxifenil)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(3,4-dihidro-2(1H)-isoquinolinil)-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-il)-, metil éster;
- 10 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(4-metoxifenil)-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-[2-(3-tienil)-4-tiazolil]metil éster;
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-fluorofenil)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-piridinilmetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(3-fluoro-4-metoxifenil)-2-oxoetil éster;
- 20 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(4-fluorofenil)-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-oxo-2-(pentylamino)etil éster;
- 25 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(5-bromo-2-

metoxifenil)metil éster;

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-1-metil-2-oxo-2-feniletil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-1-metil-2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenil)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(6-cloro-3-piridinil)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-amino-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(2-cloro-6-fluorofenil)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2-bromofenil)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(1,1-dimetiletoxi)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-[2,5-dimetil-1-(3-metilbutil)-1H-pirrol-3-il]-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2,4-dihidroxifenil)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-[2-(difluorometoxi)-5-metilfenil]-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(3-metil-2-benzofuranoil)-2-oxoetil éster;

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2-metoxifenil)-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(5-metil-2-tienil)-2-oxoetil éster;
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-oxo-2-(2,3,4,5-tetrametilfenil)etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-[5-(2-tienil)-1,3,4-oxadiazol-2-il]metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metilfenil)-, metil
- 10 éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(3-fluoro-4-metoxifenil)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(7-metil-4-oxo-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-2-il)metil éster;
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(4-metoxifenil)etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-il);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(1-butil-1H-
- 20 tetrazol-5-il)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(1H-indol-3-il)-1-metil-2-oxoetil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-benzoxazolylmetil éster;
- 25 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-1-metiletil éster;

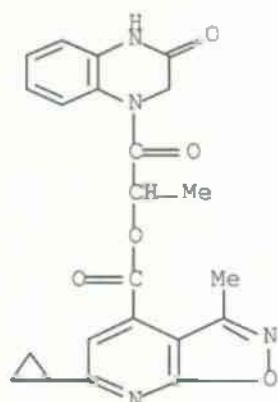
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-[(1-metilbutil)amino]-2-oxoetil éster;



- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-cianometil éster;
- 5
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-[3-(metoxycarbonil)-2-furanil]metil éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(3-metil-5-isoxazolil)metil éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(5-cloro-1,2,3-tiadiazol-4-il)metil éster;
- 10
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,1-dimetiletilo);
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-[(1,5-dimetilhexil)amino]-2-oxoetil éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenil-, metil éster;
- 15
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2-oxo-1-imidazolidinil)-2-oxoetil éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenilo);
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-metoxi-2-oxoetil éster;
- 20
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-(2,4-

dimetoxifenil)-2-oxoetil éster;

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-4-(2-oxo-1-pirrolidinil)fenil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropil-, metil éster;
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropil-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(3,5-dimetil-4-isoxazolil)metil éster;



- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-[3-(2-tienil)-1,2,4-oxadiazol-5-il]metil éster;
- 10 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-il)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2,3-diclorofenil éster;
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(8-metilimidazo[1,2-a]piridin-2-il)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-(2-etil-4-tiazolil)metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropilo);

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropil) -, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropil) -, etil éster;
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propil-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoil)-, metil
- 10 éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoil)-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenil-, etil éster
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metilo;
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletil) -, metil
- 20 éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletil) -, etil éster;

En una forma de realización preferida, son materia de la presente invención también los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



en donde

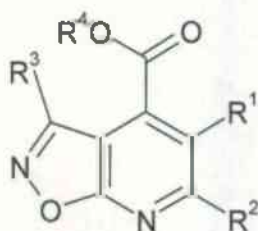
- R¹ es hidrógeno;
- R² es ciclopropilo;
- 5 R³ es hidrógeno, halógeno, hidroxil, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquilnilo, C₂-C₆-haloalquilnilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquilitio, C₁-C₆-haloalquilitio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxil, nitró, cloro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquilnilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquilitio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- 10
- 15
- X es OR⁴;
- 20 R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquilnilo;

y sus sales útiles en la agricultura; con excepción de:

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-fluorofenil)-metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-cloro-2-propen-
5 1-il éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-il)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-fluorofenil)-, metil
10 éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenil)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metilfenil)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-il);
15
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-1-metiletí éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-cianometil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,1-dimetiletílo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenil-, metil éster;
20
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropil-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-il)-, metil éster;
25

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropil) -, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropil) -, etil éster;
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propil-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoilo);
- 10 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoil)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoil)-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenil-, etil éster
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-, etil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletil) -, metil éster;
- 20 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletil) -, etil éster;

Adicionalmente, son materia de la presente invención también los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



en donde

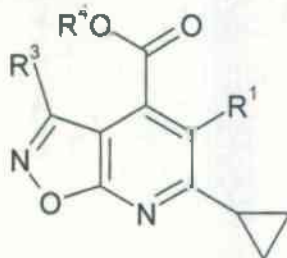
- R¹ es halógeno;
- R² hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₈-
 5 cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo;
- R³ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-
 hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-
 cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo,
 C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-
 10 halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo,
 C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-
 haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-
 (C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las
 partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales
 15 seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo,
 C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-
 C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-
 alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-
 alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- 20 X es OR⁴
- R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-
 cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo,
 C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-

haloalqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquil-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, N,N-di-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinil-C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, heterociclilo, fenilo, heterociclicarbonilo, fenilcarbonilo, heterociclicarbonil-C₁-C₆-alquilo, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, fenil-C₁-C₆-alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R⁴ y R⁵ están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, heterocicliio, fenilo; sobre todo, hidrógeno;

y sus sales útiles en la agricultura; con excepción de:

- ácido isoxazolo [5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-6-ciclopropil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-6-ciclopropil-3-metil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-3,5-dimetilo;

Adicionalmente, son materia de la presente invención también los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



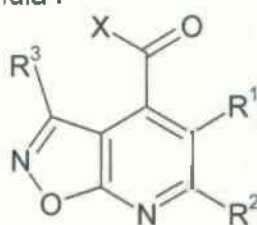
20 en donde

- R¹ es hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo, fenil-C₁-C₄-alquilo;
- R² es ciclopropilo;
- 5 R³ es hidrógeno, hidrógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;
- 15
- X es OR⁴
- 20 R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquil-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, N,N-di-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-
- 25

aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-aminocarbonil-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinil-C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, heterociclilo, fenilo, heterociclicarbonilo, fenilcarbonilo, heterociclicarbonil-C₁-C₆-alquilo, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, fenil-C₁-C₆-alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R⁴ y R⁵ están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo; sobre todo, hidrógeno;

y sus sales útiles en la agricultura.

Adicionalmente, son materia de la presente invención también los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



en donde

R¹ es hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo;

R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo;

R³ hidrógeno, halógeno, hidroxil, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-

hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo,

C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;

10 X es OR⁴, SR⁵;

R⁴ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo;

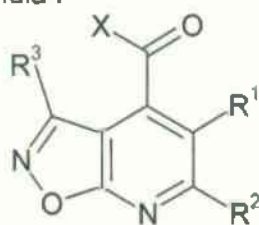
y sus sales útiles en la agricultura; con excepción de:

- 15
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-fluorofenil)-metil éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-2-cloro-2-propen-1-il éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropilo;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-il)-, metil éster;
- 20
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-fluorofenil)-, metil éster;
 - ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenil)-, metil éster;
- 25
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metilfenil)-, metil éster;

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-1-metiletil éster;
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metil-cianometil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,1-dimetiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenil-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropil-, metil éster;
- 10 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo)-, metil éster;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoilo);
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-dimetilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-propilo;
- 20 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1,1-dimetiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-ciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-fenilo;
- 25 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(4-metilfenilo);

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(3-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(4-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(4-fluorofenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(3,4-diclorofenilo);
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(2-furanoilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-propilo;
- 10 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-ciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-metilo;
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-bis(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(1,1-dimetiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-ciclopropilo;
- 20 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(3-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(2-furanoilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-6-ciclopropil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-6-ciclopropil-3-metil-, metil éster;
- 25 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-3,5-dimetilo;

Adicionalmente, son materia de la presente invención también los compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



5 en donde

R¹ es hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo;

R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxi-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo;

R³ hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-

10 hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, 15 C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, 20 C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;

X es OR⁴;

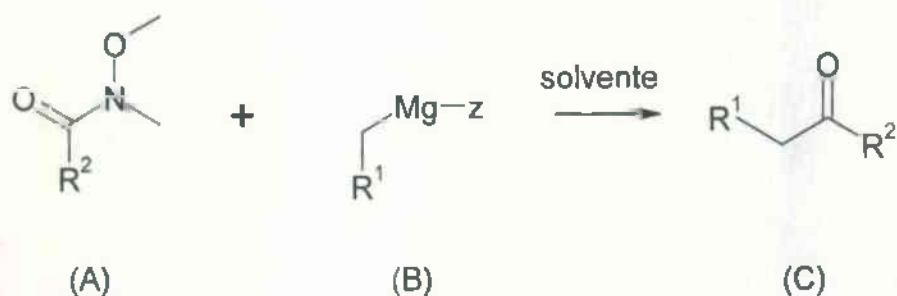
R⁴ es hidrógeno;

y sus sales útiles en la agricultura; con excepción de:

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-diciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1,1-dimetiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(4-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(2-furanoilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-ciclopropil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-dimetilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1,1-dimetiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-ciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(4-metilfenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(3-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(4-metoxifenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(4-fluorofenilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(3,4-diclorofenilo);

- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(2-furanoilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-metil-3-(1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-ilo);
- 5 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-(1-metiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-(2,2-dimetilpropilo);
- 10 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-ciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-etil-3-(1,3,5-trimetil-1H-pirazol-4-ilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-propilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 3,6-bis(1-metiletilo);
- 15 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(1,1-dimetiletilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(2,2-dimetilpropilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-ciclopropilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-fenilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(3-metoxifenilo);
- 20 • ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 6-(1-metiletil)-3-(2-furanoilo);
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-6-ciclopropil-3-metilo;
- ácido isoxazolo[5,4-b]piridin-4-carboxílico, 5-cloro-3,5-dimetilo;

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I de acuerdo con la invención pueden ser preparados valiéndose de procesos estándar de la química orgánica, por ejemplo, por medio de los siguientes procesos:



Un compuesto de la fórmula (C), donde R¹ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo o fenil-C₁-C₆-alquilo, puede ser preparado agregando un compuesto de la fórmula (B), donde Z es un halógeno, en un solvente orgánico inerte a una temperatura de -100°C a 30°C, preferentemente, a una temperatura de -80°C a 0°C, sobre todo, a -78°C, a un compuesto de la fórmula (A) bajo atmósfera de un gas inerte como p.ej. argón o nitrógeno. La mezcla de reacción se elabora ulteriormente de manera acostumbrada, por ejemplo, mezclando con agua, separando las fases, extrayendo y, si es apropiado, purificando el producto crudo cromatográficamente, preferentemente, por extracción.

Solventes apropiados son hidrocarburos alifáticos como p.ej. pentano, hexano, ciclohexano y mezclas de C₅-C₈-alcanos, hidrocarburos aromáticos como p.ej. tolueno, o-, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados como p.ej. diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno, éteres como p.ej. dietil-éter, diisopropil-éter, terc.-butil-metiléter, dioxano, anisol y tetrahidrofurano, nitrilos como p.ej. acetonitrilo y propionitrilo, así como sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida o N-metilpirrolidona.

Se da especial preferencia a tetrahidrofurano y dietil éter. Es igualmente posible usar mezclas de los solventes mencionados.

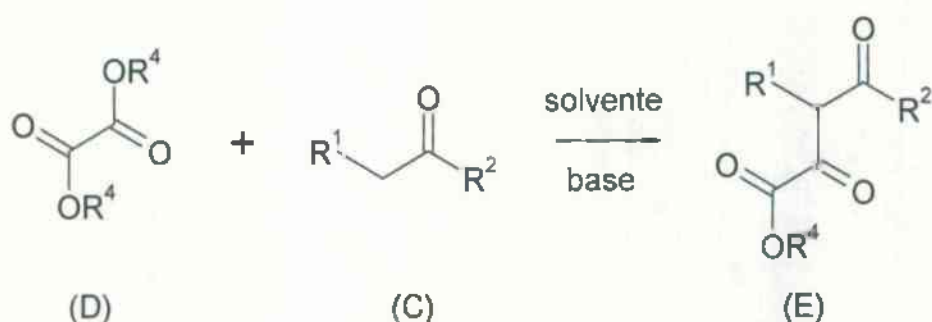
Los compuestos de la fórmula (A) se conocen de la literatura [Duncia, John V et al.

- 5 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2008, 18(2), 576-585, y Gao, S. et al. Journal of the American Chemical Society 2010, 132(1), 371-383] o pueden ser preparados de acuerdo con la literatura citada y/o se obtienen en el comercio.

Los compuestos de la fórmula (B) se obtienen en el comercio.

Un compuesto de la fórmula (C), donde R² es 1-fluorociclopropilo y R¹ es hidrógeno se

- 10 conoce de la literatura [DE 4206917].



- Un compuesto de la fórmula (E), donde R⁴ es C₁-C₆-alquilo y R¹ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo o fenil-C₁-C₆-alquilo puede ser preparado tratando una mezcla de los compuestos (D) y (C) con una base apropiada. La reacción se efectúa en un solvente orgánico inerte, a una temperatura de -100°C a 100°C, preferentemente, a una temperatura de 0°C a 80°C. La mezcla de reacción se elabora ulteriormente de manera acostumbrada, por ejemplo, mezclando con agua, separando las fases, extrayendo y, si es apropiado, purificando el producto crudo cromatográficamente.

- Bases apropiadas son, generalmente, compuestos inorgánicos, tales como hidróxidos de metal alcalino o alcalinotérreo como p.ej. hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y hidróxido de calcio, hidruros de metal alcalino o alcalinotérreo como p.ej. hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y hidruro de calcio,
- 5 carbonatos de metal alcalino o alcalinotérreo como p.ej. carbonato de litio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, así como bicarbonatos de metal alcalino como p.ej. bicarbonato de sodio, alcóxidos de metal alcalino o alcalinotérreo como p.ej. metóxido de sodio, etóxido de sodio, etóxido de potasio, terc.-butóxido de potasio, terc.-pentóxido de potasio y dimetoximagnesio, y además bases orgánicas, como p.ej.
- 10 aminas terciarias como p.ej. trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas como p.ej. coiidina, lutidina, N-metilmorfolina y 4-dimetilaminopiridina y también aminas bicíclicas.

Se da especial preferencia a metóxido de sodio y etóxido de sodio.

15

Las bases suelen ser usadas en cantidades equimolares o en exceso.

- Solventes apropiados son éteres como p.ej. dietil éter, diisopropil éter, terc.-butil metiléter, dioxano, anisol y tetrahidrofurano, nitrilos como p.ej. acetonitrilo y propionitrilo, alcoholes como p.ej. metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y
- 20 terc.-butanol, así como sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida o N-metilpirrolidona.

Se da especial preferencia a metanol o etanol. Es igualmente posible usar mezclas de los solventes mencionados.

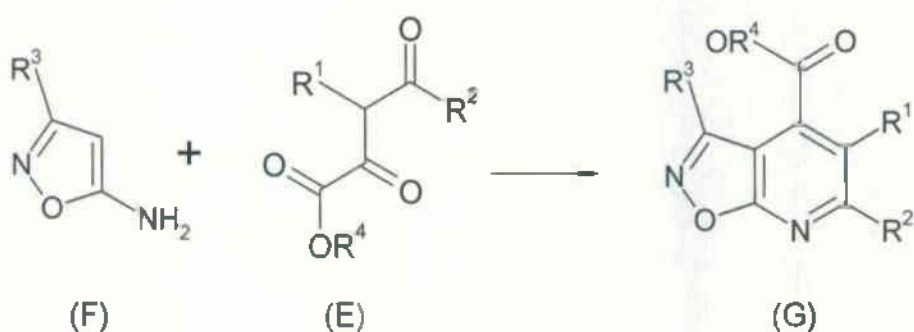
25

Métodos apropiados para la preparación de compuestos de la fórmula (E) se conocen de la literatura [Brecker, L. et al., New J. Chem., 1999, 23, 437-446]. Los sustratos necesarios para la preparación de un compuesto de la fórmula (E) se obtienen en el comercio

5

Un compuesto de la fórmula (E) donde R¹ es halógeno puede ser preparado valiéndose de métodos apropiados conocidos de la literatura [Cao, L. et al. Synlett 2009, 9, 1445-1448; Still, I. W. J. et al. Journal of Organic Chemistry 1981, 46(24), 4911-14 y Banks, R. E. et al. Journal of the Chemical Society, Chemical

10 Communications 1994, 3, 343-344].



Un compuesto de la fórmula (G) puede ser preparado mezclando un compuesto de la fórmula (E) y un compuesto de la fórmula (F) en un solvente apropiado, a una

15 temperatura de entre 65°C y 120°C, sobre todo, a 118°C. Terminada la reacción, se vierte la mezcla de reacción sobre hielo/agua. El sólido que se va formando el recogido por filtración y secado bajo alto vacío.

Solventes apropiados son:

20 alcoholes como p.ej. metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y terc.-butanol, agua, ácidos carboxílicos, como p.ej. ácido fórmico, ácido acético glacial, así

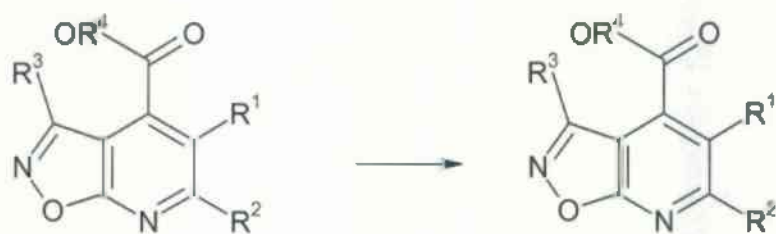
como sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida o N-metilpirrolidona.

Se da especial preferencia a ácido acético glacial.

- 5 Es igualmente posible usar mezclas de los solventes mencionados.

Métodos similares se describen, por ejemplo, en Petrosyan, V. A. et al. Russ.Chem.Bull., int.Ed., 2007, 56, 2186-2188.

- 10 Métodos apropiados para la preparación de compuestos de la fórmula (F) se conocen de la literatura [Scott, K. R. European Journal of Medicinal Chemistry 2002, 37, 635-648, Mitsuhashi, K. Journal of Heterocyclic Chemistry, 1986, 23(5), 1535-8], EP 0220947, WO 2008034008, Dines, M. B. Tetrahedron Letters 1969, 54, 4817-4819; Koichi, M. Nitrilos. IV. Synthesis of isoxazoles y pirazoles from some three-carbon
- 15 nitrilos, Takeda Kenkyushoho 1971, 30(3), 475-92. Algunos de los compuestos de la fórmula (F) se obtienen en el comercio.



(G) R_1 =halógeno

(G)

- Un compuesto de la fórmula (G) donde R^1 es hidroxilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi pueden ser preparados from un compuesto de la fórmula
- 20 (G) donde R^1 es halógeno valiéndose de métodos apropiados conocidos de la literatura, por ejemplo, Dejardin, J. V. et. al. Bulletin de la Societe Chimique de

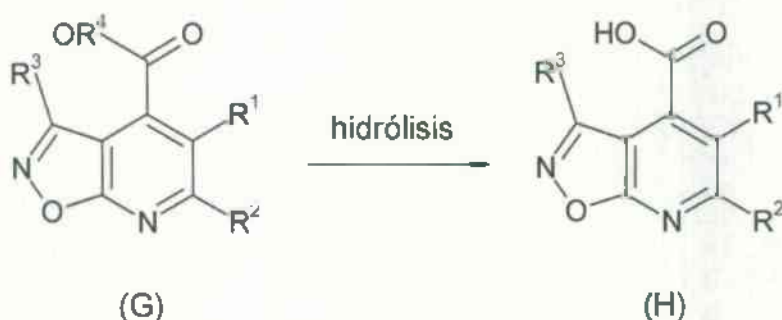
France 1976, 3-4, Pt. 2, 530-532, Ouyang, X. et. al. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2005, 15(23), 5154-5159 y Magee, T. V. et. al. Journal of Medicinal Chemistry 2009, 52(23), 7446-7457.

- 5 Un compuesto de la fórmula (G) donde R^1 es hidrógeno y R^3 es halógeno puede ser preparado mezclando un compuesto de la fórmula (G) donde R^1 es hidrógeno y R^3 es OH con hidrohaluro de piridina, ácido (sobre todo, H_3PO_4) y oxihaluro fosfórico y agitando a una temperatura de entre $50^\circ C$ y $120^\circ C$, sobre todo, a $90^\circ C$ durante 1-5 h. El exceso en oxihaluro fosfórico se evapora bajo alto vacío. La mezcla de reacción se
- 10 elabora ulteriormente de manera acostumbrada, por ejemplo, agregando un solvente apropiado y solución acuosa de bicarbonato de metal alcalino, separando las fases, extrayendo y, si es apropiado, purificando el producto crudo cromatográficamente. Solventes apropiados son etil acetato, diclorometano, dietil éter, cloroformo, terc-butilmetiléter, diisopropil éter. Bicarbonatos de metal alcalino apropiados son
- 15 bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de calcio.

- Un compuesto de la fórmula (G) donde R^1 es hidrógeno y R^3 es C_1 - C_6 -alcoxi puede ser preparado agregando un alcohol alquílico de C_1 - C_6 y un compuesto de la fórmula (G) donde R^1 es hidrógeno y R^3 es OH, a la solución previamente preparada, agitada de
- 20 di- C_1 - C_6 -alquil azodicarboxilato y triarilfosfina (sobre todo, trifenilfosfina) en un solvente apropiado (preferentemente, tetrahidrofurano) a una temperatura de entre $-20^\circ C$ y $25^\circ C$, sobre todo, a $0^\circ C$. La reacción se realiza a una temperatura de entre $-20^\circ C$ a $100^\circ C$, preferentemente, a una temperatura de entre $40^\circ C$ a $80^\circ C$. La mezcla de reacción se elabora ulteriormente de manera acostumbrada, por ejemplo, eliminando
- 25 el solvente bajo vacío y purificando el producto crudo cromatográficamente.

Solventes apropiados son éteres como p.ej. dietil-éter, diisopropil-éter, terc.-butilmetiléter, dioxano, anisol y tetrahidrofurano. Se da especial preferencia a tetrahidrofurano y dietil éter. Es igualmente posible usar mezclas de los solventes mencionados.

5



Un compuesto de la fórmula (H) puede ser preparado a partir de un compuesto de la fórmula (G) por hidrólisis en presencia de un ácido apropiado o un catalizador básico, en un solvente apropiado a temperaturas de entre 0°C y 80°C, sobre todo, a 25°C, bajo calentamiento convencional o irradiación con microondas [ver, por ejemplo, Carrigan, C. N. J. Med. Chem. 2002, 45, 2260-2276 y Ghosh, P. Journal of Teaching y Research in Chemistry 2008, 15(2), 54-57].

15 Catalizadores apropiados son:

ácidos inorgánicos tales como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido perclórico, ácido sulfúrico.

Se da especial preferencia a ácido clorhídrico y ácido sulfúrico.

20

Los ácidos suelen ser usados en cantidades catalíticas, pero también pueden ser usados en cantidades equimolares o en exceso.

Catalizadores apropiados son:

hidróxidos de metal alcalino o alcalinotérreo como p.ej. hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y hidróxido de calcio.

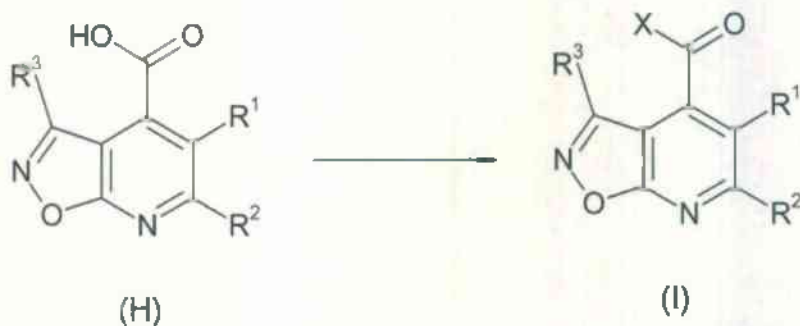
- 5 Se da especial preferencia a hidróxidos de metal como p.ej. hidróxido de sodio.

Las bases suelen ser usadas en cantidades catalíticas, pero también pueden ser usados en cantidades equimolares o en exceso.

- 10 Solventes apropiados son éteres como p.ej. dietil éter, diisopropil éter, terc.-butil metil éter, dioxano, anisol y tetrahidrofurano, agua, alcoholes como p.ej. metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y terc.-butanol, así como sulfóxido de dimetilo.

Se da especial preferencia a tetrahidrofurano.

- 15 Es igualmente posible usar mezclas de los solventes mencionados.



Un compuesto de la fórmula (H) puede ser esterificado, tioesterificado, transformado con una amida o un haluro de ácido, preferentemente, cloruro de ácido, de un

- 20 compuesto de la fórmula (I) donde X es OR⁴ (ver, por ejemplo, Arnab, P. et. al. *Angewandte Chemie, International Edition* 2010, 49(8), 1492-1495), SR⁵ (see, por ejemplo, Silvestri, M. A. et. al. *Journal of Medicinal Chemistry* 2004, 47(12), 3149-

3162), NR⁶R⁷ (see, por ejemplo, Kuhn, B. et. al. Journal of Medicinal Chemistry 2010, 53(6), 2601-2611) bajo condiciones estándar.

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I son apropiadas como herbicidas. Son
5 apropiadas como tales o como composición formulada de manera adecuada (composición herbicida). En la forma usada en la presente solicitud, los términos "composición formulada" y "composición herbicida" son sinónimos.

Las composiciones herbicidas que comprenden las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I controlan muy eficazmente la vegetación indeseada en áreas no cultivadas,
10 especialmente, cuando se aplican en altas cantidades. Actúan contra un amplio espectro de hierbas latifoliadas y gramíneas en cultivos, tales como trigo, arroz, maíz, soya y algodón sin causar daños dignos de mencionar en las plantas de cultivo. Este efecto se observa sobre todo cuando son aplicadas en bajas cantidades.

15 Dependiendo del método de aplicación en cuestión, las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I o las composiciones que comprenden las mismas pueden ser empleados, adicionalmente, en múltiples otros cultivos de plantas para eliminar plantas indeseadas. Ejemplos de cultivos apropiados son los siguientes:

20 *Allium cepa*, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Avena sativa*, *Beta vulgaris* spec. altissima, *Beta vulgaris* spec. rapa, *Brassica napus* var. napus, *Brassica napus* var. napobrassica, *Brassica rapa* var. silvestris, *Brassica oleracea*, *Brassica nigra*, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis*
25 *sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine*

max, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*, *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa spec.*, *Nicotiana*
 5 *tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus spec.*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus avium*, *Prunus persica*, *Pyrus communis*, *Prunus armeniaca*, *Prunus cerasus*, *Prunus dulcis* y *Prunus domestica*, *Ribes sylvestre*, *Ricinus communis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Sinapis alba*, *Solanum tuberosum*, *Sorghum bicolor* (*s. vulgare*), *Theobroma cacao*, *Trifolium pratense*, *Triticum aestivum*, *Triticale*, *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis*
 10 *vinifera* y *Zea mays*.

