(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 362 274**

(51) Int. Cl.:
C07D 239/00 (2006.01)

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA T3

(96) Número de solicitud europea: **03785868 .5**
(96) Fecha de presentación : **15.12.2003**
(97) Número de publicación de la solicitud: **1585737**
(97) Fecha de publicación de la solicitud: **19.10.2005**

(54) Título: **Uracilos que presentan actividad herbicida.**

(30) Prioridad: **23.12.2002 IT MI02A2758**

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
30.06.2011

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
30.06.2011

(73) Titular/es: **ISAGRO S.p.A.**
Via Caldera 21 Fabbricato D, Ala 3
20153 Milano, IT

(72) Inventor/es: **Meazza, Giovanni;**
Paravidino, Piero;
Bettarini, Franco y
Fornara, Luca

(74) Agente: **Curell Aguilá, Marcelino**

ES 2 362 274 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Uracilos que presentan actividad herbicida.

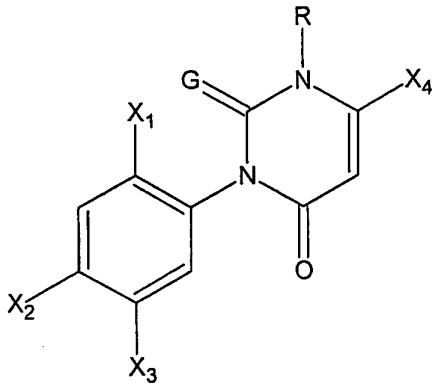
La presente invención se refiere a nuevos uracilos.

Más en particular, la presente invención se refiere a nuevos uracilos que presentan una elevada actividad herbicida, a los procedimientos para su preparación y a métodos para su utilización como herbicidas para el control de malezas en cultivos agrícolas.

Se describen uracilos que presentan una actividad herbicida, entre otros, en las patentes o solicitudes de patente US nº 4.859.229, US nº 5.084.084, EP 1122244 y WO 01/77084.

En la actualidad, el solicitante ha encontrado inesperadamente uracilos que, en comparación con los productos descritos en las patentes o solicitudes de patente anteriormente indicadas, muestran características mejoradas en términos de actividad herbicida con respecto a malezas y/o en términos de una fitotoxicidad más baja para los cultivos de interés agrícola.

Por lo tanto, el objetivo de la presente invención se refiere a nuevos uracilos que presentan la fórmula general (I):



en la que:

- X_1 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno,
- X_2 representa un átomo de halógeno,
- X_4 representa un grupo haloalquilo C_1-C_3,
- R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_3 o un grupo haloalquilo C_1-C_3,
- G representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,
- X_3 representa un grupo $W(CR_1R_2)_nZ$-,
- Z representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,
- R_1, R_2, iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_4 o un grupo haloalquilo C_1-C_4,
- n representa 1, 2 ó 3,
- Q representa un grupo heterocíclico seleccionado de entre 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, encontrándose dichos grupos, a su vez, opcionalmente sustituidos con átomos de halógeno seleccionados de entre cloro, flúor, bromo o yodo, o sustituidos con grupos seleccionados de entre alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6, alquenilo C_2-C_6 o haloalquenilo C_2-C_6, alqueniloxi C_2-C_6 o haloalqueniloxi C_2-C_6, alquinilo C_2-C_6 o haloalquinilo C_2-C_6, alquiniloxi C_2-C_6 o haloalquiniloxi C_2-C_5, alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6, alcoxialquilo C_2-C_6 o haloalcoxialquilo C_2-C_6, alcoxialcoxi C_2-C_6, haloalcoxialcoxi C_2-C_6, haloalcoxihaloalcoxi C_2-C_6, alcoxialcoxialquilo C_3-C_8, alcoxialcoxialcoxi C_3-C_8, alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6, alquiltioalquilo C_2-C_6, alquilsulfínico C_1-C_6 o haloalquilsulfínico C_1-C_6, alquilsulfónico C_1-C_6 o haloalquilsulfónico C_1-C_6, alcoxicarbonilo C_2-C_6 o haloalcoxicarbonilo C_2-C_6, alqueniloxicarbonilo C_3-C_7 o alquiniloxicarbonilo C_3-C_7, alcoxicarbonilalquilo