Cultivos preferidos son los siguientes: *Arachis hypogaea*, *Beta vulgaris spec. altissima*, *Brassica napus var. napus*, *Brassica oleracea*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea*
 15 *arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cynodon dactylon*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hordeum vulgare*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*, *Medicago sativa*, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus*
 20 *vulgaris*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus dulcis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Solanum tuberosum*, *Sorghum bicolor* (*s. vulgare*), *Triticale*, *Triticum aestivum*, *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis vinifera* y *Zea mays*.

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I de acuerdo con la invención pueden ser
 25 usadas también en plantas genéticamente modificadas. El término "plantas

genéticamente modificadas" se refiere a plantas, cuyo material genético ha sido modificado mediante el uso de técnicas recombinantes de ADN, en una forma que bajo circunstancias naturales no se habría podido obtener sencillamente mediante métodos de cultivo, mutaciones o recombinaciones naturales. Típicamente, uno o más genes han sido integrados en el material genético o una planta genéticamente modificada para mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluyen, pero no están limitados a modificaciones objetivo post-transicionales de proteína(s), oligo- o polipéptidos, por ejemplo, por glicosilación o adiciones de polímeros, tales como partes prenilados, acetilados o farnesilados o partes de PEG.

Plantas que han sido modificadas por cultivo, mutagénesis o tecnología genética, por ejemplo, se han hecho tolerantes a aplicaciones de específicas clases de herbicidas, como p.ej. herbicidas auxínicos, tales como dicamba o 2,4-D; herbicidas blanqueadores, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD) o inhibidores de fitoeno desaturasa (PDS); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonilureas o imidazolinonas; inhibidores de enolpiruvil shikimato 3-fosfato sintasa (EPSP), tales como glifosato; inhibidores de glutamina sintasa (GS), tales como glufosinato; inhibidores de protoporfirinógeno-IX oxidasa; inhibidores de la biosíntesis lipídica, tales como inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa (ACCase); o herbicidas de oxinilo (a saber, bromoxinilo o ioxinilo), como resultado de métodos de cultivo convencionales o métodos de tecnología genética; además, plantas que se han hecho resistentes a múltiples de herbicidas mediante múltiples modificaciones genéticas, tales como resistencia tanto a glifosato como a glufosinato o tanto a glifosato como a un herbicida de otra clase, como p.ej. inhibidores ALS, inhibidores

- HPPD, herbicidas auxínicos, o inhibidores de la ACCasa. Estas tecnologías de resistencia a herbicidas se describen, por ejemplo, en *Pest Management Science* 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; *Weed Science* 57, 2009, 108; *Australian Journal of Agricultural Research* 58, 2007, 708; *Science* 316, 2007, 1185; y las referencias allí citadas. Varias plantas cultivadas se han hecho tolerantes a herbicidas mediante métodos de cultivo convencionales (mutagénesis), p.ej. Clearfield® colza de verano (Canola, BASF SE, Alemania) que son tolerantes frente a imidazolinonas, p.ej. imazamox, o ExpressSun® girasoles (DuPont, EE.UU), que son tolerantes frente a sulfonil ureas, p.ej. tribenurona.
- 10 Se han aplicado métodos de tecnología genética para hacer plantas cultivadas, tales como soya, algodón, maíz, remolachas y colza, tolerantes frente a herbicidas, tales como glifosato, imidazolinonas y glufosinato, algunas de los cuales están en desarrollo o ya se obtienen en el comercio bajo las marcas comerciales RoundupReady® (tolerante a glifosato, Monsanto, EE.UU), Cultivance® (tolerante a imidazolinona, BASF SE, Alemania) y LibertyLink® (tolerante a glufosinato, Bayer Cropscience, Alemania)..
- 15

- Además, están cubiertas también las plantas, que mediante el uso de técnicas de recombinación de ADN son capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente, aquellas del género bacteriano *Bacillus*, sobre todo, de *Bacillus thuringiensis*, como p.ej. δ -endotoxinas, tales como CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), tales como VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias colonizadores de nematodos, tales como *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp.;
- 20
- 25 toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpiones, toxinas de

arácnidos, toxinas de avispas, u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas vegetales, tales como lectinas de alverjas o de centeno; aglutininas; inhibidores de proteinasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de

5 patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosoma (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas metabólicas de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdiesteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesteroina oxidasas, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores del canal de iones, p.ej. inhibidores del canal de sodio o del canal de

10 calcio; esterasa de hormonas juveniles; receptores de hormonas diuréticos (receptores de helicoquinina); estilbeno sintasas, bibencillo sintasa, quitinasas o glucanasas. Estas toxinas se pueden producir en las plantas también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de otra manera. Las proteínas híbridas están caracterizadas por una nueva combinación de dominios proteicos (véase p.ej.

15 WO 2002/015701). Otros ejemplos de tales toxinas o plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar tales toxinas se divulgan, por ejemplo, en EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/18810 y WO 03/52073. Los métodos para producir tales plantas genéticamente

20 modificadas son conocidos al experto en el arte y se describen, por ejemplo, en las publicaciones arriba mencionadas. Estas proteínas de insectos contenidas en las plantas genéticamente modificadas proporcionan a las plantas que producen estas proteínas una protección frente a plagas nocivas de ciertos grupos taxonómicos de artrópodos, especialmente, escarabajos (Coleoptera), moscas (Diptera), y mariposas y polillas (Lepidoptera) y a nematodos fitoparásitos (Nematoda). Plantas genéticamente

25 modificadas capaces de sintetizar uno o más proteínas insecticidas se describen, por

- ejemplo, en las publicaciones arriba mencionadas. Algunas se obtienen en el comercio, tales como RendimientoGard® (cultivares de maíz que producen toxinas de Cry1Ab), RendimientoGard® Plus (cultivares de maíz que producen toxina de Cry1Ab y Cry3Bb1), Starlink® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry9c), Herculex® RW (cultivares de maíz que producen Cry34Ab1, Cry35Ab1 y la enzima fosfinotricina-N-acetiltransferasa [PAT]); NuCOTN® 33B (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® I (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® II (cultivares de algodón que producen las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab2); VIPCOT® (cultivares de algodón que producen una toxina VIP); NewLeaf® (cultivares de papa que producen la toxina Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, biteGard®, protecta®, Bt11 (p.ej. Agrisure® CB) y Bt176 de Syngenta Seeds SAS, Francia, (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab y la enzima PAT), MIR604 de Syngenta Seeds SAS, Francia (cultivares de maíz que producen una versión modificada de la toxina Cry3A, véase WO 03/018810), MON 863 de Monsanto Europe S.A., Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry3Bb1), IPC 531 de Monsanto Europe S.A., Bélgica (cultivares de algodón que producen una versión modificada de la toxina Cry1Ac) y 1507 de Pioneer Overseas Corporation, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1F y la enzima PAT).
- Adicionalmente, están comprendidas también plantas, que con la ayuda de medidas de tecnología genética producen una o varias proteínas, que proporcionan una mayor resistencia o tolerancia contra patógenos bacterianos, virales o fúngicos, como p.ej. las llamadas proteínas relacionadas a patogénesis (proteínas PR, véase EP-A 0 392 225), proteínas de resistencia (p.ej. variedades de papa, que producen dos genes de resistencia contra *Phytophthora infestans* de la papa salvaje mejicana

Solanum bulbocastanum) o T4-lisozina (p.ej. variedades de papas, que por la producción de esta proteína son resistentes a bacterias, como p.ej. *Erwinia amylovora*).

Los métodos para producir tales plantas genéticamente modificadas son generalmente conocidos al experto en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones

5 arriba mencionadas.

Adicionalmente, están comprendidas también plantas, cuya productividad se ha incrementado con la ayuda de métodos de tecnología genética, por ejemplo, cuyo rendimiento (p.ej. producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o proteína), cuya tolerancia de sequedad, salinidad u otros

10 factores medioambientales que limitan el crecimiento o la tolerancia frente a plagas y patógenos bacterianos o virales han sido incrementados.

Adicionalmente, están comprendidas también plantas, cuyos ingredientes se han modificado con la ayuda de métodos de tecnología genética para mejorar la nutrición humana o animal por ejemplo, cultivos oleaginosos que producen ácidos omega-3-

15 grasos de larga cadena o ácidos omega-9-grasos no saturados que mejoran la salud (p.ej. colza Nexera®, DOW Agro Sciences, Canadá).

Adicionalmente, están comprendidas también plantas, que se han modificado mediante métodos de tecnología genética para mejorar la producción de materias primas, por ejemplo, papas que producen mayores cantidades de amilopectina (p.ej. papa Amflora®, BASF SE, Alemania).

20

Además, se ha encontrado, que las Isoxazolo[5,4-b]piridinas of la fórmula I también

25

son apropiadas para la desfoliación y/o desecación de partes de plantas, para lo cual entran en consideración plantas de cultivo, tales como algodón, papas, colza, girasoles, soya o habichuelas, especialmente, algodón. Se encontraron agentes para la desecación y /o desfoliación de plantas, procesos para la obtención de estos

5 agentes y procesos para la desecación y/o desfoliación de plantas usando las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I.

En calidad de desecantes, las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I son especialmente apropiadas para secar las partes emergidas a la superficie de plantas de cultivo, tales como papas, colza, girasoles y soya, pero también cereales. De este

10 modo se facilita una cosecha completamente mecanizada de estas importantes plantas de cultivo.

Además, es de interés económico la facilitación de la cosecha mediante la caída concentrada en un momento dado o la reducción de la adhesión en el árbol en frutas

15 cítricas, olivas u otros géneros y frutas de pepa y de hueso y frutas de cáscara. El mismo mecanismo, a saber, la promoción de la formación de un tejido separador entre la parte del fruto o de la hoja y la parte del vástago también es esencial para una desfoliación bien controlada de plantas útiles, especialmente, algodón.

20 Además, acortando el intervalo de tiempo en que las plantas de algodón individuales moduran resulta en una mejor calidad de las fibras después de la cosecha.

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I, o las composiciones herbicidas que comprenden las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I, se pueden usar, por ejemplo,

25 en forma de soluciones acuosas, polvos, suspensiones directamente pulverizables,

también como suspensiones o dispersiones acuosas o oleicas altamente concentradas, u otro tipo de suspensión, dispersión, emulsión, dispersión de aceite, pasta, polvo, material de esparcimiento o granulado, por pulverización atomización, empolvado, esparcimiento o regado. Las formas de aplicación dependen del uso deseado, pero en todo caso debe estar asegurada una distribución lo más fina posible de los ingredientes activos de acuerdo con la invención.

Las composiciones herbicidas comprenden una cantidad efectiva como herbicida de por lo menos una isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I y los auxiliares acostumbrados para la formulación de agentes fitosanitarios.

Ejemplos de sustancias auxiliares usuales para la formulación de agentes fitosanitarios son sustancias auxiliares inertes, sustancias portadoras sólidas, sustancias tensoactivas (tales como dispersantes, coloides protectores, emulsionantes, humectantes y adhesivos), espesantes orgánicos e inorgánicos, anticongelantes, desespumantes, opcionalmente, colorantes y para formulaciones para semillas, adhesivos.

Los expertos en la materia están suficientemente familiares con las recetas de tales formulaciones.

Ejemplos de espesantes (es decir, compuestos, que proporcionan a la formulación un comportamiento de flujo modificado, a saber, un alta viscosidad en estado de reposo y una baja viscosidad en estado movido) son polisacáridos, tales como gomas de xantano (Kelzan® de la Cía. Kelco), Rhodopol® 23 (Rhône Poulenc) o Veegum® (Cía.

R.T. Vanderbilt), así como minerales orgánicos e inorgánicos estratificados, tales como Attaclay® (Cía. Engelhardt).

Ejemplos de antiespumantes son emulsiones de silicona (como por ejemplo Silikon®

- 5 SRE, Cía. Wacker o Rhodorsil® de la Cía. Rhodia), alcoholes de larga cadena, ácidos grasos, sales de ácidos, compuestos de flúor orgánicos y sus mezclas.

Bactericidas pueden ser agregados para la estabilización de la formulación herbicida acuosa. Ejemplos de bactericidas son las bactericidas basadas en diclorofeno y

- 10 alcohol bencílico hemiformal (Proxel® de la Cía. ICI o Acticide® RS de la Cía. Thor Chemie y Kathon® MK de la Cía. Rohm & Haas), así como derivados de isotiazolinona, tales como alquilisotiazolinonas y benzisotiazolinonas (Acticide MBS de la Cía. Thor Chemie).

- 15 Ejemplos de antiespumantes son etilenglicol, propilenglicol, urea o glicerina.

Ejemplos de materias colorantes son pigmentos poco solubles en agua como también colorantes solubles en agua. Como ejemplos sean mencionados los colorantes conocidos bajo las denominaciones Rhodamin B, C.I. pigmento rojo 112 y C.I. rojo

- 20 solvente 1, así como pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento anaranjado 43, pigmento anaranjado 34, pigmento anaranjado 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento

pardo 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

Ejemplos de adhesivos son polivinilpirrolidona, polivinilacetato, polivinil alcohol y

5 tilosa.

Como aditivos inertes son apropiados, por ejemplo:

Fracciones de aceite mineral de punto de ebullición mediano hasta alto, tales como kerosina o aceite diesel, además, aceites de alquitrán de carbón, así como aceites de
10 origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, p.ej. parafina, tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas o sus derivados, bencenos alquilados o sus derivados, alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, cetonas, tales como ciclohexanona o solventes fuertemente polares, p.ej. aminas, tales como N-metilpirrolidona o agua.

15

Sustancias portadoras apropiadas incluyen sustancias portadoras líquidas y sólidas

Sustancias portadoras líquidas incluyen p.ej. los solventes no acuosos, tales como hidrocarburos cíclicos e hidrocarburos aromáticos, p.ej. parafinas, tetrahidronaftaleno, naftaleno alquilados y sus derivados, bencenos alquilados y sus derivados, alcoholes,
20 tales como metanol, etanol, propanol, butanol y ciclohexanol, cetonas, tales como ciclohexanona, solventes fuertemente polares, p.ej. aminas, tales como N-metilpirrolidona, y agua, así como sus mezclas.

Sustancias portadoras sólidas son tierras minerales, tales como ácidos silícicos,

25 silicageles, silicatos, talco, caolín, caliza, cal, bol, loess, arcilla, dolomita, tierra de

diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, plásticos molidos, así como abonos, tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos vegetales, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras de nueces, polvos de celulosa u otras sustancias

5 portadoras sólidas.

Surfactantes apropiados (adyuvantes, humectantes, adhesivos, dispersantes, así como emulsionantes) son las sales alcalinas, alcalinotérreas y amónicas de ácidos sulfónicos aromáticos, p.ej. ácidos ligninosulfónicos (p.ej. tipos Borrespers,

- 10 Borregaard), ácidos fenolsulfónicos, ácidos naftalensulfónicos (tipos Morwet, Akzo Nobel) y ácido dibutilnaftalensulfónico (tipos Nekal, BASF SE), así como de ácidos grasos, alquil- y alquilaril sulfonatos, alquil sulfatos, lauril éter sulfatos y sulfatos de alcohol graso, así como sales de hexa-, hepta- y octadecanoles sulfatados, así como de glicol éter de alcohol graso, condensados de naftaleno sulfonado y sus derivados
- 15 con formaldehído, condensados de naftaleno o bien de ácidos naftalensulfónicos con fenol y formaldehído, polioxietilen octilfenol éter, isooctilfenol, octilfenol o nonilfenol etoxilados, alquilfenil-, tributilfenilpoliglicol éter, alquilaril poliéter alcoholes, alcohol isotridecílico, condensados de alcohol graso/óxido de etileno, aceite castor etoxilado, polioxietilenaquil éter o polioxipropilenaquil éter, alcohol laurílico poliglicol éter
- 20 acetato, éster de sorbitol, lejjas residuales lignino-sulfíticas, así como proteínas, proteínas desnaturadas, polisacáridos (p.ej. metilcelulosa), almidones modificados en forma hidrófoba, alcohol polivinílico (tipos Mowiol, Clariant), policarboxilatos (BASF SE, tipos Sokalan), polialcoxilatos, polivinilamina (BASF SE, tipos Lupamin), polietilenimina (BASF SE, tipos Lupasol) , polivinilpirrolidona y sus copolímeros.

Polvos, agentes de esparcimiento y empolvado se pueden preparar mezclando o moliendo conjuntamente las sustancias activas con una sustancia portadora sólida.

Granulados, p.ej. granulados recubiertos, impregnados y granulados homogéneos se
5 pueden preparar uniendo los principios activos con por lo menos una sustancia portadora sólida.

Las formas de aplicación acuosa se obtienen a partir de concentrados de emulsión, suspensiones, pastas, polvos humectables o granulados dispersables en agua
10 agregando agua.

Para la obtención de emulsiones, pastas o dispersiones de aceite se pueden homogeneizar los compuestos de la fórmula I, o bien como tales o disueltas en un aceite o solvente, mediante humectantes, adherentes, dispersantes o emulsionantes,
15 en agua. Alternativamente, se pueden preparar a partir del compuesto activo, humectantes, adherentes, dispersantes o emulsioantes y, opcionalmente, solventes, concentrados que pueden ser diluidos con agua.

Las concentraciones de los compuestos de la fórmula I en las preparaciones listas
20 para el uso (formulaciones) pueden variar ampliamente. En general, las formulaciones comprenden aproximadamente de 0,001 a 98% en peso, preferentemente, de 0,01 a 95% en peso de por lo menos un ingrediente activo. Los ingredientes activos se emplean en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, 95% a 100% (de acuerdo con el espectro de RNM).

e^o

En la formulación de las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I de acuerdo con la presente invención están presentes los ingredientes activos en forma suspendida, emulsionada o disuelta. La formulación de acuerdo con la invención puede usarse en forma de soluciones acuosas, polvos, suspensiones, también suspensiones o

5 dispersiones acuosas, oleicas altamente concentradas u de otro tipo, emulsiones acuosas, microemulsiones acuosas, suspo-emulsiones acuosas, dispersiones de aceite, pastas, polvos, materiales para esparcir o granulados.

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I de acuerdo con la presente invención

10 pueden ser formulados, por ejemplo, como sigue:

1. Productos a ser diluidos con agua

A Concentrados solubles en agua

15 10 partes en peso de compuesto activo se disuelven con 90 partes en peso de agua o un solvente soluble en agua. Alternativamente, se agregan humectantes u otras sustancias auxiliares. Cuando se diluye con agua se disuelve el compuesto activo. De esta forma se obtiene una formulación con 10% en peso de contenido en compuesto activo.

20

B Concentrados dispersables

20 partes en peso de compuesto activo se disuelven en 70 partes en peso de ciclohexanona adicionando 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Cuando se diluye en agua se obtiene una dispersión. El contenido

25 en compuesto activo es de 20 % en peso

C Concentrados emulsionables

15 partes en peso de compuesto activo se disuelven en 75 partes en peso de un solvente orgánico (p.ej. alquil-aromáticos)-agregando dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite castor (cada vez 5 partes en peso). Cuando se diluye con
5 agua se obtiene una emulsión. La formulación tiene 15 % en peso de contenido en compuesto activo.

D Emulsiones

25 partes en peso de compuesto activo se disuelven en 35 partes en peso de un
10 solvente orgánico (p.ej. alquil-aromáticos)-agregando dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite castor (cada 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce mediante una máquina de emulsión (p.ej. Ultraturax) en 30 partes en peso de agua y se convierte en una emulsión homogénea. Cuando se diluye con agua se obtiene una emulsión. La formulación tiene un contenido en compuesto activo de 25 % en peso.

15

E Suspensiones

20 partes en peso de compuesto activo se desmenuzan bajo adición de 10 partes en peso de dispersantes y humectantes y 70 partes en peso de agua o un solvente orgánico en un molino de agitación de bolas dando una suspensión fina de compuesto
20 activo. Cuando se diluye con agua se obtiene una suspensión estable del compuesto activo. El contenido en compuesto activo en la formulación asciende a 20 % en peso.

F Granulados dispersables en agua y granulados solubles en agua

50 partes en peso de compuesto activo se muelen finamente bajo adición de 50 partes
25 en peso de dispersantes y emulsionantes y se transforman mediante aparatos técnicos

(p.ej. extrusora, torre de pulverización, capa fluidizada) en granulados dispersables en agua o granulados solubles en agua. Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión o solución estable del compuesto activo. La formulación tiene un contenido en compuesto activo de 50 % en peso.

5

G Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua

75 partes en peso de compuesto activo se muelen bajo adición de 25 partes en peso de dispersantes y emulsionantes, así como silicagel en molino de rotor-estator.

Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión o solución estable del

10 compuesto activo. El contenido en compuesto activo de la formulación asciende a 75 % en peso.

H Formulaciones de gel

En un molino de bolas se muelen 20 partes en peso del compuesto activo, 10 partes

15 en peso de dispersante, 1 parte en peso de gelificante y 70 partes en peso de agua o un solvente orgánico dando una suspensión fina. Cuando se diluye con agua se obtiene una suspensión estable con 20 % en peso de contenido en compuesto activo.

2. Productos para la aplicación directa

20

I Polvos

5 partes en peso de compuesto activo se muelen finamente y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente particulado. De esta forma se obtiene un agente de espolvoreo con 5 % en peso de contenido en compuesto activo.

25

J Granulados (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de compuesto activo se muelen finamente y se unen con 99,5 partes en peso de sustancia portadoras. Procesos habituales para este fin son la extrusión, el secado por pulverización o la capa fluidizada. De este modo se obtiene un
5 granulado para la aplicación directa con 0,5 % en peso de contenido en compuesto activo.

K Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

10 partes en peso de compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de un
10 solvente orgánico p.ej. xileno. Así se obtiene un producto para la aplicación directa con 10 % en peso de contenido en compuesto activo.

Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, suspensiones, pastas, polvos pumectables o granulados dispersables en
15 agua por adición de agua.

Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I o las composiciones herbicidas que comprenden las mismas pueden ser aplicadas antes de la emergencia, después de la
20 emergencia o antes de la plantación, o conjuntamente con las semillas de una planta de cultivo. Es igualmente posible aplicar la composición formulada o los compuestos activos usando semillas de una planta de cultivo pretratadas con las composiciones formuladas o compuestos activos. Si los ingredientes activos son menos tolerados por ciertas plantas de cultivo se pueden usar técnicas de aplicación en las que se
25 pulverizan las composiciones herbicidas con la ayuda de un equipo pulverizador de tal

forma, que en la medida posible no entren en contacto con las hojas de las plantas de cultivo, mientras que los ingredientes activos caigan sobre las hojas de las plantas indeseadas que crecen debajo de las plantas de cultivo, o sobre la superficie del suelo desnudo (post-directed, lay-by).

5

En otra forma de realización, las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I o las composiciones herbicidas mediante tratamiento de semillas. El tratamiento de semillas comprende, esencialmente, todos los procedimientos familiares al experto en la materia (desinfección de semillas, recubrimiento de semillas, empolvado de semillas, enjuagado de semillas, recubrimiento de semillas con una película, recubrimiento multicapa de semillas, incrustación de semillas, goteado de semillas y pelletizado de semillas pelleting) basados en las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I de acuerdo con la invención o las composiciones preparadas a partir de las mismas. Aquí se pueden aplicar las composiciones herbicidas en forma diluida o no diluida.

15

El término "semillas" abarca todos los tipos de semillas, como p.ej. granos, semillas, frutos, tubérculos, estacas y formas similares. Preferentemente, el término semillas se refiere a granos y semillas.

Como semillas se pueden usar las semillas de las plantas útiles arriba mencionadas, pero también las semillas de plantas transgénicas o de plantas obtenidas por métodos de cultivo convencionales.

20

Las cantidades de aplicación de las isoxazolo[5,4-b]piridinas activas de la fórmula I de acuerdo con la presente invención (cantidad total de isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I) oscilan de 0,1 g/ha a 3000 g/ha, preferentemente, de 10 g/ha a 1000 g/ha de

25

sustancia activa (s.a.), dependiendo del objetivo de control, la temporada, las plantas objetivo y el estadio de crecimiento.

En otra forma de realización preferida de la invención, las cantidades de aplicación de las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I varían de 0,1 g/ha a 5000 g/ha y
5 preferentemente, de 1 g/ha a 2500 g/ha o de 5 g/ha a 2000 g/ha de sustancia activa (s.a.).

En otra forma de realización preferida de la invención, la cantidad de aplicación de las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I es de 0,1 a 1000 g/ha, preferentemente, 1 a
10 750 g/ha, más preferentemente, de 5 a 500 g/ha, de sustancia activa.

Para el tratamiento de semillas se usan las isoxazolo[5,4-b]piridinas I, generalmente, en una cantidad de 0,001 a 10 kg por 100 kg de semillas.

15

Para ampliar el espectro de acción y para alcanzar efectos sinérgicos, se pueden mezclar las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I con un amplio número de representativos de otros grupos de ingredientes activos herbicidas o reguladores del
20 crecimiento y entonces aplicarlos conjuntamente con ellos. Componentes apropiados para las mezclas son, por ejemplo, 1,2,4-tiadiazoles, 1,3,4-tiadiazoles, amidas, ácido aminofosfórico y sus derivados, aminotriazoles, anilides, ácidos (het)ariloxialcanoicos y sus derivados, ácido benzoico y sus derivados, benzotiadiazinonas, 2-aroil-1,3-ciclohexanedionas, 2-aroil-1,3-ciclohexanodionas, 2-hetaroil-1,3-ciclohexanodionas,
25 hetaril aril cetonas, bencilisoxazolidinonas, derivados de meta-CF₃-fenilo, carbamatos,

- ácido quinolincarboxílico y sus derivados, cloroacetanilidas, derivados de ciclohexenona oxim éter, diazinas, ácido dicloropropiónico y sus derivados, dihidrobenzofuranos, dihidrofuran-3-onas, dinitroanilinas, dinitrofenoles, difenil éteres, dipiridilos, ácidos halocarboxílicos y sus derivados, ureas, 3-feniluracilos, imidazoles, imidazolinonas, N-fenil-3,4,5,6-tetrahidroftalimidias, oxadiazoles, oxiranos, fenoles, ésteres ariloxy- y hetariloxifenoxipropiónicos, ácido fenilacético y sus derivados, ácido 2-fenilpropiónico y sus derivados, pirazoles, fenilpirazoles, piridazinas, ácido piridinacarboxílico y sus derivados, pirimidil éteres, sulfonamidas, sulfonilureas, triazinas, triazinonas, triazolinonas, triazolcarboxamidas, uracilos, fenil pirazolinas e isoxazolinas y derivados de los mismos.

- Además puede ser beneficioso aplicar las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I por si solas o en combinación con otros herbicidas, o también en forma de una mezcla con otros agentes fitosanitarios, por ejemplo, conjuntamente con agentes para controlar plagas u hongos fitopatógenos o bacterias. También es de interés la miscibilidad con soluciones de sales minerales, que se usan para el tratamiento de deficiencias nutritivas o en microelementos. Otros aditivos, tales como aceites no fitotóxicos y concentrados de aceite también pueden ser agregados.