C_3-C_8 o haloalcoxicarbonilalquilo C_3-C_8, alqueniloxicarbonilalquilo C_4-C_9 o alquiniloxicarbonilalquilo C_4-C_9, alcoxicabonilalcoxi C_3-C_8, alqueniloxicarbonilalcoxi C_4-C_9 o alquiniloxicarbonilalcoxi C_4-C_9, aminocarbonilaocoxi C_3-C_8 posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4 o con un grupo alquileno C_2-C_5; CN, CHO, NO_2, NH_2, OH, cianoalquilo C_1-C_3, cianoalquiloxi C_1-C_3, formilalquilo C_2-C_6, alquilcarbonilo C_2-C_6, haloalquilcarbonilo C_2-C_6, alquilcarbonilalquilo C_3-C_7, alcoxiimino C_2-C_6, haloalcoxiimino C_2-C_6, alcoxiiminoalquilo C_3-C_6, haloalcoxiiminoalquilo C_3-C_6, alcoxiiminohaloalquilo C_3-C_6, aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo C_2-C_6, aminosulfonilo o aminosulfonilalquilo C_2-C_6, encontrándose estos últimos cuatro grupos posiblemente sustituidos con uno o dos grupos alquilo C_1-C_4 o con un grupo alquileno C_2-C_5; alquilsulfonilamino C_1-C_6, alquilcarbonilamino C_2-C_7 o alcoxicarbonilamino C_2-C_7, encontrándose estos tres últimos grupos posiblemente sustituidos con grupos alquilo C_1-C_4, arilo C_6-C_{10}, arilalquilo C_6-C_{12}, arilalcoxi C_6-C_{10}, ariloxialquilo C_7-C_{12}, arilalquiloxialquilo C_8-C_{12}, encontrándose dichos grupos, a su vez, posiblemente sustituidos con átomos de halógeno, grupos alquilo C_1-C_4, grupos haloalquilo C_1-C_3, grupos alcoxi C_1-C_4, grupos haloalcoxi C_1-C_3, CN; cicloalquilo C_3-C_7, cicloalquilalquilo C_6-C_{12}, cicloalquilalcoxi C_6-C_{10}, tetrahidropirán-2-ilo, encontrándose dichos grupos, a su vez, posiblemente sustituidos con átomos de halógeno, grupos alquilo C_1-C_4 o grupos alcoxi C_1-C_4.

Un objetivo adicional de la presente invención se refiere a la utilización de uracilos que presentan la fórmula general (I), a modo de herbicidas.

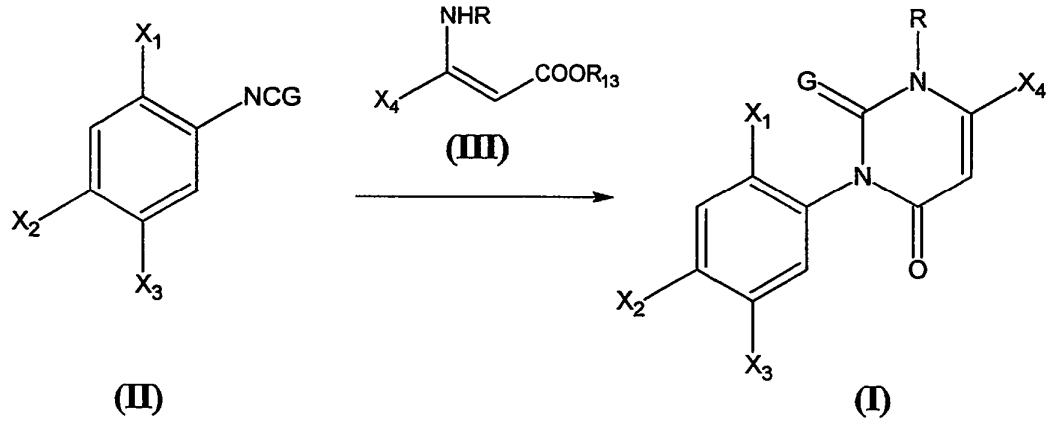
Son ejemplos específicos de compuestos que presentan la fórmula general (I) que resultan interesantes por su elevada actividad herbicida:

- 3-{5-[(5-terc-butil-1,3,4-oxadiazol-2-il)metoxi)-4-cloro-2-fluorofenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-{2,4-dicloro-5-[(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(1,2,4-oxadiazol-3-ilmetoxi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-[4-cloro-3-(1,2,4-oxadiazol-3-ilmetoxi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona.

Un objetivo adicional de la presente invención se refiere a procedimientos para la preparación de los compuestos que presentan la fórmula general (I).

En particular, los compuestos que presenta la fórmula general (I) pueden prepararse mediante la reacción de un isocianato o isotiocianato que presenta la fórmula general (II) mediante ciclocondensación con un 3-aminocrotonato que presenta la fórmula general (III) según el esquema de reacción 1.

Esquema 1:



En las fórmulas generales indicadas en dicho esquema de reacción:

- X_1, X_2, X_3, X_4, R y G presentan los significados definidos anteriormente,

- R_{13} representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4.

La reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (II) y los compuestos que presentan la fórmula general (III) preferentemente se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte y en presencia de una base orgánica o preferentemente inorgánica, a una temperatura comprendida entre -20ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción.

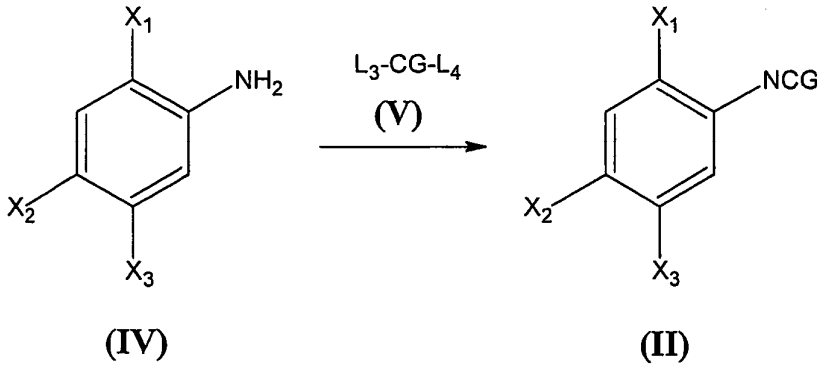
Entre los ejemplos de solventes que pueden utilizarse para la reacción anteriormente indicada se incluyen hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos (éter de petróleo, hexano, ciclohexano, etc.), hidrocarburos clorados (cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, etc.), hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc), éteres (éter dietílico, éter diisopropílico, dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, etc.), alcoholes y glicoles (metanol, etanol, metilcelosolve, etilenglicol, etc.), cetonas (acetona, metiletilcetona, metilpropilcetona, metilisobutilcetona, etc.), nitrilos (acetonitrilo, benzonitrilo, etc.), solventes dipolares apróticos (dimetilformamida, dimetilacetamida, hexametilfosforamida, dimetilsulfóxido, sulfolano, N-metilpirrolidona, etc.).

Las bases inorgánicas que pueden utilizarse son, por ejemplo, hidruros, hidróxidos y carbonatos de sodio y potasio.

Son bases orgánicas que resultan útiles para dicho propósito, por ejemplo, trietilamina, piridina, 4-N,N-dimetilaminopiridina, N,N-dimetilanilina, N-metilpiperidina, lutidina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) y diazabicicloundeceno (DBU).

Los isocianatos o isotiocianatos que presentan la fórmula general (II) pueden prepararse partiendo de una anilina sustituida adecuada que presenta la fórmula general (IV) mediante la reacción con un compuesto que presenta la fórmula general (V), tal como fosgeno, difosgeno, trifosgeno o tiofosgeno, según el esquema de reacción 2.