- Además, puede ser beneficioso aplicar las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I en combinación con aseguradores. Aseguradores son compuestos químicos que previenen o reducen daños en plantas útiles sin tener mayor impacto en la acción herbicida de las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I frente a plantas indeseadas. Pueden ser aplicados o bien antes de la siembra (p.ej. en el tratamiento de las semillas, vástagos o plántulas) o durante las aplicaciones de pre-emergencia o post-

emergencia de la planta útil. Los aseguradores y las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I pueden ser aplicados simultáneamente o sucesivamente.

Aseguradores apropiados son, p.ej.: ácidos (quinolin-8-oxi)acéticos, ácidos 1-fenil-5-haloalquil-1H-1,2,4-triazol-3-carboxílicos, ácidos 1-fenil-4,5-dihidro-5-alquil-1H-pirazol-3,5-dicarboxílicos, ácidos 4,5-dihidro-5,5-diaril-3-isoxazol-carboxílicos, dicloroacetamidas, alfa-oximinofenilacetoni-trilos, acetofenonoximas, 4,6-dihalo-2-fenilpirimidinas, amidas N-[[4-(aminocarbonil)fenil]sulfonil]-2-benzoicas, anhídrido 1,8-naftálico, ácidos 2-halo-4-(haloalquil)-5-tiazol carboxílicos, fosfortiolatos y N-alquil-O-fenilcarbamatos y 2-oxo-nicotinamidas y y sus sales agronómicamente aceptables, y, siempre que tengan una función ácido, sus derivados agronómicamente aceptables, tales como amidas, ésteres, y tioésteres.

En lo sucesivo se ilustra la preparación de isoxazolo[5,4-b]piridinas representativas de la fórmula I por medio de ejemplos:

15

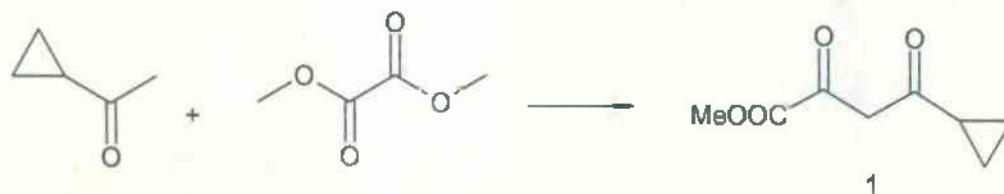
Los espectros de RNM fueron registrados en un Bruker Avance II 300. Los LC-MS fueron registrados en un sistema de Waters con las siguientes condiciones:

Columna: XTerra MS C₁₈ 5µm (4.6x100mm)

Gradiente: de 95% H₂O/5% MeOH a 100% MeOH en 8 min

20 Flujo: 1,5mL/min

Alternativamente, se usó un Shimadzu Nexera UHPLC en combinación con Shimadzu LCMS 20-20, ESI; columna: Phenomenex Kinetex 1,7µm XB-C18 100A;



Síntesis del compuesto 1

Na (14,67g, 0,64mol) se disolvió en MeOH seco (0,8L) y se agregó una solución de ciclopropilmetilcetona (50g, 0,59mol) y dimetiloxalato (70,2g, 0,59mol) en MeOH seco (0,2L) en gotas a 0°C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 24h y a reflujo durante la noche. Se agregó agua (0,5L) y se eliminó el metanol bajo presión reducida. La solución acuosa se lavó con Et₂O (150mL), se acidificó a pH=2 con 2M H₂SO₄ y se extrajo con Et₂O (3x150mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca, dando el compuesto 1 (55,6g, 55%), que se usó sin purificación ulterior.

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 14.61 (br, 1H), 6.84 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 1.95-1.82 (m, 1H), 1.26-1.20 (m, 2H), 1.10-1.00 (m, 2H).



Síntesis del compuesto 2

Una mezcla del compuesto 1 (0,9g, 5,3mmol) y 5-amino-3-(2-feniletíl)isoxazol (1,0g, 5,3mmol) en AcOH (16mL) se agitó a reflujo durante 4h. La mezcla de reacción se vertió en hielo/agua (100mL). El sólido formado se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío. Se obtuvieron 1,5g (79%) del compuesto 2.

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 7.62 (s, 1H), 7.27-7.11 (m, 5H), 3.93 (s, 3H), 3.43-3.37 (m, 2H)
3.03-2.97 (m, 2H), 2.22-2.10 (m, 1H), 1.24-1.17 (m, 2H), 1.13-1.05 (m, 2H).

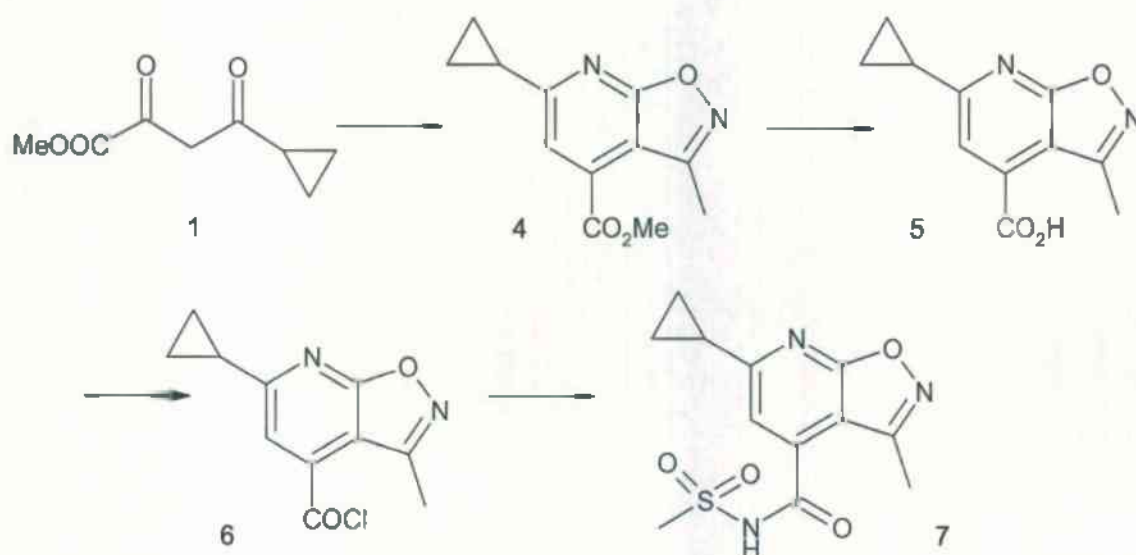
MS: m/z= 323[M+H]⁺, 345 [M+Na]⁺

5 Síntesis del compuesto 3

Una solución del compuesto 2 (1,0g, 3,1mmol) se agitó a temperatura ambiente en una mezcla 1:1 de THF/1N NaOH (15mL) durante 2h. La reacción se concentró bajo vacío, la solución acuosa se acidificó a pH=2 con 10% HCl y se extrajo con AcOEt (3x10mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se agitó en petróleo /Et₂O 10:1 y el sólido obtenido se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío dando el compuesto 3 (0,82g, 85%).

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 7.81 (s, 1H), 7.31-7.13 (m, 5H), 3.52-3.46 (m, 2H) 3.12-3.05 (m, 2H), 2.34-2.22 (m, 1H), 1.34-1.28 (m, 2H), 1.26-1.17 (m, 2H).

15 MS: m/z= 331 [M+Na]⁺, 353 [M-H+2Na]⁺, 639 [2M-2H+3Na]⁺



Síntesis del compuesto 4

Una mezcla del compuesto 1 (3g, 17,6mmol) y 5-amino-3-metilisoxazol (1,73g, 17,6mmol) en AcOH (44mL) se agitó a reflujo durante 2h. La mezcla de reacción se
5 vertió en hielo/agua (100mL). El sólido formado se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío. Se obtuvieron 3,9g (97%) de compuesto 4.

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 7.69 (s, 1H), 4.02 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 2.26-2.15 (m, 1H), 1.28-1.21 (m, 2H), 1.19-1.11 (m, 2H).

MS: m/z = 233 $[\text{M}+\text{H}]^+$

10

Síntesis del compuesto 5

Una solución del compuesto 4 (2,7g, 11,6mmol) se agitó a temperatura ambiente en una mezcla 1:1 de THF/1N NaOH (52mL) durante 1,5h. La reacción se
15 concentró bajo vacío, la solución acuosa se acidificó a pH=2 con 10% HCl y el sólido formado se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío dando el compuesto 5 (2,4g, 94%).

$^1\text{H-RNM}$ ($\text{DMSO}-d_6$): δ = 7.78 (s, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.46-2.36 (m, 1H), 1.18-1.01 (m, 4H).

20 MS: m/z = 219 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Síntesis del compuesto 6

Una mezcla del compuesto 5 (0,7g, 3,2mmol) en SOCl_2 (6.4mL) se reflujo
25 durante la noche. Los componentes volátiles se eliminaron bajo vacío usando tolueno

como co-solvente. Se obtuvieron 760mg del compuesto 6 que se usó sin purificación ulterior.

Síntesis del compuesto 7

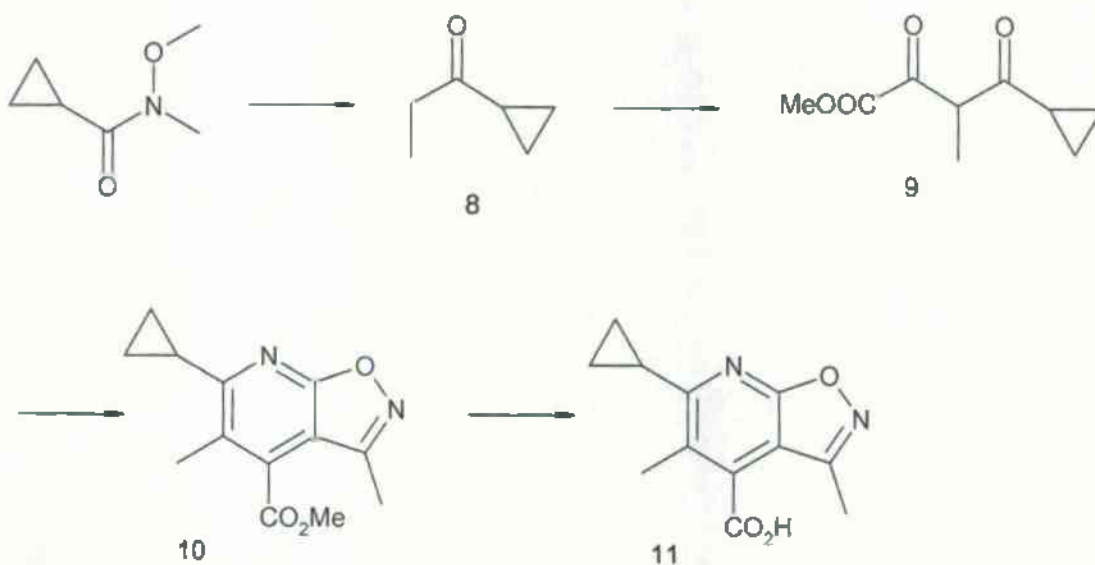
5

A una solución del compuesto 6 (0,38g, 1,6mmol) en diclorometano seco (8mL) se agregó metanosulfonamida (0,17g, 1,8mmol) y N,N-diisopropiletilamina (0,25g, 1,9mmol) a 0°C. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12h. La mezcla de reacción se vertió en ácido cítrico acuoso al 5% (20mL) y se extrajo con 10 diclorometano (3x10mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se agitó en Et₂O y el sólido formado se coleccionó por filtración y después del secado se purificó por TLC (SiO₂, CHCl₃/MeOH 95:5) prep. Se obtuvieron 160mg (34%) del compuesto 7.

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 7.36 (s, 1H), 3.37 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.22-2.11 (m, 1H), 1.25-1.05 (m, 4H).

15

MS: m/z=347 [M+Na]⁺, 671 [2M+Na]⁺.



Síntesis del compuesto 8

A una solución de N-metoxi-N-metil ciclopropanocarboxamida (8g, 62mmol) en THF seco (93mL) se agregó en gotas a -78°C una solución 1M de bromuro de etilmagnesio en THF (62mL, 62mmol) bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente a 0°C , se vertió en una solución de tampón de fosfato (150mL, pH=7) y se extrajo con Et_2O (3x50mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO_4 y se concentró a $45^{\circ}\text{C}/400\text{mbar}$. El residuo consistió en una mezcla 1:2 del compuesto 8/THF (9,2g, ~3,7g de producto, ~61%) y se usó sin purificación ulterior.

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 2.54 (c, $J=7.33$ Hz, 2H), 1.94-1.84 (m, 1H), 1.04 (t, $J=7.33$ Hz, 3H), 1.00-0.92 (m, 2H), 0.85-0.76 (m, 2H).

Síntesis del compuesto 9

Na (0,93g, 40,4mmol) se disolvió en MeOH seco (52mL) y se agregó una solución del compuesto 8 (3,7g, 37,7mmol) y dimetiooxalato (4,45g, 37,7mol) en MeOH seco (15mL) en gotas a 0°C . La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18h. Se agregó dimetiooxalato (4,45g, 37,7mol) y NaOMe al 30% en MeOH (7.5mL) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 18h. Se agregó más NaOMe al 30% en MeOH (2.5mL) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 18h antes de verterla en agua (200mL). Se eliminó el metanol bajo presión reducida. La solución acuosa se lavó con Et_2O (25mL), se acidificó a pH=2 con H_2SO_4 2M y se extrajo con Et_2O (3x50mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO_4 y se

concentró hasta quedar seca, dando el compuesto 9 (5.1g, ~82%) que se usó sin purificación ulterior.

Síntesis del compuesto 10

5

Una mezcla del compuesto 9 (5g, 27,1mmol) y 5-amino-3-metilisoxazol (2,66g, 27,1mmol) en AcOH (78mL) se agitó a reflujo durante 1h. La mezcla de reacción se concentró hasta quedar seca y el residuo se disolvió en AcOEt (50mL) y se lavó con NaHCO₃ acuoso, sat. (2x15mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se purificó por cromatografía de columna rápida (SiO₂, c-Hex/AcOEt) dando el compuesto 10 (1,3g, 18%).

10

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 2.50 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.30-2.20 (m, 1H), 1.30-1.22 (m, 2H), 1.16-1.07 (m, 2H).

MS: m/z=269 [M+Na]⁺.

15

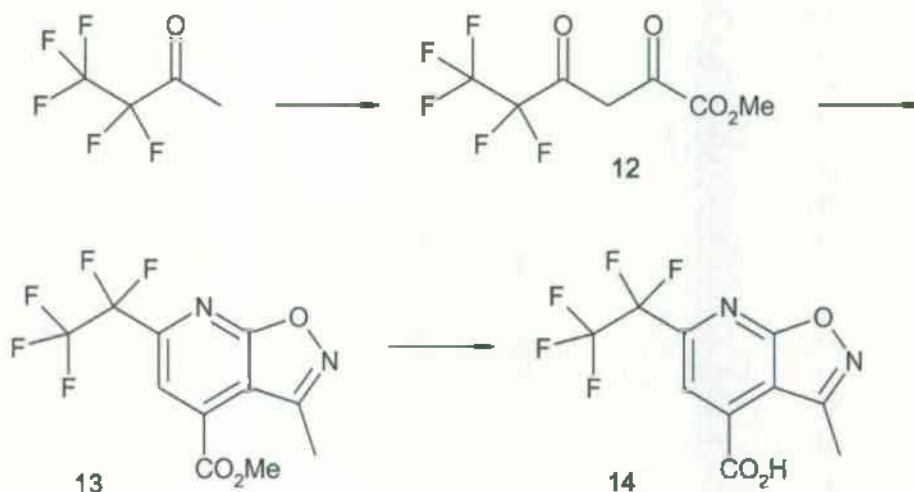
Síntesis del compuesto 11

Una solución del compuesto 10 (0,6g, 2,1mmol) se agitó a temperatura ambiente durante 12h en una mezcla 1:1 de THF/1N NaOH (12mL). La mezcla de reacción se concentró bajo vacío, la solución acuosa se acidificó a pH=2 con 10% HCl y se extrajo con diclorometano (3x25mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se agitó en petróleo éter/Et₂O 10:1 y el sólido obtenido se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío dando el compuesto 11 (0,41g, 85%).

20

^1H -RNM (MeOD- d_4): δ = 2.44 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 1H), 1.10-1.00 (m, 2H).

MS: m/z =233 $[\text{M}+\text{H}]^+$, 255 $[\text{M}+\text{Na}]^+$, 277 $[\text{M}-\text{H}+2\text{Na}]^+$.



Síntesis del compuesto 12

Na (0,76g, 33,1mmol) se disolvió en MeOH seco (42mL) y se agregó una
 10 solución de 3,3,4,4,4-pentafluoro-butan-2-ona (5g, 30,9mmol) y dimetiloxalato (3,64g,
 30,9mmol) en MeOH seco (13mL) en gotas a 0°C . La mezcla de reacción se agitó a
 temperatura ambiente durante la noche. Se agregó agua (50mL) y se eliminó el
 metanol bajo presión reducida. La solución acuosa se lavó con Et_2O (25mL), se
 acidificó a $\text{pH}=2$ con 2M H_2SO_4 y se extrajo con Et_2O (3x25mL). La capa orgánica se
 15 secó sobre MgSO_4 y se concentró hasta quedar seca, dando el compuesto 12 (2g,
 ~26%) que se usó sin purificación ulterior.

^1H -RNM (CDCl_3): δ =6.28 (s, 1H), 3.92 (s, 3H).

Síntesis del compuesto 13

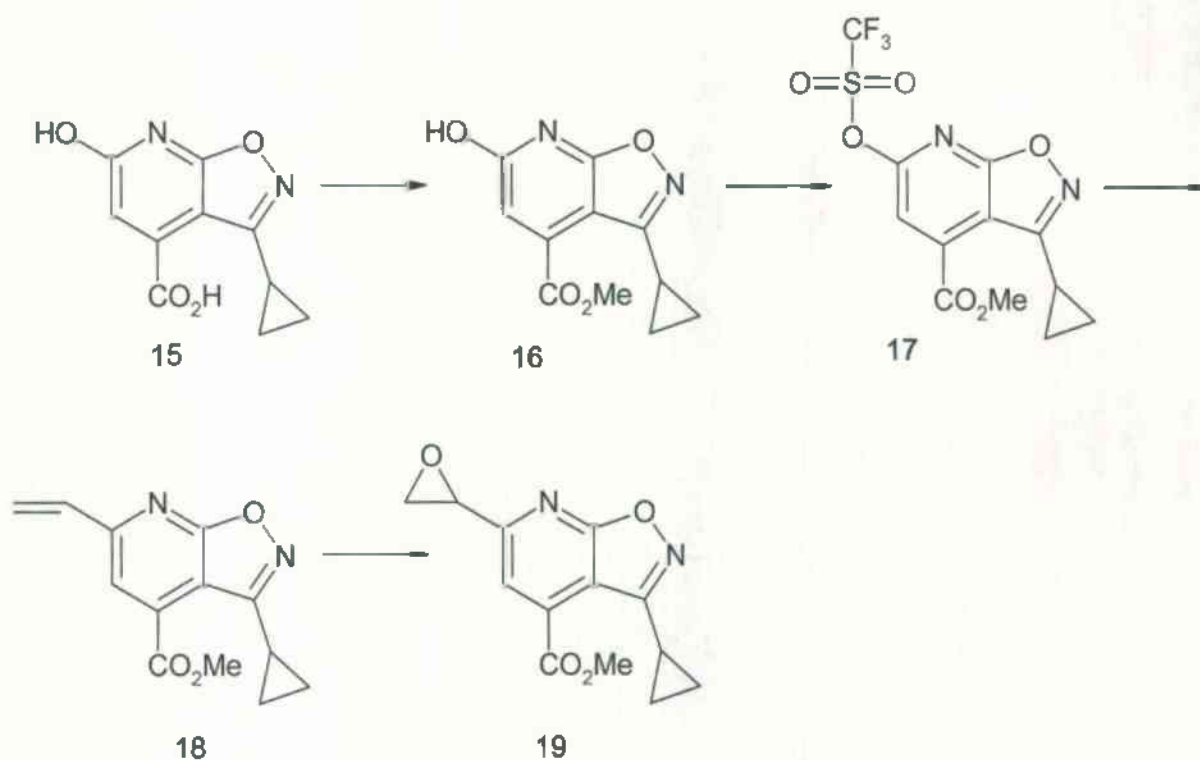
Una mezcla del compuesto 12 (2g, 8,1mmol) y 5-amino-3-metilisoxazol (0,67g, 6,8mmol) en AcOH (20mL) se agitó a reflujo durante 1h. La mezcla de reacción se
5 vertió en hielo/agua (50mL) y se extrajo con Et₂O (3x25ml). La capa orgánica se lavó con NaHCO₃ acuoso, sat. (2x15mL), se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. La mezcla de reacción cruda se purificó por cromatografía de columna rápida (SiO₂, c-Hex/AcOEt) dando 60mg de compuesto 13 (2.4%).

10 Síntesis del compuesto 14

Una solución del compuesto 13 (56mg, 0,2mmol) se agitó a temperatura ambiente durante 4h en una mezcla 1:1 de THF/1N NaOH (2mL). La reacción se concentró bajo vacío, la solución acuosa se acidificó a pH=2 con 10% HCl y se extrajo
15 con diclorometano (3x5mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se agitó en petróleo éter/Et₂O 10:1 y el sólido obtenido se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío dando el compuesto 14 (44mg, 88%).

¹H-RNM (CDCl₃): δ=8.31 (s, 1H), 2.86 (s, 3H).

20 MS: m/z= 319 [M+Na]⁺, 341 [M-H+2Na]⁺



Síntesis del compuesto 16

- 5 Una mezcla del compuesto 15 (0,85g, 3,9mmol) y ácido p-toluenosulfónico (0,27g, 1,5mmol) en MeOH (17mL) se refujo durante 4 días. El solvente se eliminó y el residuo se diluyó con una mezcla de CHCl₃/2-propanol 7:3 (50mL) y se lavó con NaHCO₃ acuoso, sat. (2x15mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. Se obtuvieron 620mg (69%) del compuesto 16 que se
- 10 usó sin purificación ulterior.

¹H-RNM (CDCl₃): δ=7.19 (s, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.59-2.44 (m, 1H), 1.25-1.17 (m, 2H), 1.15-1.00 (m, 2H).

MS: m/z= 335 [M+H]⁺, 357 [M+Na]⁺

Síntesis del compuesto 17

A una solución del compuesto 16 (0,19g, 0,8mmol) en diclorometano seco (3mL) se agregó a 0°C piridina (80mg, 1mmol) y anhídrido trifluorometanosulfónico (0,29g, 1mmol) y la mezcla se agitó a esta temperatura durante 1/2h y a temperatura ambiente durante 8h. La mezcla de reacción se diluyó con agua (3mL) y se extrajo con DCM (2x5mL). La capa orgánica se secó sobre MgSO_4 y se concentró hasta quedar seca. El producto de reacción crudo se purificó por cromatografía de columna rápida dando 190mg (63%) del compuesto 17.

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ =7.66 (s, 1H), 4.07 (s, 3H), 2.71-2.57 (m, 1H), 1.22-1.10 (m, 4H).

MS: m/z = 367 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Síntesis del compuesto 18

Una mezcla del compuesto 17 (150mg, 0,41mmol), LiCl (90mg, 2,1mmol), tributilvinil estaño (170mg, 0,53mmol) y dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) (50mg, 0,07mmol) en DMF seco (5mL) se agitó a 80°C durante 1h. Después de enfriar, se agregó una solución de NaF (390mg) en agua (4.5mL) y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 1h. La mezcla de reacción se filtró a través de un tampón de celita y la torta de filtro se lavó con AcOEt . Las capas del filtrado se separaron, la capa acuosa se extrajo con AcOEt (3x10mL) y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO_4 y se concentraron hasta quedar secas. El producto de reacción crudo se purificó por cromatografía de columna rápida dando 80mg (80%) del compuesto 18. El compuesto así obtenido presentó algunas impurezas procedentes del reactivo de estaño.

^1H -RNM (CDCl_3): δ =7.81 (s, 1H), 6.92 (dd, J =17.4, 10.7 Hz, 1H), 6.51 (d, J = 17.4 Hz, 1H), 5.73 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.67-2.57 (m, 1H), 1.20-1.14 (m, 2H), 1.13-1.05 (m, 2H).

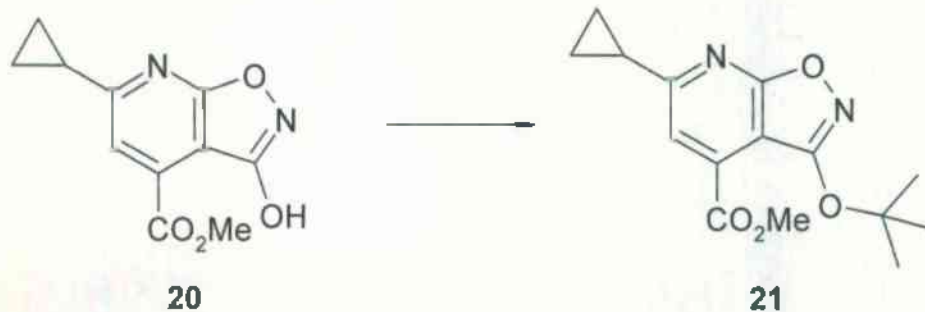
MS: m/z = 467 $[\text{M}+\text{Na}]^+$.

5

Síntesis del compuesto 19

A una solución del compuesto 18 (100mg, 0,41mmol) en diclorometano (4mL) se agregó a 0°C una solución de ácido meta-cloroperoxibenzoico (71mg, 0,41mmol) en diclorometano (4mL), que se había secado previamente sobre MgSO_4 . La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 24h, antes de agregar una nueva solución de ácido meta-cloroperoxibenzoico (71mg, 0,41mmol) en diclorometano (4mL). Esta operación se repitió dos veces. La mezcla se lavó con NaHCO_3 acuoso sat. (3x10mL) y la capa orgánica se secó sobre MgSO_4 y se concentró hasta quedar seca. El residuo se purificó mediante TLC prep. (SiO_2 , c-Hex/AcOEt), dando 45mg (41%) del compuesto 19. El compuesto 19 así obtenido contenía algún ácido meta-clorobenzoico.

^1H -RNM (CDCl_3): δ =7.69 (s, 1H), 4.19-4,14 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.29 (dd, J = 5.1, 4.1 Hz, 1H), 3.01 (dd, J = 5.3, 2.1 Hz, 1H), 2.70-2.57 (m, 1H), 1.20-1.14 (m, 2H), 1.14-1.07 (m, 2H).



Síntesis del compuesto 20

Una mezcla del compuesto 1 (17g, 0,1mol) y 5-amino-isoxazol-3-ona (10g, 0,1mol) en ácido acético (AcOH) (100mL) se agitó a reflujo durante 2h. La mezcla de
5 reacción se vertió en hielo/agua (200mL). El sólido formado se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío. Se obtuvieron 19g (82%) del compuesto 20.

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 10.30 (bs, 1H), 7.69 (s, 1H), 4.12 (s, 3H), 2.27-2.20 (m, 1H), 1.29-1.22 (m, 2H), 1.21-1.12 (m, 2H).

MS: m/z = 235 $[\text{M}+\text{H}]^+$

10

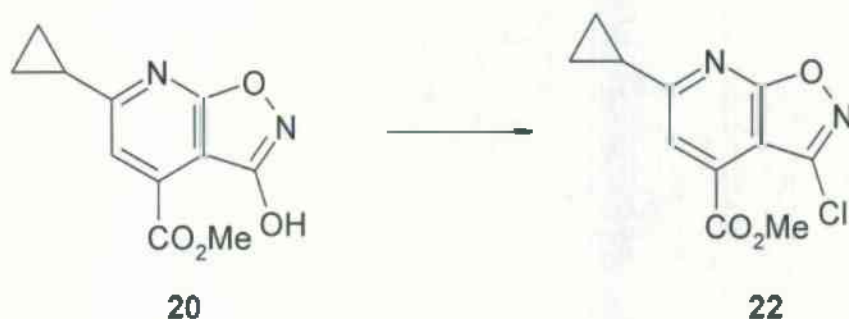
Síntesis del compuesto 21

A una solución agitada de trifenilfosfina (12,3 g, 46,9 mmol) en THF seco (150 mL) se agregó en gotas diisopropil azodicarboxilato (9,5 g, 46,9 mmol) a 0°C bajo
15 atmósfera de nitrógeno, y la mezcla se agitó durante 20 min. Enconces se agregó a 0°C t-BuOH (3,5 g, 47,2 mmol) y el compuesto 20 (10 g, 42,7 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 h y se calentó a 40°C, se agitó durante la noche. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y se agregó otra porción de trifenilfosfina (12,3 g, 46,9 mmol), t-BuOH (3,5 g, 47,2 mmol) y diisopropil
20 azodicarboxilato (9,5 g, 46,9 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 h y se calentó a 60°C, y se agitó durante la noche. El solvente se eliminó bajo presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía de columna (SiO_2 , c-Hex/AcOEt) dando el compuesto 21 (5,6 g, rendimiento: 45%)

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 7.52 (s, 1H), 4.00 (s, 3H), 2.25-2.16 (m, 1H), 1.65 (s, 9H), 1.28-1.21 (m, 2H), 1.19-1.11 (m, 2H).

25

MS: $m/z = 235$ $[M-tBu+H]^+$

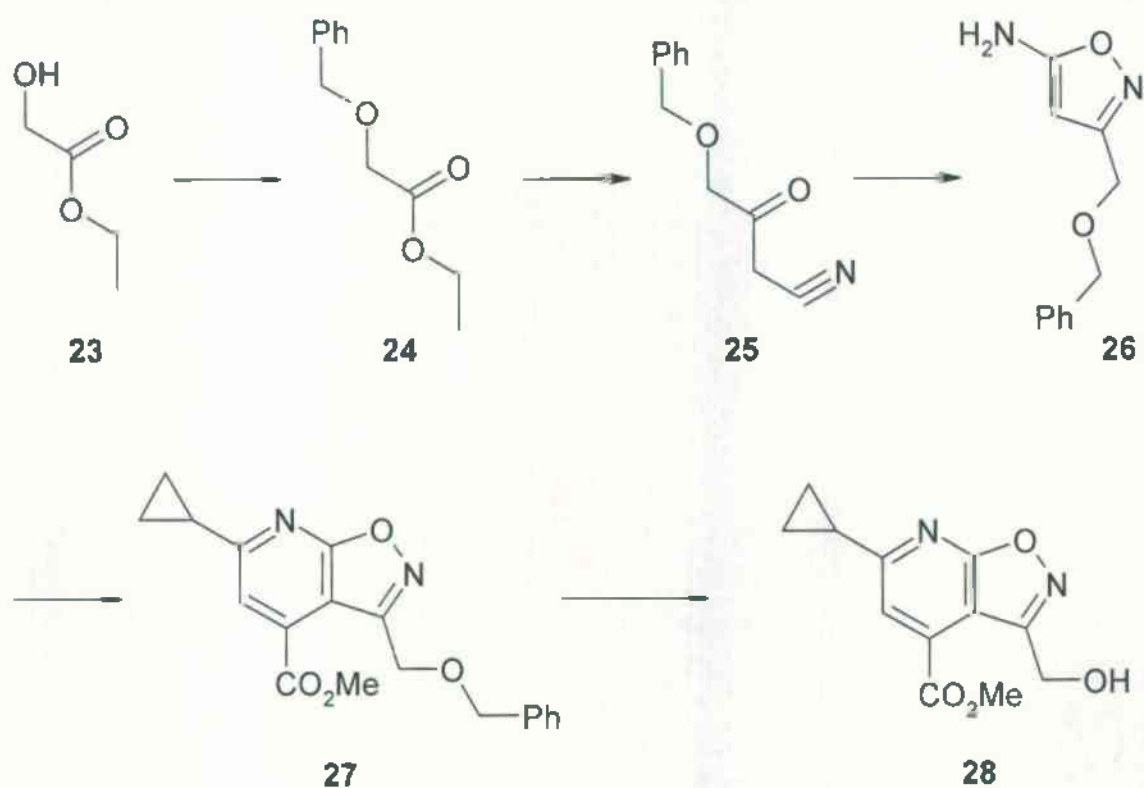


5 Síntesis del compuesto 22

Una mezcla del compuesto 20 (12g, 0,05mol), piridina clorhidrato (20g, 0,17mol), H_3PO_4 (3,6g, 0,04mol) y $POCl_3$ (120 mL) se agitó a $90^\circ C$ durante 3h. El exceso de $POCl_3$ se evaporó bajo alto vacío. La restante mezcla se disolvió en etil acetato y se neutralizó lentamente con $NaHCO_3$ a $0^\circ C$. La capa orgánica se lavó con salmuera y agua, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se purificó mediante cromatografía de columna (SiO_2 , c-Hex/AcOEt) dando el compuesto 22 (6,5 g, rendimiento: 50%).

1H -RNM ($CDCl_3$): $\delta = 7.72$ (s, 1H), 4.05 (s, 3H), 2.29-2.20 (m, 1H), 1.32-1.26 (m, 2H), 1.25-1.18 (m, 2H).

MS: $m/z = 253$ $[M+H]^+$



Síntesis del compuesto 24

- 5 A la solución de hidroxiacetato de etilo 23 (99,6g, 0,96mol) en THF (1,5L) se agregó bajo atmósfera de nitrógeno en porciones NaH (42g, 1,0mol: 60% en aceite mineral) a 0°C. La mezcla se agitó a 0°C durante 30 min y se agregó yoduro de tetrabutilamonio (35,3g, 0,10mol) y bromuro de bencilo (163,6g, 0,96mol). La mezcla se dejó calentar a hasta temperatura ambiente y se agitó a esta temperatura durante
- 10 12h. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se secó sobre MgSO₄, el solvente se evaporó bajo alto vacío y el producto crudo se destiló (121 °C /4mBar) dando el compuesto 24 (135,5 g, rendimiento: 73%).

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 7.41- 7.22 (m, 5H), 4.65 (s, 2H), 4.27 (q, 2H), 4.11 (s, 2H), 1.25 (t, 3H).

Síntesis del compuesto 25

Tetrahidrofurano (1L) y NaH (30g, 0,77mol: 60% en aceite mineral) se agitó bajo atmósfera de nitrógeno y se calentó a 50°C. A esta mezcla se agregó una
5 solución en tetrahidrofurano del compuesto 24 (135,5g, 0,70mol) y acetonitrilo (37,1g, 0,90mol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 12h. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con MTBE (metil terc-butil éter). La fase acuosa se acidificó con ácido cítrico (pH=3) y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con salmuera y agua, se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta
10 quedar seca. El residuo se purificó mediante cromatografía de columna (SiO₂, c-Hex/AcOEt) dando el compuesto 25 (41 g, rendimiento: 31%)

¹H-RNM (CDCl₃): δ= 7.40- 7.21 (m, 5H), 4.58 (s, 2H), 4.10 (s, 2H), 3.61 (s, 2H).

15

Síntesis del compuesto 26

Una mezcla del compuesto 25 (63,3g, 0,33mol), hidroxiloamina clorhidrato (30,2g, 0,43mol) y acetato de sodio (82,3g, 1mol) en EtOH (1L) se agitó a temperatura
20 ambiente durante 4h. Se eliminó el solvente bajo alto vacío. La mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con cloruro metilénico. La capa orgánica se lavó con salmuera y agua, se secó sobre MgSO₄ y se concentró hasta quedar seca. El residuo se purificó mediante cromatografía de columna (SiO₂, c-Hex/AcOEt) dando el compuesto 26 (13.8 g, rendimiento: 20%).

25

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 7.40- 7.22 (m, 5H), 5.20 (s, 1H), 4.55 (bs, 4H), 4.46 (s, 2H).

Síntesis del compuesto 27

5 Una mezcla del compuesto 1 (11,5g, 0,07mol) y 26 (13,8g, 0,07mol) en AcOH (150mL) se agitó a reflujo durante 2h. La mezcla de reacción se vertió en hielo/agua (200mL). El sólido formado se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío. Se obtuvieron 16,5g (72%) del compuesto 27.

10 $^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 7.68 (s, 1H), 7.32 (s, 5H), 5.03 (s, 2H), 4.60 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 2.26-2.20 (m, 1H), 1.30-1.25 (m, 2H), 1.20-1.12 (m, 2H).

MS: m/z = 339 $[\text{M}+\text{H}]^+$

Síntesis del compuesto 28

15

BCl_3 (5.9mL, 5,91 mmol; 1M en CH_2Cl_2) se agregó lentamente a una solución del compuesto 27 (1g, 2,96 mmol) en CH_2Cl_2 (20mL) a -78°C y la mezcla de reacción se agitó a esta temperatura durante 2h. Se agregó NaHCO_3 saturado, acuoso. Las capas se separaron y la capa orgánica se lavó con salmuera y agua, se secó sobre MgSO_4 y se concentró hasta quedar seca. El residuo se agitó con diisopropil éter y el sólido formado se coleccionó por filtración y se secó bajo alto vacío dando el compuesto 29 (0,5 g, rendimiento: 68%).

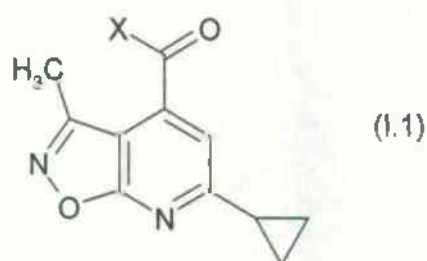
20

$^1\text{H-RNM}$ (CDCl_3): δ = 7.80 (s, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.07 (s, 3H), 3.88 (bs, 1H), 2.28-2.20 (m, 1H), 1.30-1.25 (m, 2H), 1.20-1.15 (m, 2H).

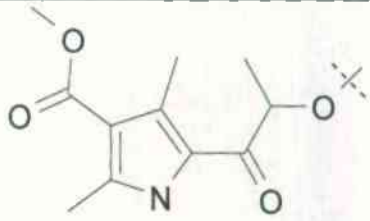
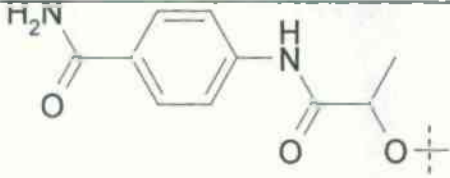
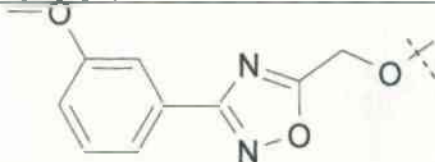
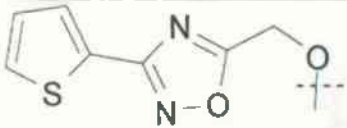
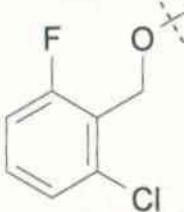
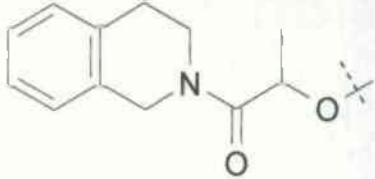
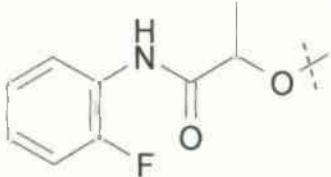
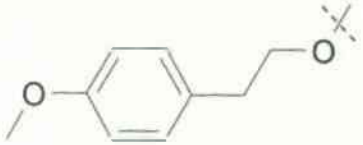
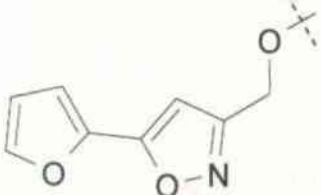
25

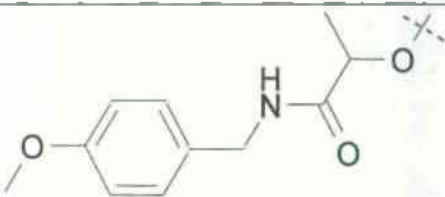
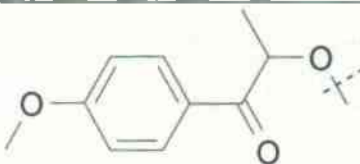
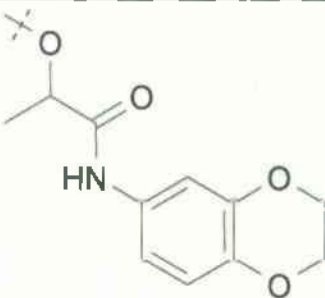
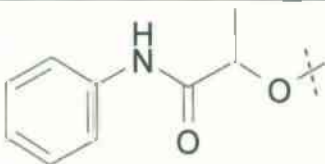
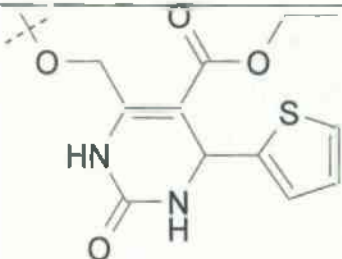
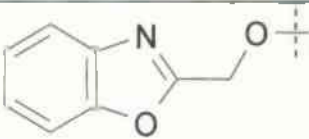
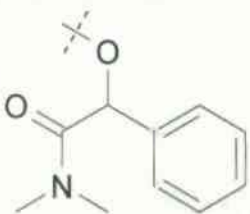
Las isoxazolo[5,4-b]piridinas de acuerdo con las tablas 7 a 14 de abajo se prepararon de acuerdo con los métodos arriba descritos; los compuestos caracterizados con "(-)" no forman parte de la presente invención:

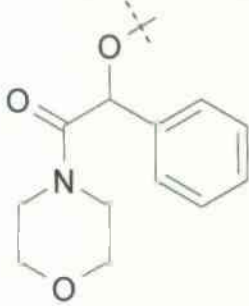
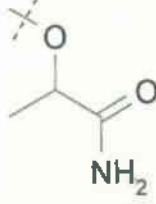
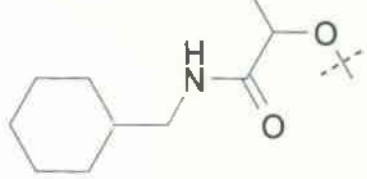
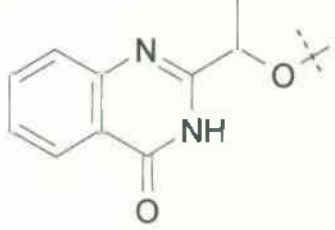
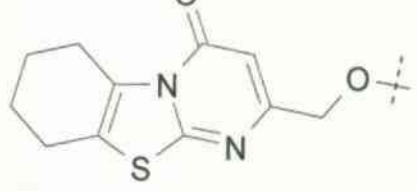
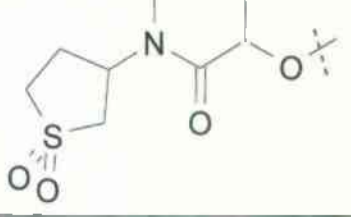
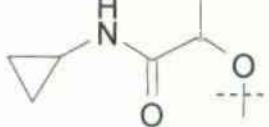
- 5 Tabla 7: Los compuestos caracterizados con "(-)" no forman parte de la presente invención

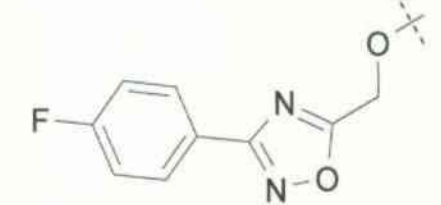
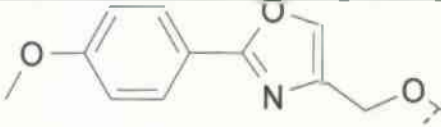
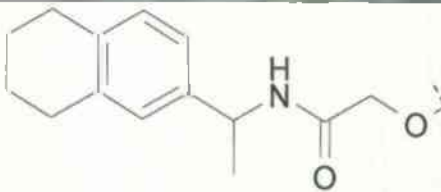
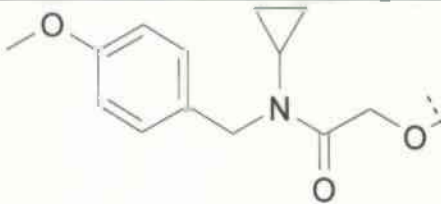
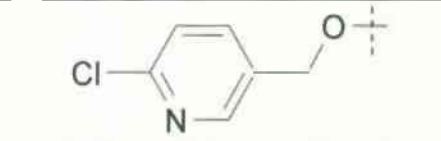
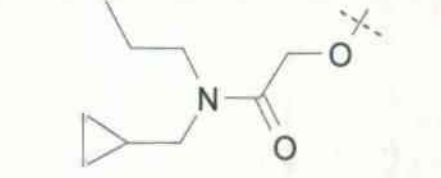
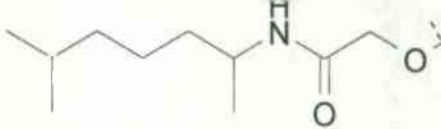
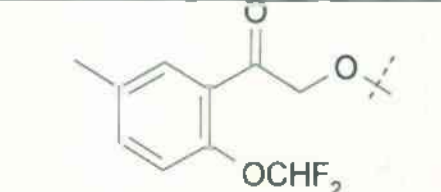
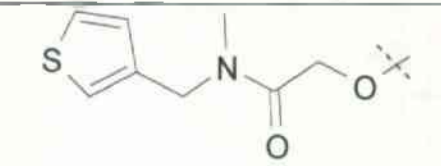


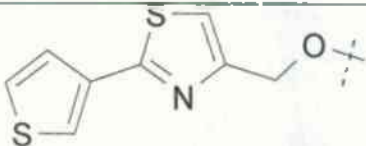
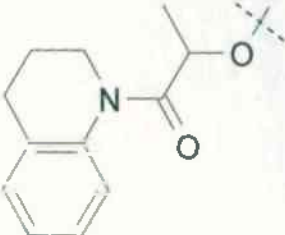
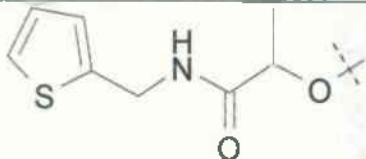
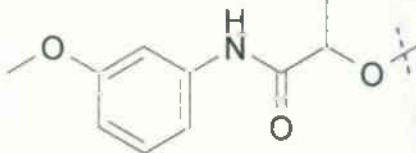
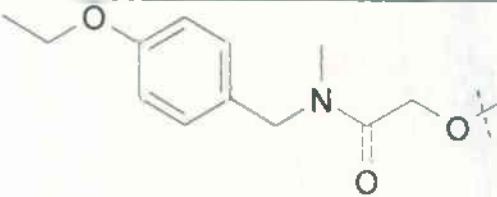
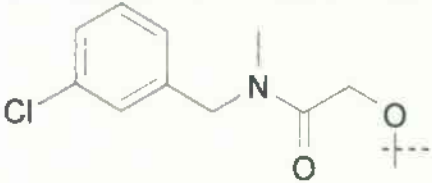
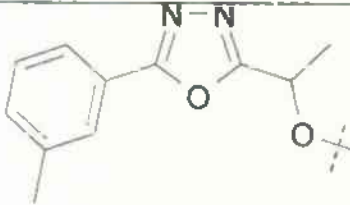
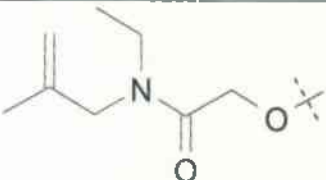
Comp. No.	X	T. R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.1 (-)		3.241	370.1
I.1.2 (-)		3.082	401.1
I.1.3		2.781	345.1
I.1.4 (-)		3.527	385.1
I.1.5		3.541	477.1

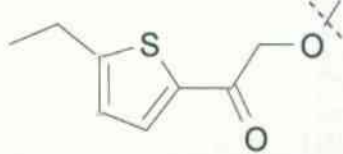
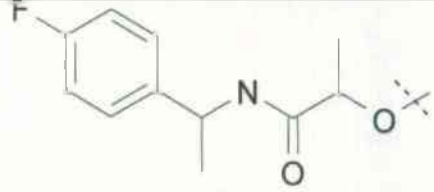
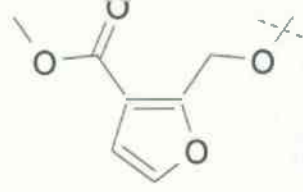
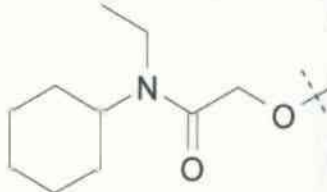
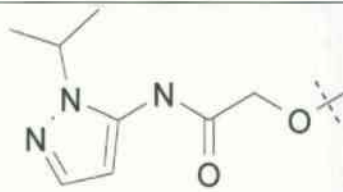
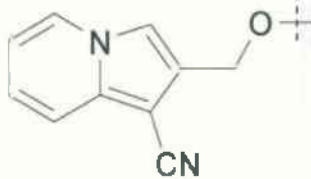
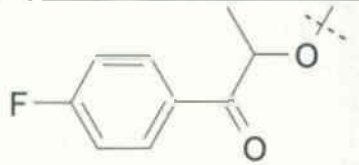
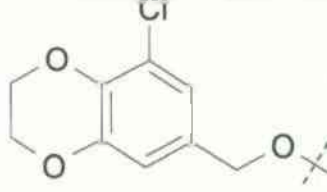
I.1.6	OCH ₂ CN	3.147	258.1
I.1.7		3.734	426.2
I.1.8 (-)		2.892	409.1
I.1.9 (-)		3.943	383.1
I.1.10		3.943	383.1
I.1.11		4.283	361.1
I.1.12 (-)		3.741	406.2
I.1.13 (-)		3.646	384.1
I.1.14		4.106	353.1
I.1.15		3.899	366.1

I.1.16 (-)		3.473	410.1
I.1.17		3.941	381.1
I.1.18 (-)		3.490	324.1
I.1.19 (-)		3.604	366.1
I.1.20		3.477	483.1
I.1.21 (-)		3.794	350.1
I.1.22 (-)		3.530	380.1

I.1.23 (-)	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N2CCOCC2</chem>	3.491	422.2
I.1.24	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N</chem>	2.600	290.1
I.1.25 (-)	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N2CCCCC2</chem>	3.847	386.2
I.1.26 (-)	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N2C(=N1)C(=N2)C3=CC=CC=C3</chem>	3.346	391.1
I.1.27 (-)	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N2C(=N1)C(=N2)C3=CC=CC=C3</chem>	3.927	437.1
I.1.28 (-)	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N2C(=N1)C(=N2)C3=CC=CC=C3</chem>	2.883	422.1
I.1.29 (-)	 <chem>COc1ccccc1C(=O)N2CCCCC2</chem>	2.978	330.1

I.1.30 (-)		4.140	395.1
I.1.31 (-)		4.043	406.1
I.1.32 (-)		4.057	434.2
I.1.33 (-)		3.875	436.2
I.1.34		3.686	344.1
I.1.35		3.804	372.2
I.1.36		4.082	388.2
I.1.37		4.156	417.1
I.1.38 (-)		3.503	386.1
I.1.39	OCH ₃	3.254	233.1

I.1.40		4.099	398.0
I.1.41 (-)		3.984	406.2
I.1.42 (-)		3.437	386.1
I.1.43	$(\text{CH}_3)_3\text{COCOCH}_2\text{O}$	3.989	333.1
I.1.44 (-)		3.624	396.1
I.1.45 (-)		3.778	424.2
I.1.46 (-)		3.813	414.1
I.1.47 (-)		4.073	405.1
I.1.48 (-)		3.636	358.2

I.1.49		4.063	371.1
I.1.50 (-)		3.653	412.2
I.1.51		3.767	357.1
I.1.52 (-)		3.990	386.2
I.1.53	$\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$	3.275	291.1
I.1.54 (-)		3.048	384.2
I.1.55 (-)		3.740	373.1
I.1.56		4.007	369.1
I.1.57 (-)		4.196	401.0

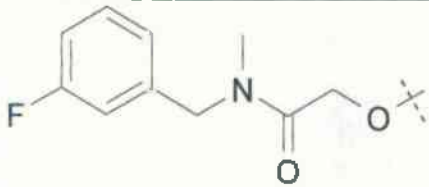
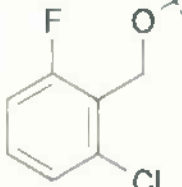
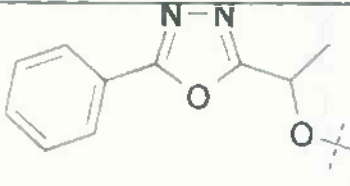
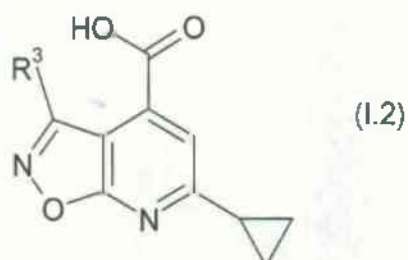
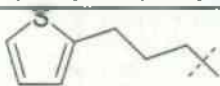
I.1.58 (-)		3.641	398.1
I.1.59		4.288	361.1
I.1.60		3.909	391.1
I.1.61	OCH_2OCH_3	2.592	219.1
I.1.62	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3.750	259.1
I.1.63	OCH_2CH_3	3.609	247.1
I.1.64	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CClCH}_3$ (isómero Z)	4.170	219.1
I.1.65	OCH_2CHF_2	3.539	283.1
I.1.66	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	4.234	219.1
I.1.67	OCH_2CF_3	3.824	301.1
I.1.68	$\text{OCH}_2\text{CCCH}_3$	3.761	271.1
I.1.69	$\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	3.579	291.1
I.1.70	$\text{O}[(\text{CH}_2)_2\text{O}]_2\text{C}_4\text{H}_9$	4.082	363.2
I.1.71	$\text{OC}(\text{CH}_3)_2$	4.148	219.1
I.1.72	OC_3H_7	3.936	261.1
I.1.73	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2$	4.431	289.1
I.1.74	$\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OH}$	2.641	263.1
I.1.75	$\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}=\text{CH}_2$	3.705	289.1
I.1.76	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHC}\equiv\text{CH}$	3.799	283.1
I.1.77	NHSO_2CH_3	0.909	296
I.1.78	$\text{NHSO}_2\text{C}_6\text{H}_5$	1.102	358
I.1.79	$\text{SCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	1.441	325
I.1.80	$\text{SCH}_2\text{CHCH}_2$	1.351	275
I.1.81	$\text{S}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	1.480	291
I.1.82	SCH_3	1.236	249
I.1.83	$\text{N}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$	0.985	262

Tabla 8:



Comp. No.	R ³	T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.2.1	CH ₃	2.574	219.1
I.2.2	CH ₂ C(CH ₃) ₂	3.429	275.1
I.2.3	(CH ₂) ₂ CH ₃	3.078	247.1
I.2.4		2.885	271.0
I.2.5	C ₆ H ₅	3.108	281.1
I.2.6	CH(CH ₃) ₂	3.048	247.1
I.2.7		2.920	245.1
I.2.8	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	3.176	311.1
I.2.9		2.651	313.1
I.2.10	CF ₃	3.176	273.0
I.2.11	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	3.543	309.1
I.2.12		3.180	259.1
I.2.13		3.156	259.1
I.2.14		3.370	273.1
I.2.15		2.078	282.1
I.2.16		0.763	282
I.2.17	4-Cl-C ₆ H ₄	1.175	315
I.2.18	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	1.234	349

I.2.19	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	1.287	357
I.2.20	4-Br-C ₆ H ₄	1.194	360
I.2.21	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	1.228	349
I.2.22	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	1.110	311
I.2.23	3-OCH ₃ ,4-OCH ₃ -C ₆ H ₃	1.066	341
I.2.24	3-Cl-C ₆ H ₄	1.183	315
I.2.25	CH ₂ CH ₃	1.012	233
I.2.26		1.218	287
I.2.27		1.232	287
I.2.28	(CH ₂) ₄ CH ₃	1.225	275
I.2.29		1.280	301
I.2.30		1.363	315
I.2.31	3-F-C ₆ H ₄	1.131	299
I.2.32	3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃	1.281	349 [M] ⁺
I.2.33	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	1.090	311
I.2.34	2-OCH ₃ ,3-OCH ₃ ,4-OCH ₃ -C ₆ H ₂	1.107	371
I.2.35	2-Cl-C ₆ H ₄	1.144	315
I.2.36	3-OCH ₃ ,5-OCH ₃ -C ₆ H ₃	1.133	341
I.2.37	(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄	1.256	323
I.2.38	CH ₂ OCH ₃	0.938	249
I.2.39	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	1.218	275
I.2.40		1.238	329
I.2.41		1.304	313
I.2.42	(CH ₂) ₂ -4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	1.209	339
I.2.43	4-I-C ₆ H ₄	1.230	406 [M] ⁺
I.2.44	3-F,5-F-C ₆ H ₃	1.178	317
I.2.45	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	1.170	347
I.2.46		1.058	263

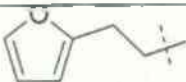
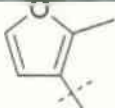
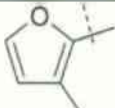
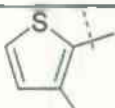
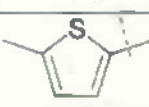
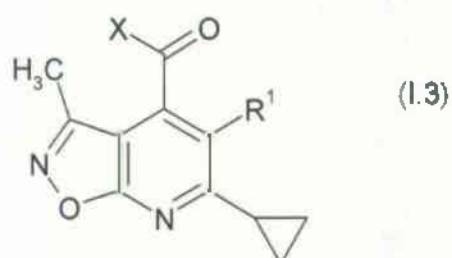
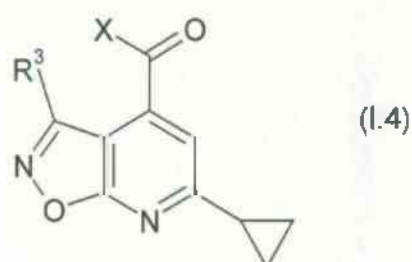
I.2.47		1.146	299
I.2.48	H	0.558	205
I.2.49	CH ₂ OH	0.825	235
I.2.50	2-F-C ₆ H ₄	1.126	299
I.2.51	4-F-C ₆ H ₄	1.123	299
I.2.52	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	1.145	295
I.2.53	OCH ₃	0.933	235
I.2.54	OCH ₂ CH ₃	1.004	249
I.2.55	O(CH ₂) ₂ CH ₃	1.084	263
I.2.56	O(CH ₂) ₃ CH ₃	1.157	277
I.2.57	OCH(CH ₃) ₂	1.075	263
I.2.58	OC(CH ₃) ₃	1.142	277
I.2.59	2-Br-C ₆ H ₄	1.173	360
I.2.60	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	1.245	349
I.2.61	4-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	1.232	309
I.2.62	4-OCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	1.187	325
I.2.63	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃ -C ₆ H ₄	1.313	353
I.2.64	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	1.152	347
I.2.65	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	1.164	326
I.2.66	4-CH(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄	1.279	323
I.2.67		1.107	285
I.2.68		1.125	285
I.2.69		1.148	301
I.2.70		1.168	301
I.2.71	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄	1.333	337
I.2.72	OH	0.884	221
I.2.73		1.103	366
I.2.74	OCH(CH ₂ CH ₃) ₂	1.237	291

Tabla 9:

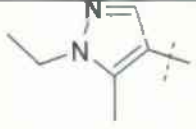
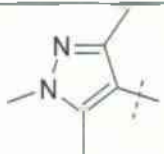
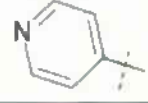
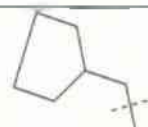


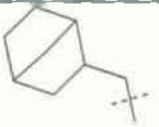
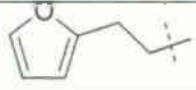
Comp. No.	R ¹	X	T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.3.1	CH ₂ C ₆ H ₅	OH	3.353	309.1
I.3.2	CH ₃	OH	2.539	233.1
I.3.3	Br	OH	2.606	297.0
I.3.4	Cl	OH	2.568	253.0
I.3.5	CH ₂ C ₆ H ₅	OC(CH ₃) ₃	4.538	365.2
I.3.6	CH ₃	OCH ₃	3.380	247.1
I.3.7	Br	OCH ₃	3.770	311.0
I.3.8	Cl	OCH ₃	3.732	267.0

5 Tabla 10:



Comp. No.	R ³	X	T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.4.1		OCH ₃	4.134	287.1
I.4.2		OCH ₃	2.393	296.1
I.4.3		OCH ₃	3.897	273.1
I.4.4		OCH ₃	3.942	273.1
I.4.5	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	OCH ₃	4.164	323.1

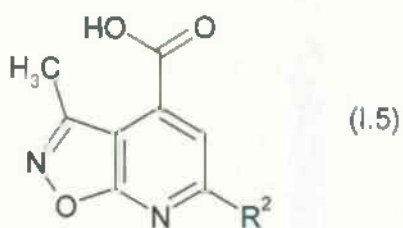
I.4.6	CF ₃	OCH ₃	3.821	287.0
I.4.7	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OCH ₃	3.820	325.1
I.4.8	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	4.055	309.1
I.4.9	4-F-C ₆ H ₄	OCH ₃	3.882	313.1
I.4.10		OCH ₃	3.287	327.1
I.4.11	2-F-C ₆ H ₄	OCH ₃	3.880	313.1
I.4.12		OCH ₃	3.085	327.1
I.4.13		OCH ₃	0.880	296
I.4.14	4-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.363	329
I.4.15	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.390	363
I.4.16	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.455	371
I.4.17	4-Br-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.377	374
I.4.18	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.390	363
I.4.19	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.288	325
I.4.20	3-OCH ₃ ,4-OCH ₃ - C ₆ H ₃	OCH ₃	1.221	355
I.4.21	3-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.371	329
I.4.22	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	1.214	247
I.4.23		OCH ₃	1.443	301
I.4.24		OCH ₃	1.442	301
I.4.25	(CH ₂) ₄ CH ₃	OCH ₃	1.441	289
I.4.26		OCH ₃	1.502	315
I.4.27		OCH ₃	1.567	329
I.4.28	3-F-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.306	313
I.4.29	3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃	OCH ₃	1.466	363
I.4.30	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.281	325
I.4.31	2-OCH ₃ ,3-	OCH ₃	1.276	385

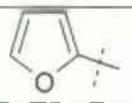
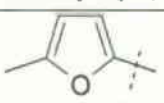
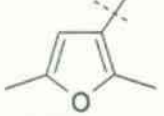
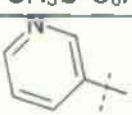
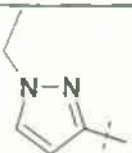
	$\text{OCH}_3, 4\text{-OCH}_3\text{-C}_6\text{H}_2$			
1.4.32	2-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.331	329
1.4.33	3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ -C ₆ H ₃	OCH ₃	1.305	355
1.4.34	(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄	OCH ₃	1.440	337
1.4.35	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	1.115	263
1.4.36	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	1.437	289
1.4.37		OCH ₃	1.416	343
1.4.38		OCH ₃	1.517	327
1.4.39	(CH ₂) ₂ -4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.380	353
1.4.40	4-I-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.412	421
1.4.41	3-F, 5-F-C ₆ H ₃	OCH ₃	1.178	317
1.4.42	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.327	361
1.4.43		OCH ₃	1.247	277
1.4.44		OCH ₃	1.319	313
1.4.45	CH ₂ C(CH ₃) ₃	SCH ₃	1.487	305
1.4.46	2-F-C ₆ H ₄	SCH ₃	1.369	329
1.4.47	4-F-C ₆ H ₄	SCH ₃	1.375	329
1.4.48	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.398	325
1.4.49	OC(CH ₃) ₃	NH ₂	1.175	276
1.4.50	OC(CH ₃) ₃	SCH ₃	1.320	307
1.4.51	OCH(CH ₃) ₂	NH ₂	1.065	262
1.4.52	OCH(CH ₃) ₂	SCH ₃	1.378	293
1.4.53	OCH(CH ₃) ₂	SCH ₂ C ₆ H ₅	1.533	369
1.4.54	4-OCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.421	355
1.4.55	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.538	383
1.4.56	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.362	377
1.4.57	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.365	356
1.4.58	NHCH(CH ₃) ₂	CONHCH(CH ₃) ₂	1.258	303
1.4.59	(CH ₂) ₂ CH ₃	SCH ₃	1.390	277
1.4.60		SCH ₃	1.338	275

I.4.61	2-Br-C ₆ H ₄	SCH ₃	1.416	390
I.4.62	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.463	379
I.4.63		NH ₂	0.918	244
I.4.64	OCOC(CH ₃) ₃	OCH ₃	1.402	319

Tabla 11: Los compuestos caracterizados con “(-)” no forman parte de la presente invención

5



Comp. No.	R ²	T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.5.1 (-)	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	3.539	323.0
I.5.2	CH ₃	1.941	193.0
I.5.3	CH(CH ₃) ₂	2.693	221.1
I.5.4	CH ₂ CH ₃	2.330	207.1
I.5.5 (-)	2-F-C ₆ H ₄	3.052	273.0
I.5.6 (-)	4-F-C ₆ H ₄	3.167	273.0
I.5.7		2.610	244.0
I.5.8 (-)	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	3.314	269.1
I.5.9		3.186	258.0
I.5.10		3.280	272.1
I.5.11 (-)	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	3.065	285.1
I.5.12		1.575	256.1
I.5.13 (-)	4-CHF ₂ O-C ₆ H ₄	3.306	321.0
I.5.14		2.545	273.1

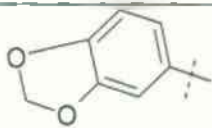
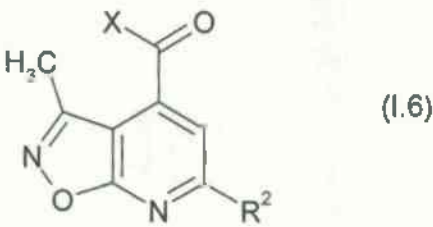
I.5.15		3.005	233.1
I.5.16 (-)	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	3.125	300.1
I.5.17 (-)		3.015	299.0
I.5.18	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	2.960	235.1
I.5.19	(CH ₂) ₄ CH ₃	3.347	249.1
I.5.20		2.867	233.0
I.5.21		3.387	261.1
I.5.22		3.142	247.1
I.5.23	CH ₂ C ₆ H ₅	3.009	269.1
I.5.24	CF ₂ CF ₃	3.195	297.0
I.5.25		2.919	233.1
I.5.26	CH ₂ C(CH ₃) ₂ O CH ₃	2.484	233.1
I.5.27	C(CH ₃) ₃	3.069	235.1
I.5.28 (-)	3-Cl-C ₆ H ₄	3.469	289.0
I.5.29 (-)	2-Cl-C ₆ H ₄	3.116	289.0
I.5.30 (-)	4-C ₂ H ₅ O-C ₆ H ₄	3.358	299.1
I.5.31 (-)	2-CH ₃ ,4-CH ₃ -C ₆ H ₃	3.409	283.1
I.5.32 (-)	2-F,5-F-C ₆ H ₃	3.223	291.0
I.5.33 (-)	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	2.990	285.1
I.5.34	CF ₃	0.938	247

Tabla 12:



5

Comp. No.	R ²	X	T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.6.1	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	OCH ₃	2.041	270.1
I.6.2	C ₆ H ₅	OCH ₃	3.140	247.1

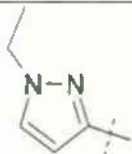
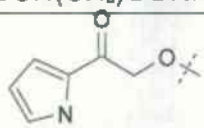
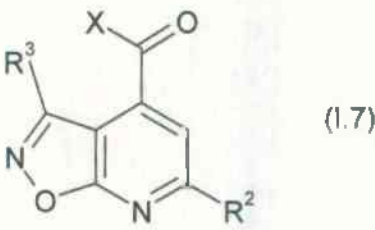
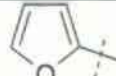
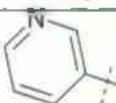
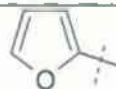
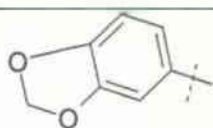
I.6.3		OCH ₃	3.624	247.1
I.6.4	CH ₂ C ₆ H ₅	OCH ₃	3.617	283.1
I.6.5		OCH ₃	3.860	261.1
I.6.6		OCH ₃	4.114	275.1
I.6.7		OCH ₃	3.585	247.1
I.6.8	(CH ₂) ₄ CH ₃	OCH ₃	4.044	263.1
I.6.9	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	3.664	249.1
I.6.10		OCH ₃	3.712	247.1
I.6.11	C(CH ₃) ₃	OCH ₃	3.770	249.1
I.6.12	CH ₃	OCH ₃	2.643	207.1
I.6.13		OCH ₃	3.216	287.1
I.6.14	CH ₃	OCH(CH ₃)CONH ₂	2.082	264.1
I.6.15	CH ₃		2.855	300.1
I.6.16	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	3.427	235.1

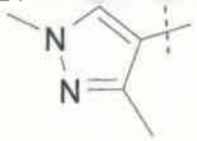
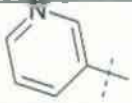
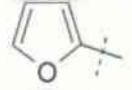
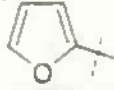
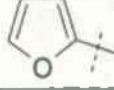
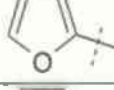
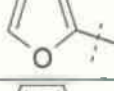
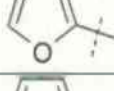
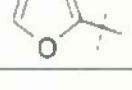
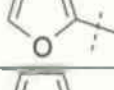
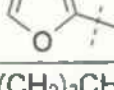
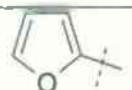
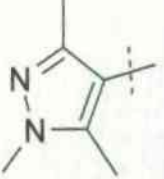
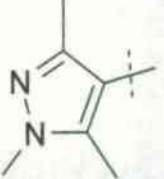
Tabla 13: Los compuestos caracterizados con “(-)” no forman parte de la presente invención

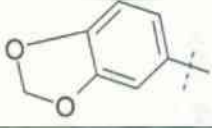
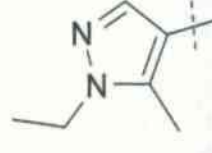


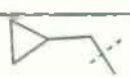
5

Comp. No.	R ²	R ³	X	T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.1 (-)	3,4-CH ₃ O-C ₆ H ₃	CH(CH ₃) ₂	OH	3.193	343.1

1.7.2		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OCH_3	4.481	337.0
1.7.3 (-)	4- $\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4$	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.450	313.1
1.7.4 (-)	4-F- C_6H_4	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.561	301.1
1.7.5 (-)	2- CH_3O ,5- $\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3$	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.379	343.1
1.7.6 (-)	2- CH_3O ,4- $\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3$	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.422	343.1
1.7.7 (-)	2- $\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4$	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.390	313.1
1.7.8		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.360	247.0
1.7.9 (-)	4-Cl- C_6H_4	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	3.886	275.0
1.7.10	CH_3	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	2.459	221.1
1.7.11		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	1.969	284.1
1.7.12			OH	2.936	271.1
1.7.13	CH_3		OH	2.323	219.1
1.7.14 (-)	C_6H_5		OH	3.371	281.1
1.7.15 (-)	2-F- C_6H_4		OH	3.374	299.1
1.7.16 (-)	4-F- C_6H_4		OH	3.480	299.1
1.7.17	CH_2CH_3		OH	2.710	233.1
1.7.18 (-)	3-Cl,4-Cl- C_6H_3	C_6H_5	OH	4.190	385.0
1.7.19 (-)	3- $\text{NO}_2-\text{C}_6\text{H}_4$	C_6H_5	OH	4.122	376.1
1.7.20 (-)	4- $\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_4$	C_6H_5	OH	3.750	331.1
1.7.21 (-)	3- $\text{CHF}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4$	C_6H_5	OH	3.679	383.1
1.7.22 (-)	2-F- C_6H_4	C_6H_5	OH	3.513	335.1
1.7.23 (-)	4- $\text{CHF}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4$	C_6H_5	OH	3.681	383.1
1.7.24 (-)	C_6H_5	C_6H_5	OH	3.520	317.0
1.7.25 (-)		C_6H_5	OH	3.455	361.1
1.7.26 (-)	2-Cl,4-Cl- C_6H_3	C_6H_5	OH	3.927	385.0
1.7.27	$\text{CH}(\text{CH}_3)_3$	C_6H_5	OH	3.240	283.1

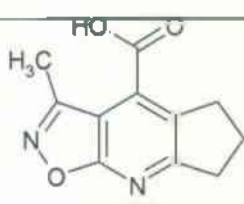
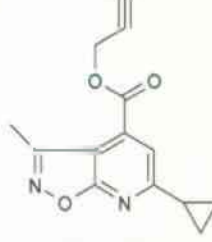
1.7.28		C_6H_5	OH	2.818	335.1
1.7.29		C_6H_5	OH	2.107	318.1
1.7.30		C_6H_5	OH	3.114	307.1
1.7.31	CH_3	C_6H_5	OH	2.585	255.1
1.7.32 (-)	C_6H_5		OH	3.295	307.0
1.7.33 (-)	$4\text{-CH}_3\text{O-C}_6\text{H}_4$		OCH_3	3.916	351.1
1.7.34 (-)	$4\text{-F-C}_6\text{H}_4$		OH	3.398	325.0
1.7.35 (-)	$2\text{-CH}_3\text{O-C}_6\text{H}_4$		OH	3.249	337.1
1.7.36 (-)	$2\text{-CH}_3\text{O}, 4\text{-CH}_3\text{O-C}_6\text{H}_3$		OH	3.312	367.1
1.7.37			OH	2.904	297.6
1.7.38	CH_3		OH	2.298	245.0
1.7.39	CH_3	$(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	OH	2.514	221.1
1.7.40		$(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	OH	3.119	231.0
1.7.41	CH_3	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	OH	2.933	249.1
1.7.42	C_6H_5	$2\text{-F-C}_6\text{H}_4$	OH	3.606	335.1
1.7.43	C_6H_5	$4\text{-F-C}_6\text{H}_4$	OH	3.605	335.1
1.7.44	C_2H_5		OH	2.465	301.1
1.7.45	CH_3		OH	2.147	287.1

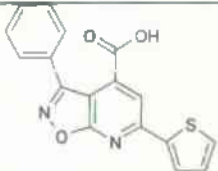
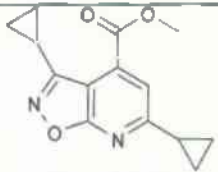
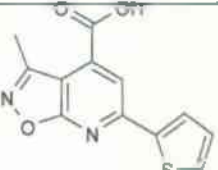
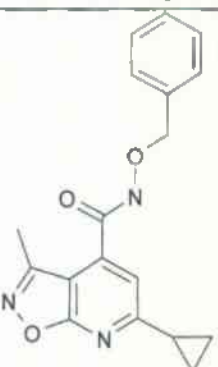
1.7.46 (-)	CH ₃		OCH ₃	3.270	313.1
1.7.47	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OH	3.312	313.1
1.7.48	CH ₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OH	2.699	285.1
1.7.49	CH ₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OH	2.700	285.1
1.7.50	CH ₃		OH	2.297	287.1
1.7.51		CH ₃	OH	0.998	237
1.7.52			OH	1.097	263
1.7.53			OCH ₃	1.290	277
1.7.54			OCH ₃	1.283	295
1.7.55			OH	1.069	281
1.7.56		C ₆ H ₅	OH	1.119	317
1.7.57		4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.128	347
1.7.58		CH ₃	OH	0.985	256
1.7.59		4-CF ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.281	367
1.7.60		4-Br-C ₆ H ₄	OH	1.251	378
1.7.61		4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.165	329
1.7.62		C ₆ H ₅	OH	1.155	299

1.7.63		$(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	OH	1.158	265
1.7.64		$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	OH	1.180	279
1.7.65		4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	OH	1.222	365
1.7.66		$(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	OH	1.228	279
1.7.67		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	1.155	265
1.7.68		$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	1.218	279
1.7.69		$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	OH	1.263	293
1.7.70		$(\text{CH}_2)_2\text{C}_6\text{H}_5$	OH	1.283	327
1.7.71			OH	1.300	305
1.7.72			OH	1.243	291
1.7.73		$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{C}$ H ₃	OH	1.284	293
1.7.74			SCH ₃	1.401	293
1.7.75			OH	1.198	277
1.7.76		$\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	OH	1.226	313
1.7.77		$(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	OH	1.295	293
1.7.78		4-OCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.234	343
1.7.79			OH	1.185	277
1.7.80		$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	OH	1.239	293

1.7.81		3-F,4-Br-C ₆ H ₃	OH	1.300	396
1.7.82			OH	1.198	277
1.7.83		3-F,4-F-C ₆ H ₃	OH	1.230	335
1.7.84		OCH(CH ₃) ₂	NH ₂	1.103	280
1.7.85		OCH(CH ₃) ₂	OH	1.152	281
1.7.86		OCH(CH ₃) ₂	SCH ₃	1.431	311
1.7.87		OCH(CH ₃) ₂	SCH ₂ C ₆ H ₅	1.573	387
1.7.88		OCH(CH ₃) ₂	SC(CH ₃) ₃	1.593	353
1.7.89		OCH(CH ₃) ₂	OCH ₂ OCH ₃	1.160	281 [M-CH ₂ OCH ₃ +H] ⁺
1.7.90		CH ₂ CH ₃	OH	3.002	251

Tabla 14:

Comp. No.		T.R. (min)	m/z=[M+H] ⁺
1.8.1		2.119	219.1
1.8.2		3.12	324.1

1.8.3		2.93	261.0
1.8.4		3.60	259.1
1.8.5		3.37	323.0
1.8.6		3.44	257.1

Ejemplos de uso

La actividad herbicida de las isoxazolo[5,4-b]piridinas de la fórmula I es demostrada en

5 los siguientes ensayos en el invernadero:

Los recipientes de cultivo usados eran macetas de plástico que contenían arena arcillosa con aproximadamente 3,0% de mantilla como sustrato. Las semillas de las plantas de ensayo se sembraron separadas según la especie.

10

Para el tratamiento de pre-emergencia se aplicaron los compuestos activos en forma suspendida o emulsionada en agua directamente después de la siembra, valiéndose

de boquillas de fina distribución. Las macetas se regaron suavemente para promover la germinación y el crecimiento y luego se cubrieron mediante bolsas de plástico hasta que las plantas habían echado raíces. Esta cubrición asegura una germinación uniforme de las plantas de ensayo, a no ser que esta fuere afectada por los

5 ingredientes activos.

Para los tratamientos de post-emergencia se dejaron crecer las plantas hasta alcanzar un altura de 1 a 15 cm, dependiendo del tipo de planta y solo entonces se trataron con los ingredientes activos, que se habían suspendido o emulsionado en agua. Para este

10 fin se sembraron las plantas de ensayo directamente y se dejaron crecer en el mismo recipiente o se dejaron crecer, primero, en una maceta separada como plántulas y entonces se trasplantaron en los recipientes de ensayo algunos días antes del tratamiento.

15 Dependiendo de la especie, se mantuvieron las plantas a 10 – 25°C o 20 – 35°C. El período de ensayo duró 2 a 4 semanas. Durante este tiempo se cuidaron las plantas y se evaluó su respuesta a los diferentes tratamientos.

La evaluación se efectuó usando una escala de 0 a 100. 100 significa ninguna

20 emergencia de las plantas o completa destrucción de por lo menos de las partes de planta emergidas al aire, y 0 significa ningún daño o curso normal del crecimiento. Una buena actividad herbicida se tiene con un valor de por lo menos 80 y una muy buena actividad herbicida se tiene con un valor de por lo menos 90.

25 Las plantas usadas en los ensayos en el invernadero pertenecieron a las siguientes

especies:

Código de Bayer	Nombre científico	Nombre común
ABUTH	Abutilon theophrasti	yute de China
AGSST	Agrostis stolonifera L.	agróstide
ALOMY	Alopecurus myosuroides	cola de zorra
AMARE	Amaranthus retroflexus L.	bledo
AVEFA	Avena fatua	avena loca
CHEAL	Chenopodium album	cenizo blanco
LOLMU	Lolium multiflorum	raigrás italiano
MATIN	Matricaria inodora	manzanilla inodora
SETFA	Setaria faberi	cola de zorro gigante
POLCO	Polygonum convolvulus	enredadera anual

Tabla 15: Tratamiento de post-emergencia de Abutilon theophrasti (yute de China)

5

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.5.4	3,0	85
I.2.1	2,0	95
I.1.6	3,0	100
I.1.35	3,0	90
I.2.2	2,0	100
I.2.3	3,0	100
I.2.5	3,0	100
I.2.6	3,0	100
I.7.31	3,0	98
I.2.7	3,0	100
I.2.8	3,0	100
I.7.17	3,0	100
I.1.61	3,0	100
I.1.62	2,0	100
I.8.2	3,0	100
I.1.66	3,0	100
I.1.67	3,0	100
I.1.68	3,0	100

I.1.69	3,0	100
I.1.70	3,0	100
I.1.75	3,0	100
I.8.1	3,0	100
I.7.41	3,0	100
I.7.38	3,0	100
I.7.13	3,0	100
I.7.10	3,0	100
I.7.39	3,0	100
I.2.10	3,0	90
I.4.5	3,0	85
I.2.11	3,0	100
I.4.4	3,0	100
I.2.12	3,0	100
I.2.13	2,0	100
I.2.14	3,0	100
I.2.15	3,0	85
I.2.19	3,0	100
I.2.16	3,0	85
I.2.17	3,0	100
I.2.18	3,0	100
I.2.20	3,0	100
I.2.21	3,0	100
I.2.22	3,0	100
I.2.24	3,0	100
I.2.26	3,0	100
I.2.27	3,0	100
I.4.25	3,0	100
I.4.27	3,0	100
I.2.30	3,0	100
I.2.31	3,0	100
I.2.37	3,0	90
I.2.38	3,0	100
I.2.39	3,0	100
I.2.40	3,0	100
I.2.41	3,0	100
I.2.42	3,0	100
I.2.43	3,0	100
I.2.44	3,0	100

Tabla 16: Tratamiento de post-emergencia de *Agrostis stolonifera* L. (agróside)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.8.6	2,0	80
I.1.10	2,0	90
I.1.31	2,0	85
I.1.39	2,0	90
I.1.49	2,0	85

Tabla 17: Tratamiento de post-emergencia de *Alopecurus myosuroides* (cola de zorra)

5

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.1.43	1,0	80

Tabla 18: Tratamiento de post-emergencia de *Amaranthus retroflexus* L. (bledo)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.8.4	1,0	100
I.1.64	0,5	100
I.1.65	1,0	100
I.7.53	1,0	100
I.2.45	1,0	98
I.1.79	1,0	98
I.1.80	1,0	98
I.1.81	1,0	98
I.1.82	1,0	98
I.2.46	1,0	98
I.1.83	1,0	100
I.2.50	1,0	100
I.2.51	1,0	100
I.2.52	1,0	100
I.2.53	1,0	100
I.2.54	1,0	100
I.2.55	1,0	100

131

I.2.56	1,0	100
I.2.57	1,0	100
I.2.58	1,0	100
I.4.45	1,0	100
I.4.47	1,0	95
I.7.55	1,0	100
I.7.56	1,0	80
I.7.57	1,0	80
I.2.61	1,0	100
I.2.62	1,0	100
I.2.63	1,0	100
I.4.59	1,0	95
I.4.60	0,927	100
I.2.64	1,0	100
I.2.65	1,0	100
I.7.59	1,0	100
I.7.60	1,0	100
I.7.61	1,0	100
I.7.62	1,0	100
I.2.66	1,0	100
I.7.63	1,0	100
I.7.64	1,0	100
I.7.65	1,0	100
I.7.90	1,0	100
I.2.71	1,0	100
I.4.63	1,0	100
I.7.68	1,0	100
I.7.69	1,0	100

Tabla 19: Tratamiento de post-emergencia de Avena fatua (avena loca)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.1.35	3,0	85
I.1.39	2,0	85
I.1.43	1,0	90
I.1.61	3,0	100
I.1.63	3,0	80

I.8.2	3,0	90
I.1.66	3,0	80
I.1.67	3,0	95

Tabla 20: Tratamiento de post-emergencia de *Chenopodium album* (cenizo blanco)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.1.21	1,0	100
I.8.4	1,0	100
I.1.65	1,0	100
I.7.53	1,0	90
I.2.45	1,0	98
I.1.79	1,0	85
I.1.80	1,0	98
I.1.81	1,0	98
I.1.82	1,0	98
I.2.46	1,0	98
I.1.83	1,0	100
I.2.50	1,0	100
I.2.51	1,0	100
I.2.52	1,0	98
I.2.53	1,0	100
I.2.54	1,0	100
I.2.55	1,0	100
I.2.56	1,0	100
I.2.57	1,0	100
I.2.58	1,0	100
I.7.55	1,0	100
I.7.56	1,0	90
I.7.57	1,0	98
I.7.58	1,0	95
I.2.59	1,0	95
I.2.61	1,0	100
I.2.62	1,0	100
I.2.63	1,0	100
I.4.59	1,0	100
I.4.60	0,927	100

I.7.61	1,0	100
I.7.62	1,0	100
I.2.66	1,0	100
I.7.63	1,0	100
I.7.64	1,0	100
I.7.65	1,0	100
I.7.90	1,0	100
I.7.66	1,0	100
I.7.67	1,0	100
I.2.69	1,0	95
I.2.71	1,0	100
I.4.63	1,0	100
I.7.68	1,0	100

Tabla 21: Tratamiento de post-emergencia de *Lolium multiflorum* (raigrás italiano)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.1.21	1,0	100

5 Tabla 22: Tratamiento de post-emergencia de *Matricaria inodora* (manzanilla inodora)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.7.34	2,0	85
I.1.2	2,0	90
I.1.10	2,0	85
I.1.24	2,0	100
I.1.31	2,0	95
I.1.49	2,0	98
I.2.4	2,0	98

Tabla 23: Tratamiento de post-emergencia de *Setaria faberi* (cola de zorro gigante)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
1.7.32	3,0	80
1.8.6	2,0	80
1.2.1	2,0	100
1.7.4	3,0	80
1.7.7	3,0	85
1.8.5	3,0	80
1.5.8	3,0	85
1.1.6	3,0	95
1.2.2	2,0	90
1.2.3	3,0	85
1.2.5	3,0	80
1.2.6	3,0	95
1.8.3	3,0	85
1.2.7	3,0	100
1.5.13	3,0	95
1.2.8	3,0	80
1.7.17	3,0	90
1.7.9	3,0	85
1.4.2	3,0	85
1.4.6	3,0	80
1.2.10	3,0	85
1.2.11	3,0	100
1.2.12	3,0	90
1.4.3	3,0	90
1.2.13	2,0	95
1.2.14	3,0	90
1.2.15	3,0	100
1.2.19	3,0	85
1.2.16	3,0	100
1.2.20	3,0	95
1.4.19	3,0	100
1.2.25	3,0	95
1.7.51	3,0	90

135

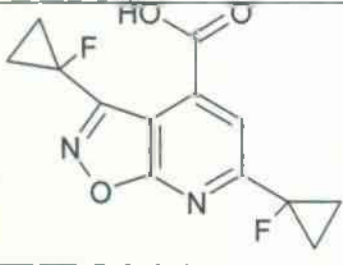
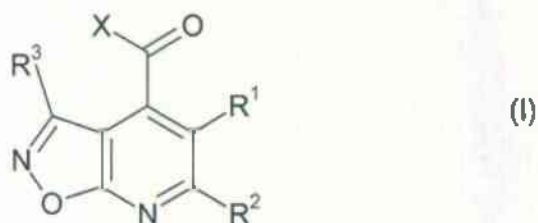
	3,0	98
---	-----	----

Tabla 24: Tratamiento de post-emergencia de Polygonum convolvulus (enredadera anual)

Comp. No.	Cantidad de aplicación [kg/ha]	Daño [%]
I.7.58	1,0	90
I.2.59	1,0	90
I.2.64	1,0	80
I.2.65	1,0	100
I.7.59	1,0	100
I.7.60	1,0	100
I.7.66	1,0	100
I.7.67	1,0	100
I.2.69	1,0	85
I.7.69	1,0	100

REIVINDICACIONES SOLICITUD DIVISIONAL

1. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I



o de las sales agrónomicamente útiles, caracterizado porque las variables en la fórmula I tienen los significados abajo definidos:

R¹ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo, fenil-C₁-C₄-alquilo;

R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, fenil-C₁-C₄-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquilamino, heterociclilo; pudiendo las partes de heterociclilo de R² estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo;

en donde el heterociclilo es un anillo monocíclico de 5 o 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene 1, 2, 3 o

4 heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros del anillo;

o R¹ y R² forman juntos un C₃-C₆-alcanodiilo;

- 5 R³ es hidrógeno, halógeno, hidroxí, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₃-C₆-halocicloalquenilo, fenil-C₁-C₆-alquilo, heterociclilo-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, amino, C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₆)-alquillamino, heterociclilo, fenilo; pudiendo las partes de heterociclilo y las partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados
- 10 de halógeno, hidroxí, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquillamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquillamino, heterociclilo, fenilo;
- 15

- 20 en donde el heterociclilo es un anillo monocíclico de 5 o 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros del anillo;

- 25 X es SR⁶;

R^4, R^5 significan hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -hidroxialquilo, C_1 - C_6 -cianoalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalcoxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alqueniloxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -haloalqueniloxi- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxycarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, aminocarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alquil-aminocarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, N,N-di-
 5 (C₁-C₆-alquil)-aminocarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, [N-(C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquil), N-(C₁-C₆-alquil)]-aminocarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi-aminocarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -alquinil- C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, heterociclilo, fenilo,
 10 heterocicillocarbonilo, fenilcarbonilo, heterocicillocarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, fenilcarbonil- C_1 - C_6 -alquilo, heterociclilo- C_1 - C_6 -alquilo, fenil- C_1 - C_6 -alquilo; en donde las partes de fenilo y heterociclilo de R^4 y R^5 están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alcoxycarbonilo,
 15 heterociclilo, fenilo;

R^6, R^7 significan hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_1 - C_6 -alcoxi, fenil- C_1 - C_6 -alcoxi, fenilo, fenilo sustituido con halógeno, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, SO_2R^8 ;

R^8 es C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, fenilo; pudiendo las partes de fenilo de R^8 estar sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alcoxycarbonilo, heterociclilo, fenilo; en donde el heterociclilo es un anillo monocíclico de 5 o 6 miembros saturado,
 20 parcialmente insaturado o aromático, que contiene 1, 2, 3 o 4
 25

heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros del anillo;

- 5 2. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1,
caracterizado porque en la fórmula I
R¹ es hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo.
- 10 3. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1,
caracterizado porque en la fórmula I R¹ es hidrógeno.
- 15 4. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1,
caracterizado porque en la fórmula I R² es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-
haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-
alquenilo, C₂-C₆-alquinilo.
- 20 5. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1,
caracterizado porque en la fórmula I
R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-
halocicloalquil-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-
alquil-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo; pudiendo las
partes de fenilo de R³ estar sin sustituir o sustituidos con uno o más
radicales seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-
C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo,
25 C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-

alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquilamino, heterociclilo, fenilo;

en donde el heterociclilo es un anillo monocíclico de 5 o 6 miembros

saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros del anillo.

6. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque en la formula I

R⁵ significan hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-cianoalquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinil.

7. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque en la formula I

R¹ es hidrogeno;
 R² es hidrogeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-hidroxialquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo;
 R³ es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo-C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquilo-C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenil; en donde los grupos fenil de R³ puede ser sustituidos o no sustituidos con uno o más radicales seleccionados de halogeno, hidroxil, nitro, ciano, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alcoxycarbonil, C₁-C₄-alquilotio, C₁-C₄-alquilsulfinil, C₁-C₄-alquilsulfonil, amino, C₁-C₄-alquiloamino, N,N-di-(C₁-C₄)-alquiloamino, heterociclilo, fenil; en donde el heterociclilo es un anillo monocíclico de 5 o 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos del grupo que consiste de O, N y S como miembros del anillo.
 X es SR⁵;

- R^5 es hidrogeno, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, fenil- C_1-C_6 -alquilo;
preferentemente C_1-C_6 -alquilo, fenil- C_1-C_6 -alquilo.
8. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 7,
caracterizado porque en la fórmula I
- 5 R^2 es C_3-C_6 -cicloalquilo, C_3-C_6 -halocicloalquilo.
9. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 7,
caracterizado porque en la fórmula I
- 10 R^2 es ciclopropil, 1-fluorociclopropil.
10. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 7,
caracterizado porque en la fórmula I
- 15 R^3 es C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo- C_1-C_6 -alquilo, C_3-C_6 -
halocicloalquilo- C_1-C_6 -alquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_3-C_6 -halocicloalquilo, C_1-C_4 -
alquilo- C_3-C_6 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -haloalcoxi.
11. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 7,
caracterizado porque en la fórmula I
- 20 R^5 es hidrogeno, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, fenil- C_1-C_6 -alquilo.
12. Isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 7,
caracterizado porque en la fórmula I
- 25 R^5 es C_1-C_6 -alquilo, fenil- C_1-C_6 -alquilo.
13. Una composición, caracterizada porque comprende una cantidad activa como
herbicida de por lo menos un compuesto de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I
o una sal útil en la agricultura de I de acuerdo con cualquiera de las
reivindicaciones 1 a 12, y los auxiliares acostumbrados para la formulación de
agentes fitosanitarios.
- 30 14. Un método para preparar una composición de acuerdo con la reivindicación 13,
caracterizado porque comprende mezclar una cantidad activa como herbicida de
por lo menos un compuesto de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I o una sal útil

en la agricultura de l de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, y los auxiliares acostumbrados para la formulación de agentes fitosanitarios.

5

10

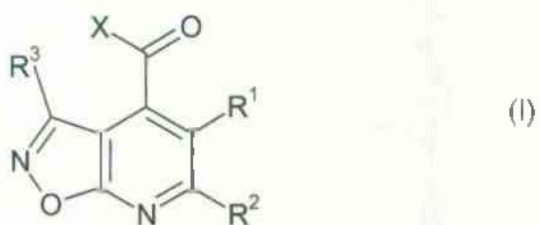
15

20

25

Resumen:

La invención se refiere compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I,



a las sales agronómicamente útiles de compuestos de isoxazolo[5,4-b]piridina de la fórmula I, y su uso como herbicidas.

Notaría
Sexta

6

DEL CIRCULO DE BOGOTÁ, D.C.

COPIA NUMERO 5

DE LA ESCRITURA NUMERO:
FECHA: 25/Enero/2010

0267

ACTO O CONTRATO:
Aclaración
OTORGANTES:
CAVELIER-ABOGADOS



CERTIFICADO ISO 9001-1
PRESTACIÓN DE
SERVICIO PÚBLICO
NOTARIAL
ISO 9001:2000
NTC-ISO 9001:2000



AMPARO QUINTERO ARTURO

NOTARIA SEXTA

CARRERA 9 No. 69-31 - PBX: 317 01 00 - FAX: 314 56 41

Correo Electrónico: notaria6debgta@etb.net.co



ESCRITURA PÚBLICA No. 267

DOSCIENTOS SESENTA Y SIETE

FECHA: VEINTICINCO (25) DE ENERO DEL AÑO

DOS MIL DIEZ (2010)

0901

ACLARACION

En la ciudad de Bogotá, Distrito Capital, República de Colombia, ante mí **AMPARO QUINTERO ARTURO** Notaria Sexta (6a.) — de este Círculo Notarial, se otorgo la escritura pública, que se consigna en los siguientes términos:

COMPARECIO: El señor **CARLOS ALBERTO GALLÓN GIRALDO**, mayor de edad, vecino de esta ciudad, casado, identificado con la cédula de ciudadanía No. 19.066.425 de Bogotá, y dijo:

PRIMERO.- Que obra en su calidad de Representante Legal de la sociedad denominada **CAVELIER ABOGADOS** domiciliada en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia.

SEGUNDO.- Que **BASF SE**, sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania domiciliada en Ludwigshafen am Rhein, Alemania, designó a **CAVELIER ABOGADOS**, como su Representante para la Propiedad Industrial en Colombia con facultades de nombrar apoderados, tal como consta en la copia auténtica del documento de representación que se protocoliza.

TERCERO.- Que en su carácter de Representante Legal de **CAVELIER ABOGADOS**, y en desarrollo de la facultad otorgada por **BASF SE**, mediante la escritura número 5883 de fecha 9 de noviembre de 2009 otorgada en esta misma notaría, confirió poder a los abogados 1.- **ROSA MARGARITA SANTACRUZ**, T.P.A. No. 49.434, identificada con cédula de ciudadanía número 35.501.911 de Suba (Bogotá, D.E.) 2.- **OSCAR FERNANDO CORREA BARBOSA**, T.P.A. No. 71.027, identificado con cédula de ciudadanía número 79.524.634 de Bogotá. 3.- **LUZ CLEMENCIA DE PAEZ**, T.P.A. No. 23.555, identificada con cédula de ciudadanía número 35.456.344 de Usaquén y 4.- **GERMAN HUMBERTO MARIN RUALES**, T.P.A. No. 64.239, identificado con



cédula de ciudadanía número 79.155.665 de Bogotá, mayores de edad, vecinos de Bogotá _____

CUARTO: Que mediante este instrumento aclara la mencionada escritura 5883 del 9 de noviembre de 2009 de esta notaría, manifestando que el orden de los apoderados para ejecutar los actos allí estipulados es el siguiente: 1.- **OSCAR FERNANDO CORREA BARBOSA**, T.P.A. No. 71.027, identificado con cédula de ciudadanía número 79.524.634 de Bogotá, **ROSA MARGARITA SANTACRUZ**, T.P.A. No. 49.434, identificada con cédula de ciudadanía número 35.501.911 de Suba (Bogotá, D.E.), **LUZ CLEMENCIA DE PAEZ**, T.P.A. No. 23.555, identificada con cédula de ciudadanía número 35.456.344 de Usaquén y **GERMAN HUMBERTO MARIN RUALES**, T.P.A. No. 64.239, identificado con cédula de ciudadanía número 79.155.665 de Bogotá, mayores de edad, vecinos de Bogotá. _____

QUINTO: En todo lo demás la referida escritura número 5883 de fecha 09 de Noviembre de dos mil nueve (2009) otorgada en esta misma notaría quedan sin ninguna modificación. _____

OTORGAMIENTO Y AUTORIZACION: LEIDA la presente escritura por los comparecientes y habiéndoseles hecho las advertencias sobre los trámites y formalidades de rigor le impartieron su aprobación y para constancia la firma ante mí la NOTARIA QUE AUTORIZA. _____

DERECHOS NOTARIALES: \$ 42,860 _____

IVA \$ 9.930 _____

PAPEL NOTARIAL: esta escritura ha quedado extendida en las hojas de papel sellado notarial números: AA- 42875492 / 42874781 / _____

EN BLANCO... EN BLANCO



CAMARA DE COMERCIO DE BOGOTA

SEDE CHAPINERO

17 DE DICIEMBRE DE 2009 HORA 11:11:00

R027136832

PAGINA: 1 de 3

CERTIFICADO DE EXISTENCIA Y REPRESENTACION LEGAL O INSCRIPCION DE DOCUMENTOS

CERTIFICA:

NOMBRE : CAVELIER ABOGADOS
N.I.T. : 860041367-3
DOMICILIO : BOGOTA D.C.

CERTIFICA:

NO: C0820237

CERTIFICA:

CONSTITUCION : QUE POR ESCRITURA PUBLICA NO. 0006233 DE NOTARIA SEXTA DE BOGOTA D.C. DEL 10 DE SEPTIEMBRE DE 1974 , INSCRITA EL 26 DE SEPTIEMBRE DE 1974 BAJO EL NUMERO 00021234 DEL LIBRO IX, SE CONSTITUYO LA SOCIEDAD CIVIL DENOMINADA: CAVELIER PERDOMO Y CAVELIER.

CERTIFICA :

QUE POR ESCRITURA PUBLICA NO. 0001000 DE NOTARIA SEXTA DE BOGOTA D.C. DEL 10 DE MARZO DE 1983 , INSCRITA EL 5 DE ABRIL DE 1983 BAJO EL NUMERO 00130769 DEL LIBRO IX, LA SOCIEDAD CAMBIO SU NOMBRE DE : CAVELIER PERDOMO Y CAVELIER. POR EL DE : CAVELIER ABOGADOS

CERTIFICA:

QUE POR ESCRITURA PUBLICA NUMERO 1.000 OTORGADA EN LA NOTARIA 6A. DE BOGOTA EL 10 DE MARZO DE 1.983, INSCRITA EN ESTA CAMARA DE COMERCIO EL 5 DE ABRIL DE 1.983 BAJO EL NUMERO 130769 DEL LIBRO IX, LA SOCIEDAD CAMBIO SU NOMBRE DE: CAVELIER PERDOMO Y CAVELIER, POR EL DE: CAVELIER ABOGADOS, E INTRODUJO OTRAS REFORMAS.

CERTIFICA:

CERTIFICA

QUE POR E.P.NO. 2.034 DE LA NOTARIA 6 DE SANTAFE DE BOGOTA DEL 18 DE ABRIL DE 1.995, INSCRITA EL 27 DE ABRIL DE 1.995 BAJO EL NO. 5.937 DEL LIBRO XIII, LA SOCIEDAD TRASLADO SU DOMICILIO DE LA CIUDAD DE SANTAFE DE BOGOTA D.C. AL MUNICIPIO DE TABIO (CUNDINAMARCA).

CERTIFICA:

QUE POR ESCRITURA PUBLICA NO. 7710 DE LA NOTARIA SEXTA DE BOGOTA DEL 10 DE OCTUBRE DE 1984, INSCRITA EL 15 DE NOVIEMBRE DE 1984 BAJO EL NO. 1559 DEL LIBRO XIII, LA SOCIEDAD CAMBIO SU NATURALEZA JURIDICA DE SOCIEDAD COMERCIAL A SOCIEDAD CIVIL.

CERTIFICA:

REFORMAS:

ESCRITURAS NO.	FECHA	NOTARIA
842	10-V-1.977	18. BTA.
3.430	1-VII-1.980	6A. BTA.
4.844	10-IX-1.980	6A. BTA.
432	10-II-1.983	6A. BTA.



7.710	10-X-1.984	6A. BTA.	15-XI-1.984-NO.	1.559
7.305	2I-X-1.985	6A. BTA.	18-XI-1.985-NO.	1.906
2.567	29-IV-1.987	6A. BTA.	7-V- 1.987-NO.	2.386
4.278	3-VII-1.987	6A. BTA.	23-VII-1987 NO.	215.652
2.657	25- IV-1.988	6A. BTA.	19- V -1988-NO.	2.740
9.033	21-XII-1.990	6A. BTA.	10- I - 1991-NO.	3.786
25	3- I -1.991	6A. BTA.	10- I - 1991-NO.	3.787
1.608	8-III-1.991	6A. BTA.	14-III- 1991-NO.	3.841
2.155	2-IV- 1.991	6A. BTA.	8-IV - 1991-NO.	3.862
797	7-II -1.991	6A. BTA.	7- V -1991-NO.	3.882
1.739	14-III-1.991	6A. BTA.	7- V -1991-NO.	3.881
5.886	21-VIII-1.991	6A. BTA.	27-VIII-1991 NO.	4.019
8.596	4-XII -1.991	6A. BTA.	16-III -1992 NO.	4.430
1.494	10-III -1.992	6A. BTA.	19-III -1992 NO.	4.436
4.205	8 -VII -1.992	6A. BTA.	15-VII -1992 NO.	4.554
8.829	16-XII -1.992	6A. BTA.	24-XII -1992 NO.	4.819
12	5-I -1.993	6 STAFE BTA	13-I -1993 NO.	4.850
4.877	29-VI -1.993	6 STAFE BTA	7-VII -1993 NO.	5.065
5.216	12-VII -1.993	6 STAFE BTA	16-VII -1993 NO.	5.077
ACTA NO. 71	2-IX- 1.993	JUNTA DE SOCIOS	29-IX- 1993 NO.	5.174
2.034	18-IV- 1.995	6 STAFE BTA	27- IV -1995 NO.	5.937
2.227	25-IV-1.995	6 STAFE BTA	18-VIII-1.995 NO.	6.092
7.594	12-XII-1.995	6 STAFE BTA	19- XII-1.995 NO.	6.294
676	11- II-1.997	6 STAFE BTA	14- II -1.997 NO.	6.873

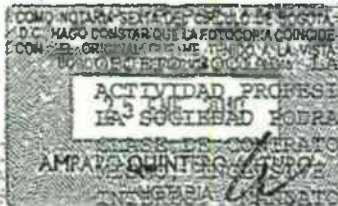
CERTIFICA:

REFORMAS:

E.P. NO.	FECHA	NOTARIA	CIUDAD	FECHA	NO. INSC.
0004506	1997/07/28	0006	BOGOTA D.C.	1997/09/02	00007115
0002103	1998/04/08	0006	BOGOTA D.C.	1998/04/21	00007426
0005326	1998/08/06	0006	BOGOTA D.C.	1998/08/13	00007544
0005538	1998/08/14	0006	BOGOTA D.C.	1998/08/27	00007564
0007760	1998/11/10	0006	BOGOTA D.C.	1998/11/12	00007644
0006709	1997/11/04	0006	BOGOTA D.C.	2000/12/04	00008481
0003034	2003/05/30	0006	BOGOTA D.C.	2003/06/04	00882729
0003786	2004/07/16	0006	BOGOTA D.C.	2004/07/28	00009703
0001432	2005/03/18	0006	BOGOTA D.C.	2005/04/07	00009917
0004818	2005/08/22	0006	BOGOTA D.C.	2005/08/26	00010008
0005506	2007/07/17	0006	BOGOTA D.C.	2007/07/24	00010841
5453	2009/10/19	0006	BOGOTA D.C.	2009/10/21	00012243

CERTIFICA:

VIGENCIA: QUE LA SOCIEDAD NO SE HALLA DISUELTA. DURACION HASTA EL 31 DE DICIEMBRE DE 2024 .



CERTIFICA:

SOCIEDAD TENDRA POR OBJETO: EL EJERCICIO DE LA ACTIVIDAD PROFESIONAL DE ABOGADOS. EN DESARROLLO DE ESTE OBJETO LA SOCIEDAD PODRA ADQUIRIR, CONTRAER OBLIGACIONES Y CELEBRAR TODA CLASE DE CONTRATOS DIRECTAMENTE RELACIONADOS Y SUBORDINADOS AL AMPARO QUINTERO, LOS DE ARRENDAMIENTO, HIPOTECA, MUTUO CON O SIN INTERES CIVIL Y COMERCIAL, Y SOCIEDAD, ASI COMO PARTICIPAR EN ASOCIACIONES CIENTIFICAS, GREMIALES O PROFESIONALES SIN ANIMO DE LUCRO.

CERTIFICA:

CAPITAL Y SOCIOS: \$10,000.00 DIVIDIDO EN 10,000.00 CUOTAS CON VALOR NOMINAL DE \$1.00 CADA UNA, DISTRIBUIDO ASI :
 = SOCIO CAPITALISTA (S)
 ASOCIACION CAVELIER DEL DERECHO N.I.T. 000008001722568



01



147

CAMARA DE COMERCIO DE BOGOTA

SEDE CHAPINERO

17 DE DICIEMBRE DE 2009 HORA 11:11:00

R027136832

PAGINA: 2 de 3

NO. CUOTAS: 8,800.00	VALOR: \$8,800.00
GAUDEBERT DE CAVELIER AGNES JEANNE	C.E. 000000000131100
NO. CUOTAS: 1,200.00	VALOR: \$1,200.00
- SOCIO INDUSTRIAL (S)	
CHAVARRO JORGE	C.C. 000000016209380
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
SUAREZ DE PAEZ LUZ CLEMENCIA	C.C. 000000035456344
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
PEÑA VALENZUELA DANIEL	C.C. 000000079518915
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
MARIN RUALES GERMAN HUMBERTO	C.C. 000000079155665
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
TOTALES	
NO. CUOTAS: 10,000.00	VALOR: \$10,000.00

CERTIFICA:

QUE POR ESCRITURAS PUBLICAS NO. 001431 Y 001432 DEL 18 DE MARZO DE 2005 DE LA NOTARIA 06 DE BOGOTA D.C., INSCRITA EL 07 DE ABRIL DE 2005 BAJO EL NO. 0009918 Y 0009917, RESPECTIVAMENTE DEL LIBRO XIII, DE LAS MIL DOSCIENTAS (1200) PARTES DE INTERES SOCIAL RADICADAS EN CABEZA DE AGNES GAUDEBERT DE CAVELIER, SEISCIENTAS (600) PARTES ESTAN GRAVADAS O AFECTADAS EN PROPIEDAD FIDUCIARIA A FAVOR DE LAS SIGUIENTES PERSONAS : GERMAN CAVELIER FRANCO, ERNESTO CAVELIER FRANCO, JORGE CAVELIER FRANCO, INES CAVELIER FRANCO, GUILLERMO CAVELIER FRANCO, ELENA CAVELIER FRANCO, ALEJANDRO CAVELIER FRANCO, BEATRIZ CAVELIER FRANCO, Y LUCIA CAVELIER FRANCO.

CERTIFICA:

REPRESENTACION LEGAL: EL REPRESENTANTE LEGAL ES EL DIRECTOR. EL SOCIO FUNDADOR GERMAN CAVELIER GAVIRIA TENDRA EL CARACTER DE PRESIDENTE DIRECTOR. VITALICIO, PARTICIPARA POR DERECHO PROPIO EN EL CONSEJO SUPERIOR Y EN EL CONSEJO DIRECTIVO Y LLEVARA LA REPRESENTACION LEGAL DE LA SOCIEDAD CUANDO LO ESTIME PERTINENTE SIN LIMITACION ALGUNA. IGUAL PARTICIPACION Y ATRIBUCIONES TENDRA SU SUPLENTE AGNES GAUDEBERT DE CAVELIER CUANDO OCUPE EL CARGO, EN CASO DE FALTA ABSOLUTA DE GERMAN CAVELIER GAVIRIA. LOS SOCIOS COLECTIVOS ESTÁN AUTORIZADOS PARA EJERCER LA REPRESENTACIÓN DE LA SOCIEDAD EN CUALQUIER TIEMPO, SIN PERJUICIO DE LAS DELEGACIONES CONFERIDAS A LOS ORGANOS CREADOS POR LOS PRESENTES ESTATUTOS

CERTIFICA:

** NOMBRAMIENTOS **

QUE POR NO. 12 DE JUNTA DE SOCIOS DEL 14 DE AGOSTO DE 2009, INSCRITA EL 24 DE SEPTIEMBRE DE 2009 BAJO EL NUMERO 00012200 DEL LIBRO XIII, FUE (RON) NOMBRADO (S):

NOMBRE

IDENTIFICACION

DIRECTOR (REPRESENTANTE LEGAL DE LA ASOCIACIÓN CAVELIER DEL DERECHO)



C.C. 000000019066425

NOMBRE

IDENTIFICACION

CAVELIER GAVRIA GERMAN

C.C. 000000002877924

GAUDEBERT DE CAVELIER AGNES JEANNE

C.E. 000000000131100

CERTIFICA:

CERTIFICA:

NOMBRE

IDENTIFICACION

RINCON FANDINO MIGUEL ALFONSO

C.C. 000000002877024

CERTIFICA:

EL PRESENTE CERTIFICADO NO CONSTITUYE PERMISO DE
FUNCIONAMIENTO EN NINGUN CASO

★ ★ ★
★ ★ ●

POSSESSOR: CAMARA DE COMERCIO

[illegible]

140



CAMARA DE COMERCIO DE BOGOTA

SEDE CHAPINERO

17 DE DICIEMBRE DE 2009 HORA 11:11:00

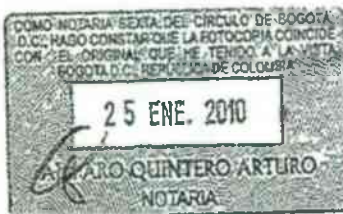
R027136832

PAGINA: 3 de 3

VALOR : \$ 3,500

DE CONFORMIDAD CON EL DECRETO 2150 DE 1995 Y LA AUTORIZACION IMPARTIDA POR LA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, MEDIANTE EL OFICIO DEL 18 DE NOVIEMBRE DE 1996, LA FIRMA MECANICA QUE APARECE A CONTINUACION TIENE PLENA VALIDEZ PARA TODOS LOS EFECTOS LEGALES

Esteban D



CAVELIER

ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a N° 72-35
BOGOTÁ 1 - COLOMBIA

REPRESENTACION

REPRESENTATION

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

BASF SE

concedido (s) 67056 Ludwigshafen, Germany
en/of

Por el presente nombramos a CAVELIER ABOGADOS, sociedad colectiva constituida de conformidad con las leyes de la República de Colombia, mediante Escritura Pública No. 6233 del 10 de septiembre de 1974, otorgada en la Notaría Sexta del Circuito de Bogotá, domiciliada en Bogotá D.C., con matrícula mercantil No. 00820237 y NIT 860341367-3, domiciliada en la Carrera 4a N° 72-35, Bogotá, Colombia, como nuestra representante en todos los asuntos de Propiedad Industrial, con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales.

CAVELIER ABOGADOS también podrá representarnos, con las mismas facultades arriba indicadas, ante cualesquiera entidades o personas, ejercer o no jurisdicción, autoridades administrativas o jurisdiccionales, tribunales de arbitramento, en asuntos de naturaleza civil, comercial, penal, constitucional, competencia, competencia fiscal, administrativa, contencioso administrativa, protección del consumidor, variedades vegetales, nombres de dominio, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, acciones de tutela, la protección de secretos industriales, derecho regulatorio y en general para que nos represente en cualesquiera acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan.

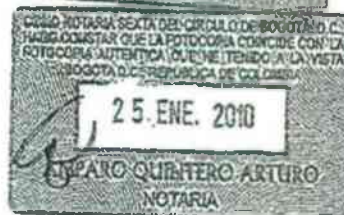
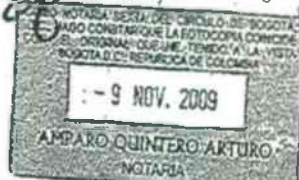
La representante podrá, en nuestro nombre, designar apoderados para actuar ante autoridades administrativas y judiciales, por vía extrajudicial y también procesalmente en nuestro nombre, como demandantes, como demandados, como litisconsortes, como agentes oficiosos, como terceros, por llamamiento en garantía o como intervinientes ad excludendum. Dentro de esta autorización, la representante podrá facultar a los apoderados que ella designe para transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar y sustituir el poder que se le otorgue. Así mismo, la representante tendrá la facultad para revocar

Do hereby appoint CAVELIER ABOGADOS, a general partnership organized under the laws of the Republic of Colombia by means of Public Deed No. 6233 of September 10, 1974, granted at Notary Sixth of the Bogota Circuit, domiciled in Bogota D.C., with Mercantile Registration No. 00820237 and Taxpayer Identification Number 860341367-3, domiciled at Carrera 4a N° 72-35, Bogota, Colombia, as our representative for all Industrial Property matters with faculty to receive notifications and appoint attorneys in and out of Court.

CAVELIER ABOGADOS may also represent us, with the same faculties stated above, before any entities or persons, with or without jurisdiction, administrative or jurisdictional authorities, courts of arbitration, in civil, commercial, criminal, constitutional, competition, unfair competition, administrative, administrative contentious, consumer protection, plant varieties, domain names, opposites or observation matters, administrative and Court cancellation, nullity, precautionary measures, licensing, action for writ mandamus, protection of trade secrets, regulatory law and in general represent us in any actions and suits instituted by us or against us.

The representative may, in our name, designate attorneys to act before administrative and judicial authorities, through out-of-court channels, and also procedurally in our name as plaintiff, defendant, joint litigant, representative without power of attorney, third party, when summoned to appear in court or as intervenor ad excludendum. Under this authorization, the representative may empower the attorneys appointed thereby to compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign and substitute the power of attorney granted thereto. Likewise, the representative shall have the faculty of revoking the

© CAVELIER ABOGADOS
WPC76652/111.158796



38/28/2009 10:27 FAX 5400550

CAVELIER AB06A005

0004/005

el poder es otorgado en el momento que considere pertinente. La representante en todo caso podrá ratificar los actos de agentes oficiales. power of attorney thus granted at any time it may deem convenient. The representative may in any case ratify the acts of representatives without a power of attorney.

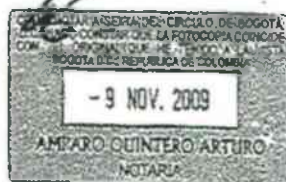
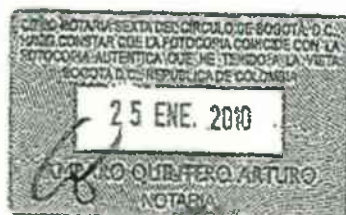
Dado y firmado hoy/Given and signed this 01. Okt. 2009

En/in 67056 Ludwigshafen, Germany

Por/by BASE SE

Firma/Signature

[Handwritten signatures]



© CAVELIER ABOGADOS
TEL: 16452/211.150796

U.R.Nr. 2319/2009

I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

1. graduate chemist Dr. Thomas Cimniak, chemist, at Ludwigshafen/Rhine, personally known to me,
2. graduate chemist Dr. Andreas Popp, chemist at Ludwigshafen/Rhine, personally known to me,

are true and valid.

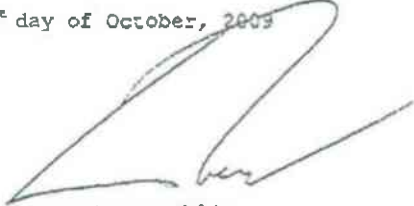
Graduate chemist Dr. Cimniak and graduate chemist Dr. Popp are acting on behalf of BASF SE at Ludwigshafen/Rhine.

After having checked today the competent register of commerce, I herewith confirm that graduate chemist Dr. Cimniak and graduate chemist Dr. Popp are directors who are authorized to jointly represent

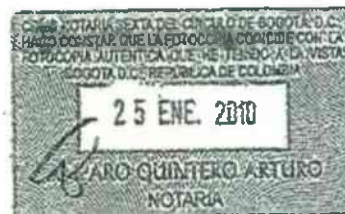
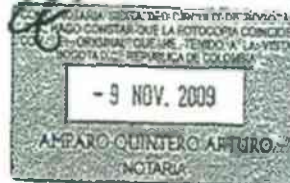
BASF SE,

Ludwigshafen/Rhine. I certify that this firm is a legal person duly organized under the laws of the Federal Republic of Germany and under the laws of the EUROPEAN UNION and that it is registered at the District Court of Ludwigshafen/Germany (HR B 6000).

Ludwigshafen/Rhine, this 1st day of October, 2009


notary public

Wert: 5.122,92 Euro



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

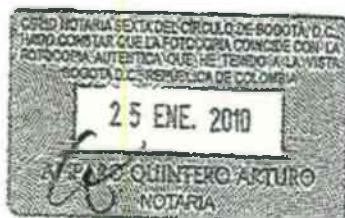
1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
Draxel-Fischer
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Ludwig Draxel-Fischer
in Ludwigshafen am Rhein

Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 5. Oktober 2009
7. durch die Präsidentin des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1026/09
9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag

(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,00 €



151

TRADUCCION OFICIAL 272/2009 DE UN DOCUMENTO, REALIZADA POR
EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL AUTORIZADO POR
RESOLUCION 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976, POR EL CUAL
CAVELIER ABOGADOS OTORGA REPRESENTACIÓN EN ASUNTOS DE
PROPIEDAD INDUSTRIAL A BASF SE, EMPRESA DOMICILIADA EN 67056
LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA.

DADO Y FIRMADO HOY PRIMERO DE OCTUBRE DE 2009 EN 67056,
LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, POR BASF SE.

DOS FIRMAS ILEGIBLES.

U.R. NR. 2319/2009

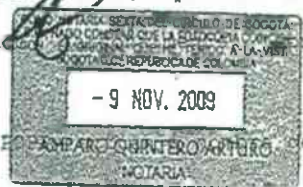
Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen,
Rhine, República Federal de Alemania, por la presente
testificamos y confirmamos que las firmas precedentes de

1. el químico graduado DR. THOMAS CIMNIAK, químico en
Ludwigshafen/Rhine, a quien conozco personalmente y

2 del químico graduado Dr. ANDREAS POPP, químico en
Ludwigshafen/Rhine, a quien conozco
verídicas y válidas.

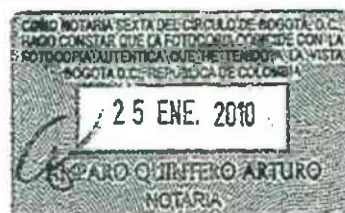
Los químicos graduados DRES CIMNIAK Y POPP
BASF SE en Ludwigshafen/Rhine.

Después de haber verificado hoy el registro de comercio
correspondiente, por la presente confirmo que los químicos
graduados DRES CIMNIAK Y POPP son directores autorizados para
representar conjuntamente a BASF SE, Ludwigshafen/Rhine,
certifico que esta firma es una persona jurídica debidamente
constituida de conformidad con las leyes de la República
Federal de Alemania y las leyes de la Unión Europea y que



Eduardo Calado N.

Eduardo Calado Noguera
TRADUCTOR OFICIAL
Inglés - Español - Inglés
Res. 541 Febrero de 1976



está registrada en la corte de distrito de LUDWIGSHAFEN,
ALEMANIA (HR B 6000).

Ludwigshafen/Rhine, primero de octubre de 2009.

Firma ilegible.

Valor 5112,92 euros

Apostilla NR. 91 Eb-1026/09

ECN\ECN\ID-160390\WPCL002G

Bogotá, 26 de octubre de 2009.

Eduardo Calzadilla

Eduardo Calzadilla Noguera
TRADUCTOR OFICIAL
Inglés-Español-Inglés
Rom. 541 Febrero de 1976

BO ASSE
CONFIRMATION
POLY-TEST

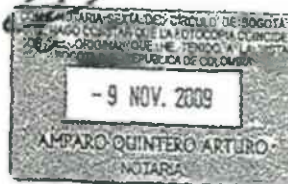
2009 OCT 29 A 04:42

JE E. CALZADILLA
BOGOTÁ D.C.

MINISTERIO DE
RELACIONES
EXTERIORES

2009 OCT 29 A 04:42

JE E. CALZADILLA
BOGOTÁ D.C.



La presente traducción oficial No. 0117/09 fue elaborada por Hernando Torres Barrera, Traductor e
Intérprete Oficial, según Resolución 01305 de 1998 del Ministerio de Justicia y del Derecho.

A continuación se traduce una apostilla en alemán, que acompaña a la Certificación Notarial No. 2319/2009
en idioma inglés, en un DOCUMENTO DE REPRESENTACIÓN.

APOSTILLA
(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania
2. Este documento público
3. está firmado por el Notario
Draxel-Fischer
4. en su calidad de Notario Público
5. lleva el sello del Notario Ludwig Draxel-Fischer
6. en Ludwigshafen am Rhein

Certificado

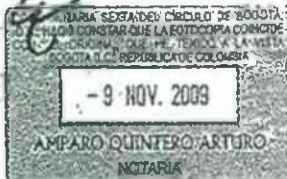
5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 5 de octubre de 2009
7. como Presidente del Tribunal Regional
8. según el No. 91 Eb - 1026/09
9. del Sr. [Firma]
10. Firma
- En representación:

[Firma manuscrita]
(Christian Kónaka)
Juez del Tribunal Regional

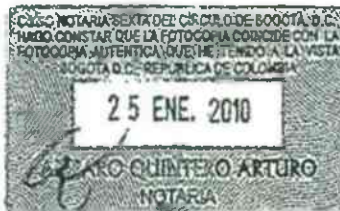
Anotación de Gastos Notariales:
Tasa 12,00 €

SELLO: PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN FRANKENTHAL (PFALZ)

Bogotá, D.C., 23 de octubre de 2009



Hernando Torres Barrera
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
RES. No. 1305 MINJUSTICIA 1998



AA 42874781



ESTA HOJA PERTENECE A LA ESCRITURA

PUBLICA NUMERO 267

DOSCIENTOS SESENTA Y SIETE

DE FECHA. -- ENERO (25)

DEL AÑO DOS MIL DIEZ (2010)

EN BLANCO... EN BLANCO

Caral
CARLOS ALBERTO GALLÓN GIRALDO

C.C. 19036821

TEL. 216702

Representante Legal de CAVELIER ABOGADOS



AMPARO QUINTANA ARANGO
NOTARIA SEXTA (664) DEL CIRCULO
DE BOGOTA D.C.

153

ES FIEL Y QUINTA COPIA (FOTOCOPIA) TOMADA DE LA ESCRITURA PUBLICA
NUMERO 0267 DE FECHA 25 DE ENERO DE 2010.

COPIA QUE EXPIDO CON DESTINO AL INTERESADO EN 10 HOJAS RUBRICADAS
EN SUS MARGENES, LA CUAL CARECE DE NOTAS DE REVOCATORIA
MODIFICACION O SUSTITUCION, POR TANTO SE PRESUME VIGENTE EL PODER
EN ELLA CONTENIDO.

BOGOTA D.C. ABRIL 08 DE 2010

RESOLUCION 01 DE 2009

LA NOTARIA SEXTA DE BOGOTA D.C.



AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

154

Notaría Sexta

6

DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.

COPIA NUMERO 1

DE LA ESCRITURA NUMERO: 5883
FECHA: 09/Noviembre/2009

ACTO O CONTRATO:
PODER GENERAL
OTORGANTES:
CAVELIER ABOGADOS
ROSA MARGARITA SANTA CRUZ



AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA SEXTA

CARRERA 9 No. 69-31 - PBX: 317 01 00 - FAX: 314 56 41
Correo Electrónico: notaria6debgta@etb.net.co

AA 42089377

155



ESCRITURA PÚBLICA NÚMERO: 5883 —
CINCO MIL OCHOCIENTOS OCHENTA Y TRES —
DE FECHA: NOVIEMBRE NUEVE (09) —
DEL AÑO DOS MIL NUEVE (2.009). —
OTORGADA EN LA NOTARÍA SEXTA (6ª.)

DEL CÍRCULO NOTARIAL DE BOGOTÁ, D.C. —

ACTO: PODER GENERAL. —

ACTO SIN CUANTÍA: \$ - 0 - . —

En la ciudad de Bogotá, Distrito Capital, Departamento de Cundinamarca, República de Colombia, ante mí AMPARO QUINTERO —
ARTURO — — — — — Notaria Sexta (6ª.) — — — — —

de este Círculo Notarial, se otorgó la escritura pública que se consigna en los siguientes términos: —

COMPARECENCIA: Con minuta enviada por correo electrónico, compareció el señor **CARLOS ALBERTO GALLÓN GIRALDO**, mayor de edad, vecino de esta ciudad, casado, identificado con la cédula de ciudadanía número 19.066.425 de Bogotá, y dijo: —

ESTIPULACIONES: PRIMERA- Que obra en su calidad de Representante Legal de la sociedad denominada **CAVELIER ABOGADOS** domiciliada en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. —

SEGUNDA: Que **BASF SE**, sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania domiciliada en Ludwigshafen am Rhein, Alemania, designó a **CAVELIER ABOGADOS**, como su Representante para la Propiedad Industrial en Colombia con facultades de nombrar apoderados, tal como consta en la copia auténtica del documento de representación que se protocoliza. —

TERCERA- Que en su carácter de Representante Legal de **CAVELIER ABOGADOS**, y en desarrollo de la facultad otorgada por **BASF SE**, confiere poder a los abogados **ROSA MARGARITA SANTACRUZ**, T.P.A. No. 49.434, identificada con cédula de ciudadanía número 35.501.911 Suba (Bogotá, D.E.), **OSCAR FERNANDO CORREA BARBOSA**, T.P.A. No. 71.027, identificado con cédula de ciudadanía número 79.524. de Bogotá, **LUZ CLEMENCIA DE PAEZ**, T.P.A. No. 23.555, identificada

con cédula de ciudadanía número 35.456.344 de Usaquen y **GERMAN HUMBERTO MARIN RUALES**, T.P.A. No. 64.239, identificado con cédula de ciudadanía número 79.155.665 de Bogotá, mayores de edad, vecinos de Bogotá, para que representen a la sociedad a cuyo nombre actúa, ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, incluyendo las del orden administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, trazado de circuitos integrados, secretos industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales, denominaciones de origen e indicaciones de procedencia, su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones, cancelación administrativa o judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales y de nombres de dominio junto con su administración y pago; y en general los procesos civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos, de conciliación, arbitramento, tutela relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan.

CUARTO.- Que los apoderados designados están facultados en todos los asuntos arriba determinados para sustituir este mandato, transigir, conciliar, arbitrar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar y ratificar los actos de agentes oficiosos.

QUINTO.- Que protocoliza con la presente escritura, un certificado expedido por la Cámara de Comercio de Bogotá, que acredita la constitución y personería de la sociedad **CAVELIER ABOGADOS**, igualmente protocoliza copia autenticada del documento de representación otorgado el día primero (1o.)

de Octubre de dos mil nueve (2009) -----

por BASF SE -----

documento que está debidamente legalizado por el Notario Público de --

Ludwigshafen, Rhine, República Federal de Alemania. -----



01



* 6 5 5 4 4 3 0 7 *

156

CAMARA DE COMERCIO DE BOGOTA

SEDE CHAPINERO

29 DE OCTUBRE DE 2009 HORA 11:45:41

09NEB1029138

PAGINA: 1 de 3

CERTIFICADO DE EXISTENCIA Y REPRESENTACION LEGAL O INSCRIPCION DE DOCUMENTOS

CERTIFICA:

NOMBRE : CAVELIER ABOGADOS
N.I.T. : 860041367-3
DOMICILIO : BOGOTA D.C.

CERTIFICA:

NO: 00820237

CERTIFICA:

CONSTITUCION : QUE POR ESCRITURA PUBLICA NO. 0006233 DE NOTARIA SEXTA DE BOGOTA D.C. DEL 10 DE SEPTIEMBRE DE 1974 , INSCRITA EL 26 DE SEPTIEMBRE DE 1974 BAJO EL NUMERO 00021234 DEL LIBRO IX, SE CONSTITUYO LA SOCIEDAD CIVIL DENOMINADA: CAVELIER PERDOMO Y CAVELIER.

CERTIFICA :

QUE POR ESCRITURA PUBLICA NO. 0001000 DE NOTARIA SEXTA DE BOGOTA D.C. DEL 10 DE MARZO DE 1983 , INSCRITA EL 5 DE ABRIL DE 1983 BAJO EL NUMERO 00130769 DEL LIBRO IX, LA SOCIEDAD CAMBIO SU NOMBRE DE : CAVELIER PERDOMO Y CAVELIER. POR EL DE : CAVELIER ABOGADOS

CERTIFICA:

QUE POR ESCRITURA PUBLICA NUMERO 1.000 OTORGADA EN LA NOTARIA 6A. DE BOGOTA EL 10 DE MARZO DE 1.983, INSCRITA EN ESTA CAMARA DE COMERCIO EL 5 DE ABRIL DE 1.983 BAJO EL NUMERO 130769 DEL LIBRO IX, LA SOCIEDAD CAMBIO SU NOMBRE DE: CAVELIER PERDOMO Y CAVELIER, POR EL DE: CAVELIER ABOGADOS, E INTRODUJO OTRAS REFORMAS.

CERTIFICA:

CERTIFICA

QUE POR E.P.NO. 2.034 DE LA NOTARIA 6 DE SANTAFE DE BOGOTA DEL 18 DE ABRIL DE 1.995, INSCRITA EL 27 DE ABRIL DE 1.995 BAJO EL NO. 5.937 DEL LIBRO XIII, LA SOCIEDAD TRASLADO SU DOMICILIO DE LA CIUDAD DE SANTAFE DE BOGOTA D.C. AL MUNICIPIO DE TABIO (CUNDINAMARCA) .-

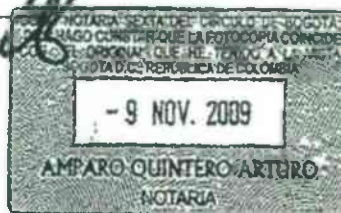
CERTIFICA:

QUE POR ESCRITURA PUBLICA NO. 7710 DE LA NOTARIA SEXTA DE BOGOTA DEL 10 DE OCTUBRE DE 1984, INSCRITA EL 15 DE NOVIEMBRE DE 1984 BAJO EL NO. 1559 DEL LIBRO XIII, LA SOCIEDAD CAMBIO SU NATURALEZA JURIDICA DE SOCIEDAD COMERCIAL A SOCIEDAD CIVIL.

CERTIFICA:

REFORMAS:

ESCRITURAS NO.	FECHA	NOTARIA	INSCRIPCION
842	10-V-1.977	18. ETA.	27-V-1.977-NO. 46.204
3.430	1-VII-1.980	6A. BTA.	3-IX-1.980-NO. 89.582
4.844	10-IX-1.980	6A. BTA.	8-X-1.980-NO. 91.261
432	10-II-1.983	6A. BTA.	1-III-1.983-NO.129.337



7.710	10-X-1.984	6A. BTA.	15-XI-1.984-NO.	1.559
7.305	21-X-1.985	6A. BTA.	18-XI-1.985-NO.	1.906
2.567	29-IV-1.987	6A. BTA.	7-V- 1.987-NO.	2.386
4.278	3-VII-1.987	6A. BTA.	23-VII-1987 NO.	215.652
2.657	25- IV-1.988	6A. BTA.	19- V -1988-NO.	2.740
9.033	21-XII-1.990	6A. BTA.	10- I - 1991-NO.	3.786
25	3- I -1.991	6A. BTA.	10- I - 1991-NO.	3.787
1.608	8-III-1.991	6A. BTA.	14-III- 1991-NO.	3.841
2.155	2-IV- 1.991	6A. BTA.	8-IV - 1991-NO.	3.862
797	7-II -1.991	6A. BTA.	7- V -1991-NO.	3.882
1.739	14-III-1.991	6A. BTA.	7- V -1991-NO.	3.881
5.886	21-VIII-1.991	6A. BTA.	27-VIII-1991 NO.	4.019
8.596	4-XII -1.991	6A. BTA.	16-III -1992 NO.	4.430
1.494	10-III -1.992	6A. BTA.	19-III -1992 NO.	4.436
4.205	8 -VII -1.992	6A. BTA.	15-VII -1992 NO.	4.554
8.829	16-XII -1.992	6A. BTA.	24-XII -1992 NO.	4.819
12	S-I -1.993	6 STAFE BTA	13-I -1993 NO.	4.850
4.877	29-VI -1.993	6 STAFE BTA	7-VII -1993 NO.	5.065
5.216	12-VII -1.993	6 STAFE BTA	16-VII -1993 NO.	5.077
ACTA NO.71	2-IX- 1.993	JUNTA DE SOCIOS	29-IX- 1993 NO.	5.174
2.034	18-IV- 1.995	6 STAFE BTA	27- IV -1995 NO.	5.937
2.227	25-IV-1.995	6 STAFE BTA	18-VIII-1.995 NO.	6.092
7.594	12-XII-1.995	6 STAFE BTA	19- XII-1.995 NO.	6.294
676	11- II-1.997	6 STAFE BTA	14- II -1.997 NO.	6.873

CERTIFICA:

REFORMAS:

E.P. NO.	FECHA	NOTARIA	CIUDAD	FECHA	NO. INSC.
0004506	1997/07/28	0006	BOGOTA D.C.	1997/09/02	00007115
0002103	1998/04/08	0006	BOGOTA D.C.	1998/04/21	00007426
0005326	1998/08/06	0006	BOGOTA D.C.	1998/08/13	00007544
0005538	1998/08/14	0006	BOGOTA D.C.	1998/08/27	00007564
0007760	1998/11/10	0006	BOGOTA D.C.	1998/11/12	00007644
0006709	1997/11/04	0006	BOGOTA D.C.	2000/12/04	00008481
0003034	2003/05/30	0006	BOGOTA D.C.	2003/06/04	00882729
0003786	2004/07/16	0006	BOGOTA D.C.	2004/07/28	00009703
0001432	2005/03/18	0006	BOGOTA D.C.	2005/04/07	00009917
0004818	2005/08/22	0006	BOGOTA D.C.	2005/08/26	00010008
0005506	2007/07/17	0006	BOGOTA D.C.	2007/07/24	00010841
0006006	2009/10/21	0006	BOGOTA D.C.	2009/10/21	00012243

CERTIFICA:



SOCIEDAD NO SE HALLA DISUELTA. DURACION HASTA EL 13 DE SEPTIEMBRE DE 2024 .

CERTIFICA:

SOCIEDAD TENDRA POR OBJETO : EL EJERCICIO DE LA ACTIVIDAD PROFESIONAL DE ABOGADOS. EN DESARROLLO DE ESTE OBJETO ADQUIRIR, CONTRAER OBLIGACIONES Y CELEBRAR TODA CLASE DE CONTRATOS DIRECTAMENTE RELACIONADOS Y SUBORDINADOS AL MISMO, INCLUSIVE LOS DE ARRENDAMIENTO, HIPOTECA, MUTUO CON O SIN INTERES, MANDATO CIVIL Y COMERCIAL, Y SOCIEDAD, ASI COMO PARTICIPAR EN ASOCIACIONES CIENTIFICAS, GREMIALES O PROFESIONALES SIN ANIMO DE LUCRO.

CERTIFICA:

CAPITAL Y SOCIOS: \$10,000.00 DIVIDIDO EN 10,000.00 CUOTAS CON VALOR NOMINAL DE \$1.00 CADA UNA, DISTRIBUIDO ASI :
- SOCIO CAPITALISTA (S)
ASOCIACION CAVELIER DEL DERECHO N.I.T. 000098001722568



01



* 8 6 5 4 4 3 0 8 *

157

CAMARA DE COMERCIO DE BOGOTA

SEDE CHAPINERO

29 DE OCTUBRE DE 2009 HORA 11:45:41

09NEB1029138

PAGINA: 2 de 3

NO. CUOTAS: 8,800.00	VALOR: \$8,800.00
GAUDEBERT DE CAVELIER AGNES JEANNE	C.E. 000000000131100
NO. CUOTAS: 1,200.00	VALOR: \$1,200.00
- SOCIO INDUSTRIAL (S)	
CHAVARRO JORGE	C.C. 000000016209380
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
SUAREZ DE PAEZ LUZ CLEMENCIA	C.C. 000000035456344
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
PENA VALENZUELA DANIEL	C.C. 000000079518915
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
MARIN RUALES GERMAN HUMBERTO	C.C. 000000079155665
NO. CUOTAS: 0.00	VALOR: \$0.00
TOTALES	
NO. CUOTAS: 10,000.00	VALOR: \$10,000.00

CERTIFICA:

QUE POR ESCRITURAS PUBLICAS NO. 001431 Y 001432 DEL 18 DE MARZO DE 2005 DE LA NOTARIA 06 DE BOGOTA D.C., INSCRITA EL 07 DE ABRIL DE 2005 BAJO EL NO. 0009918 Y 0009917, RESPECTIVAMENTE DEL LIBRO XIII, DE LAS MIL DOSCIENTAS (1200) PARTES DE INTERES SOCIAL RADICADAS EN CABEZA DE AGNES GAUDEBERT DE CAVELIER, SEISCIENTAS (600) PARTES ESTAN GRAVADAS O AFECTADAS EN PROPIEDAD FIDUCIARIA A FAVOR DE LAS SIGUIENTES PERSONAS : GERMAN CAVELIER FRANCO, ERNESTO CAVELIER FRANCO, JORGE CAVELIER FRANCO, INES CAVELIER FRANCO, GUILLERMO CAVELIER FRANCO, ELENA CAVELIER FRANCO, ALEJANDRO CAVELIER FRANCO, BEATRIZ CAVELIER FRANCO, Y LUCIA CAVELIER FRANCO.

CERTIFICA:

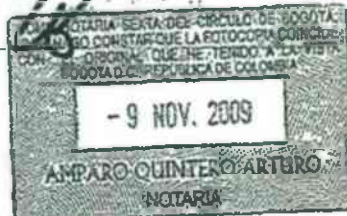
REPRESENTACION LEGAL: EL REPRESENTANTE LEGAL ES EL DIRECTOR. EL SOCIO FUNDADOR GERMAN CAVELIER GAVIRIA TENDRA EL CARACTER DE PRESIDENTE DIRECTOR VITALICIO, PARTICIPARA POR DERECHO PROPIO EN EL CONSEJO SUPERIOR Y EN EL CONSEJO DIRECTIVO Y LLEVARA LA REPRESENTACION LEGAL DE LA SOCIEDAD CUANDO LO ESTIME PERTINENTE SIN LIMITACION ALGUNA. IGUAL PARTICIPACION Y ATRIBUCIONES TENDRA SU SUPLENTE AGNES GAUDEBERT DE CAVELIER CUANDO OCUPE EL CARGO, EN CASO DE FALTA ABSOLUTA DE GERMAN CAVELIER GAVIRIA. LOS SOCIOS COLECTIVOS ESTÁN AUTORIZADOS PARA EJERCER LA REPRESENTACIÓN DE LA SOCIEDAD EN CUALQUIER TIEMPO, SIN PERJUICIO DE LAS DELEGACIONES CONFERIDAS A LOS ORGANOS CREADOS POR LOS PRESENTES ESTATUTOS

CERTIFICA:

** NOMBRAMIENTOS **

QUE POR NO. 12 DE JUNTA DE SOCIOS DEL 14 DE AGOSTO DE 2009, INSCRITA EL 24 DE SEPTIEMBRE DE 2009 BAJO EL NUMERO 00012200 DEL LIBRO XIII, FUE (RON) NOMBRADO (S):

NOMBRE	IDENTIFICACION
DIRECTOR (REPRESENTANTE LEGAL DE LA ASOCIACIÓN CAVELIER DEL DERECHO)	



C.C. 000000019066425

NOMBRE

IDENTIFICACION

CAVELIER GAVIRIA GERMAN

C.C. 000000002877924

GAUDEBERT DE CAVELIER AGNES JEANNE

C.E. 000000000131100

CERTIFICA:

FACULTADES DEL REPRESENTANTE LEGAL: APARTE DE LAS FACULTADES Y DEBERES QUE DE TIEMPO EN TIEMPO SE LE ASIGNEN POR EL CONSEJO SUPERIOR, EL DIRECTOR TENDRA LAS SIGUIENTES FUNCIONES : A) LA DE REPRESENTAR LEGALMENTE A LA SOCIEDAD ANTE LAS AUTORIDADES DE CUALQUIER ORDEN O NATURALIZA Y ANTE OTRAS PERSONAS NATURALES O JURIDICAS, CON FACULTADES PARA NOVAR, TRANSIGIR, COMPROMETER Y DESISTIR Y PARA COMPARECER EN JUICIOS INCLUSIVE EN AQUELLOS EN DONDE SE DISPUTE LA PROPIEDAD DE BIENES INMUEBLES; B) CUMPLIR Y HACER CUMPLIR LOS ESTATUTOS Y REGLAMENTOS DE LA SOCIEDAD; Y C) CREAR O SUPRIMIR TODOS LOS EMPLEOS QUE SEAN NECESARIOS DE ACUERDO CON EL CONSEJO SUPERIOR PARA EL BUEN FUNCIONAMIENTO DE LA SOCIEDAD, ASIGNARLES FUNCIONES, FIJAR SUS SALARIOS Y NOMBRAR LAS PERSONAS QUE DEBAN DESEMPEÑARLOS, ASI COMO RETIRARLOS Y REEMPLAZARLOS CUANDO HAYA LUGAR. CUANDO CUALQUIERA DE LOS ACTOS INDICADOS EN LA CLAUSULA ANTERIOR SE REFIERA A OPERACIONES CUYO MONTO EXCEDA DE LA SUMA EQUIVALENTE A CIENTO OCHENTA (180) SALARIOS MINIMOS MENSUALES, SU CELEBRACION REQUERIRA LA APROBACION PREVIA DEL CONSEJO SUPERIOR.

CERTIFICA:

** REVISOR FISCAL **

QUE POR ACTA NO. 0000071 DEL 2 DE SEPTIEMBRE DE 1993, INSCRITA EL 29 DE SEPTIEMBRE DE 1993 BAJO EL NUMERO 00005175 DEL LIBRO XIII, FUE (RON) NOMBRADO (S):

NOMBRE

IDENTIFICATION

REVISOR FISCAL

RINCON FANDIÑO MIGUEL ALFONSO

C.C. 000000002877024

CERTIFICA:

DE CONFORMIDAD CON LO ESTABLECIDO POR LA LEY 962 DE 2005, LOS ACTOS DE
CERTIFICADOS QUEDAN EN FIRME CINCO (5) DIAS HABILES
DE INSCRIPCION, SIEMPRE QUE NO SEAN OBJETO DE
INTERVENIR.

* 29 NOV 2009

AMPARO QUINTERO ARTURO

SECRET

CERTIFICADO NO CONSTITUYE PERMISO DE
ACIONAMIENTO EN NINGUN CASO

CAMARA DE COMERCIO

150



01



* 8 6 5 4 4 3 0 9 *

CAMARA DE COMERCIO DE BOGOTA

SEDE CHAPINERO

29 DE OCTUBRE DE 2009 HORA 11:45:41

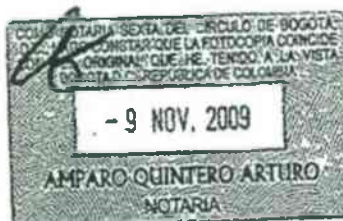
09NEB1029138

PAGINA: 3 de 3

VALOR : \$ 3,500

DE CONFORMIDAD CON EL DECRETO 2150 DE 1995 Y LA AUTORIZACION IMPARTIDA POR LA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, MEDIANTE EL OFICIO DEL 18 DE NOVIEMBRE DE 1996, LA FIRMA MECANICA QUE APARECE A CONTINUACION TIENE PLENA VALIDEZ PARA TODOS LOS EFECTOS LEGALES

Esteban D



CAVELIER

ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a N° 72-35
BOGOTÁ, D.C. - COLOMBIA

REPRESENTACION**REPRESENTATION**

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

BASF SE

domiciliado (s) 67056 Ludwigshafen, Germany
en/of

Por el presente nombramos a CAVELIER ABOGADOS, sociedad colectiva constituida de conformidad con las leyes de la República de Colombia, mediante Escritura Pública No. 6233 del 10 de septiembre de 1974, otorgada en la Notaría Sexta del Circuito de Bogotá, domiciliada en Bogotá D.C., con matrícula mercantil No. 00820237 y NIT 860041367-3, domiciliada en la Carrera 4a N° 72-35, Bogotá, Colombia, como nuestra representante en todos los asuntos de Propiedad Industrial, con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales.

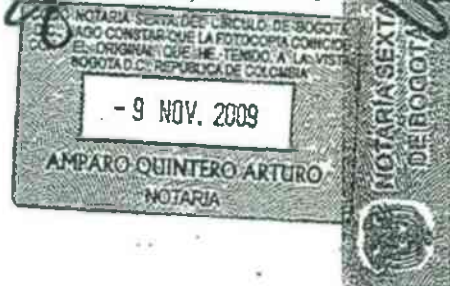
CAVELIER ABOGADOS también podrá representarnos, con las mismas facultades arriba indicadas, ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, autoridades administrativas o jurisdiccionales, tribunales de arbitramento, en asuntos de naturaleza civil, comercial, penal, constitucional, competencia, competencia decenal, administrativa, contencioso administrativo, protección del consumidor, variedades vegetales, nombres de dominio, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, acciones de tutela, la protección de secretos industriales, derecho regulatorio y en general para que nos represente en cualesquiera acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan.

La representante podrá, en nuestro nombre, designar apoderados para actuar ante autoridades administrativas y judiciales, por vía extrajudicial y también procesalmente en nuestro nombre, como demandantes, como demandados, como litisconsortes, como agentes oficiosos, como terceros, por llamamiento en garantía o como intervinientes ad excludendum. Dentro de esta autorización, la representante podrá facultar a los apoderados que ella designe para transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar y sustituir el poder que se le otorgue. Así mismo, la representante tendrá la facultad para revocar

Do hereby appoint CAVELIER ABOGADOS, a general partnership organized under the laws of the Republic of Colombia by means of Public Deed No. 6233 of September 10, 1974, granted at Notary Sixth of the Bogota Circuit, domiciled in Bogota D.C., with Mercantile Registration No. 00820237 and Taxpayer Identification Number 860041367-3, domiciled at Carrera 4a N° 72-35, Bogota, Colombia, as our representative for all Industrial Property matters with faculty to receive notifications and appoint attorneys in and out of Court.

CAVELIER ABOGADOS may also represent us, with the same faculties stated above, before any entities or persons, with or without jurisdiction, administrative or jurisdictional authorities, courts of arbitration, in civil, commercial, criminal, constitutional, competition, unfair competition, administrative, administrative contentious, consumer protection, plant varieties, domain names, opposition or observation matters, administrative and Court cancellation, nullity, precautionary measures, licensing, action for writ mandamus, protection of trade secrets, regulatory law and in general represent us in any actions and suits instituted by us or against us.

The representative may, in our name, designate attorneys to act before administrative and judicial authorities, through out-of-court channels, and also procedurally in our name as plaintiff, defendant, joint litigant, representative without power of attorney, third party, when summoned to appear in court or as intervenor ad excludendum. Under this authorization, the representative may empower the attorneys appointed thereby to compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign and substitute the power of attorney granted thereto. Likewise, the representative shall have the faculty of revoking the



05/28/2009 10:27 FAX 5400880

CAVELIER ABOGADOS

004/005

el poder así otorgado en el momento que considere
pertinente. La representante en todo caso podrá ratificar
los actos de agentes oficiosos.

power of attorney thus granted at any time it may deem
convenient. The representative may in any case ratify the
acts of representatives without a power of attorney.

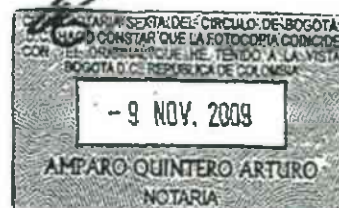
Dado y firmado hoy/Given and signed this 01. Okt. 2009

En/in 67056 Ludwigshafen, Germany

Por/by BASF SE

Firma/Signature

[Handwritten signatures]



© CAVELIER ABOGADOS
WZC16452/11-158786

U.R.Nr. 2319/2009

I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

1. graduate chemist Dr. Thomas Cimniak, chemist,
at Ludwigshafen/Rhine, personally known to me,
2. graduate chemist Dr. Andreas Popp, chemist
at Ludwigshafen/Rhine, personally known to me,

are true and valid.

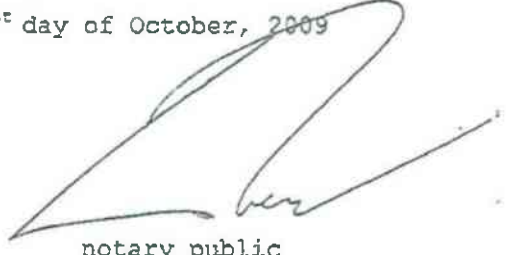
Graduate chemist Dr. Cimniak and graduate chemist Dr. Popp are acting on behalf of BASF SE at Ludwigshafen/Rhine.

After having checked today the competent register of commerce, I herewith confirm that graduate chemist Dr. Cimniak and graduate chemist Dr. Popp are directors who are authorized to jointly represent

BASF SE,

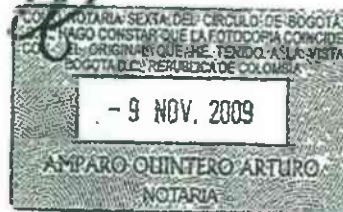
Ludwigshafen/Rhine. I certify that this firm is a legal person duly organized under the laws of the Federal Republic of Germany and under the laws of the EUROPEAN UNION and that it is registered at the District Court of Ludwigshafen/Germany (HR B 6000).

Ludwigshafen/Rhine, this 1st day of October, 2009



notary public

Wert: 5.112,92 Euro



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
Draxel-Fischer
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Ludwig Draxel-Fischer
in Ludwigshafen am Rhein

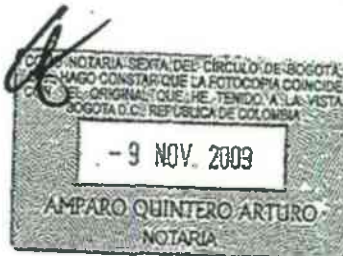
Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 5. Oktober 2009
7. durch die Präsidentin des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1026/09
9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,00 €



TRADUCCION OFICIAL 272/2009 DE UN DOCUMENTO, REALIZADA POR
EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL AUTORIZADO POR
RESOLUCION 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976, POR EL CUAL
CAVELIER ABOGADOS OTORGA REPRESENTACIÓN EN ASUNTOS DE
PROPIEDAD INDUSTRIAL A BASF SE, EMPRESA DOMICILIADA EN 67056
LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA.

DADO Y FIRMADO HOY PRIMERO DE OCTUBRE DE 2009 EN 67056,
LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, POR BASF SE.

DOS FIRMAS ILEGIBLES.

U.R. NR. 2319/2009

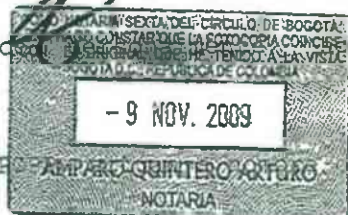
Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen,
Rhine, República Federal de Alemania, por la presente
testificamos y confirmamos que las firmas precedentes de

1. el químico graduado DR. THOMAS CIMNIAK, químico en
Ludwigshafen/Rhine, a quien conozco personalmente y

2 del químico graduado Dr. ANDREAS POPP, químico en
Ludwigshafen/Rhine, a quien conozco personalmente y
verídicas y válidas.

Los químicos graduados DRES CIMIAK Y POPP son directores autorizados para
BASF SE en Ludwigshafen/Rhine.

Después de haber verificado hoy el registro de comercio
correspondiente, por la presente confirmo que los químicos
graduados DRES CIMNIAK Y POPP son directores autorizados para
representar conjuntamente a BASF SE, Ludwigshafen/Rhine,
certifico que esta firma es una persona jurídica debidamente
constituida de conformidad con las leyes de la República
Federal de Alemania y las leyes de la Unión Europea y que



Eduardo Calado N.

Eduardo Calado Noguera
TRADUCTOR OFICIAL
Inglés - Español - Inglés
Res. 541 Febrero de 1976



está registrada en la corte de distrito de LUDWIGSHAFEN,
ALEMANIA (HR B 6000).

Ludwigshafen/Rhine, primero de octubre de 2009.

Firma ilegible.

Valor 5112,92 euros

Apostilla NR. 91 Eb-1026/09

ECN\ECN\ID-160390\WPCL002G

Bogotá, 26 de octubre de 2009.

Eduardo Calado N.

Eduardo Calado Noguera
TRADUCTOR OFICIAL
Inglés - Español - Inglés
Res. 541 Febrero de 1976

NO ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

2009 OCT 28 A 8:42

Alfonso
JEFE DE LEGATACIONES
BOGOTÁ D.C.

MINISTERIO DE
RELACIONES
EXTERIORES

Eduardo Calado
144195
LETA FIRMADA EN EL
GOBIERNO DE BOGOTÁ
LAS FUENTES AGUAS



La presente traducción oficial No. 0117/09 fue elaborada por Hernando Torres Barrera, Traductor e Intérprete Oficial, según Resolución 01305 de 1998 del Ministerio de Justicia y del Derecho.

A continuación se traduce una apostilla en alemán, que acompaña a la Certificación Notarial No. 2319/2009 en idioma inglés, en un DOCUMENTO DE REPRESENTACIÓN.

APOSTILLA
(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público

2. está firmado por el Notario
Draxel-Fischer

3. en su calidad de Notario Público

4. lleva el sello del Notario Ludwig Draxel-Fischer
en Ludwigshafen am Rhein

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)

6. el 5 de octubre de 2009

7. por la Presidenta del Tribunal Regional

8. 91 Eb - 1026/09

9. 

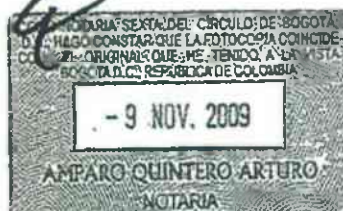
10. Firma
En representación:

(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

Anotación de Gastos Notariales:
Tasa 12,00 €

SEÑOR PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN FRANKENTHAL (PFALZ)

Bogotá, D.C., 23 de octubre de 2009




HERNANDO TORRES BARRERA
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
RES. No. 1305 MINJUSTICIA 1998





Presente el señor **CARLOS ALBERTO GALLÓN GIRALDO**, domiciliado en Bogotá, identificado como aparece al pie de su firma y manifestó que está conforme con el contenido de esta escritura pública. _____

- HASTA AQUI LAS DECLARACIONES DEL

INTERESADO - _____

"Se advirtió al otorgante de esta escritura de leer la totalidad de su texto, a fin de verificar la exactitud de todos los datos en ella consignados, con el fin de aclarar, modificar o corregir lo pertinente antes de firmarla, la firma de la misma demuestra su aprobación total; en consecuencia, la notaria no asume ninguna responsabilidad por errores o inexactitudes establecidas con posterioridad a la firma del otorgante y de la Notaria. En tal caso, estos deben ser corregidos mediante el otorgamiento de una nueva escritura, suscrita por todos los que intervinieron en la Inicial o por el actual titular del derecho y sufragados los gastos por los mismos (ARTICULO 35, DECRETO LEY 960 DE 1.970)". _____

LEIDO, el presente instrumento público por el otorgante y advertido de su Registro dentro del término legal, dio su asentimiento y en prueba de ello lo firma junto con la suscrita Notaria, quien en esta forma lo autoriza. _____

DERECHOS \$ 41.610.00 ✓ _____

IVA 16% \$ 12.810.00 ✓ _____

El presente instrumento público se extendió y firmó en las hojas de papel notarial números: **AA / 42083377 - 42083376** ✓ _____

EN BLANCO... EN BLANCO

4

165

EN BLANCO... EN BLANCO

Carlo
CARLOS ALBERTO GALLÓN GIRALDO

C.C. 19 066 4 25 PW

TEL. 3457240

DIRECCIÓN. Cr. 45 72-35, PW



AMPARO QUINTERO ARTURO

NOTARIA SEXTA (6ª.) DE BOGOTÁ, D.C.

BRL. POD GEN. CAVELIER 6659/09.-



ES FIEL Y PRIMERA COPIA (FOTOCOPIA) TOMADA DE LA ESCRITURA PUBLICA
NUMERO 5883 DE FECHA 09 DE NOVIEMBRE DE 2009.

COPIA QUE EXPIDO CON DESTINO AL INTERESADO EN 09 HOJAS RUBRICADAS
EN SUS MARGENES, LA CUAL CARECE DE NOTAS DE REVOCATORIA,
MODIFICACION O SUSTITUCION, POR TANTO SE PRESUME VIGENTE EL PODER
EN ELLA CONTENIDO.

BOGOTA D.C. NOVIEMBRE 10 DE 2009

RESOLUCION 01 DE 2009

LA NOTARIA SEXTA DE BOGOTA D.C.



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

164


Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 106279

Bogotá D.C., Octubre 07 de 2014 - 10:47:32

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

RE

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
RECIBO DE CA	999999999	96740	11/09/2014		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	96741	11/09/2014		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	99344	17/09/2014		31.000.00
RECIBO DE CA	999999999	101250	23/09/2014		62.000.00
RECIBO DE CA	999999999	101257	23/09/2014		1.000.00
RECIBO DE CA	999999999	101258	23/09/2014		1.000.00
RECIBO DE CA	999999999	104914	02/10/2014		520.000.00
RECIBO DE CA	999999999	104915	02/10/2014		520.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. RENTISTICO

1 50005-01-01 SOLICITUDES

CONCEPTO

1603 INVOCAR LA NOTORIEDAD DENTRO
DE UN TRAMITE DE OPOSICION

Vr.UNDITARIO Vr.CONCEPTO

464.000.00 464.000.00

\$464.000.00

SON: **CUATROCIENTOS SESENTA Y CUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-222438- -00000-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 166

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-035021- -00006-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 166

Coto-16452-841-125-3

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-810165 Call Center: (571) 6513240

Octubre 7 de 2014 - 10:47:33

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 106278

Bogotá D.C., Octubre 07 de 2014 - 10:47:32

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

RE

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	999999999	96740	11/09/2014		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	96741	11/09/2014		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	99344	17/09/2014		31.000.00
RECIBO DE CA	999999999	101250	23/09/2014		62.000.00
RECIBO DE CA	999999999	101257	23/09/2014		1.000.00
RECIBO DE CA	999999999	101258	23/09/2014		1.000.00
RECIBO DE CA	999999999	104914	02/10/2014		520.000.00
RECIBO DE CA	999999999	104915	02/10/2014		520.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. RENTISTICO

CONCEPTO

Vr.UNDITARIO Vr.CONCEPTO

4 50005-01-01 SOLICITUDES

1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA
ADICIONAL A LAS 10 INIC

31.000.00

124.000.00

\$124.000.00

SON: **CIENTO VEINTICUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENT

Responsable:

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-222438- -00000-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 166

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-035021- -00006-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 166

6010-16452-841-125-3

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-810165 Call Center: (571) 6513240

Octubre 7 de 2014 - 10:47:33

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO DE UTILIDAD ☐

Art 33 Decisión 486/00

☐	Indicación que se solicita 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 (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☐

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Unica

☐	Indicación que se solicita una PCT
☐	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita 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 ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-222438- -00000-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 166

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-035021- -00006-0000

Fecha: 2014-10-07 16:36:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 166