Esquema 2:



En las fórmulas generales indicadas en dicho esquema de reacción:

- X_1, X_2, X_3 y G presentan los significados definidos anteriormente,

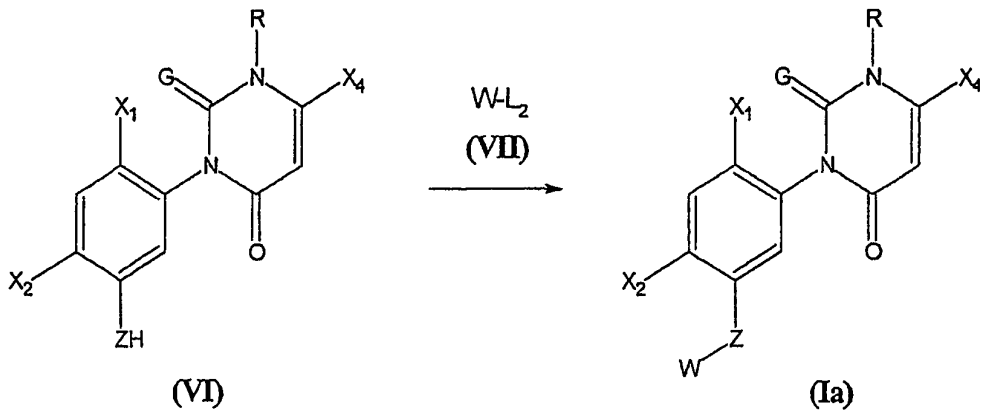
- L_3 y L_4, iguales o diferentes, representan un átomo de cloro o un grupo CCl_3O.

La reacción preferentemente se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte, a una temperatura comprendida entre 0ºC y el punto de ebullición de la mezcla, posiblemente en presencia de un catalizador tal como trietilamina, en una cantidad comprendida entre 0,001% y 100% en peso con respecto a la anilina (IV).

Los solventes orgánicos inertes que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidrocarburos clorados (por ejemplo cloruro de metileno, cloroformo, 1,2-dicloroetano, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), ésteres (por ejemplo acetato de etilo, etc.). En la reacción, se utiliza una cantidad de reactivo (V) comprendida entre 1 y 3 moles por mol de anilina (IV).

Los compuestos que presentan la fórmula general (I) también pueden prepararse mediante la reacción de un uracilo que presenta la fórmula general (VI) con un compuesto que presenta la fórmula general (VII), proporcionando compuestos (Ia) según el esquema de reacción 3:

Esquema 3:



En las fórmulas generales indicadas en dicho esquema de reacción:

- X_1, X_2, X_4, G y Z presentan los significados definidos anteriormente,
- R representa un grupo alquilo C_1-C_3 o un grupo haloalquilo C_1-C_3,
- W representa un grupo $Q(CR_1R_2)_n$-, en el que R_1, R_2 y Q presentan los significados definidos anteriormente,
- L_2 representa un átomo de halógeno, un grupo R_LSO_2O-, en el que R_L representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4, o representa un grupo $R_{L1}SO_2$- en el que R_{L1} representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4.

La reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (VI) y los compuestos que presentan la fórmula general (VII) preferentemente se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes y en presencia de una base, preferentemente una base inorgánica, a una temperatura comprendida entre -10ºC y la temperatura de ebullición de la mezcla de reacción.

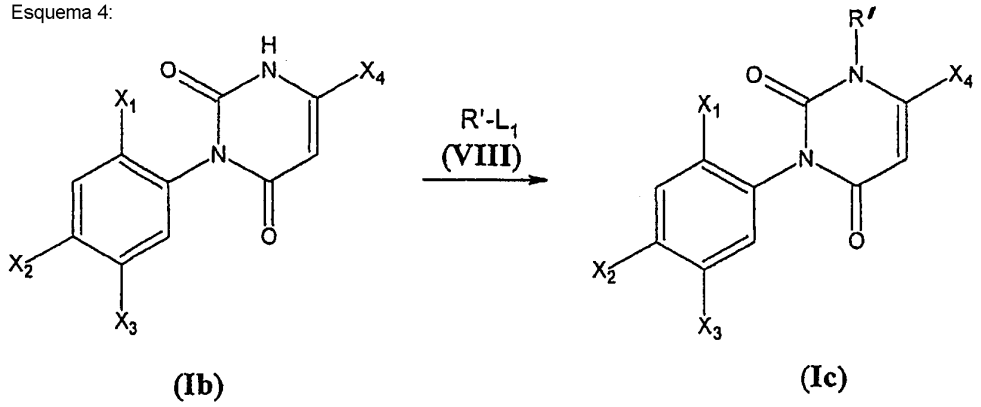
Los solventes orgánicos que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), éteres (éter dietílico, éter diisopropílico, dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, etc.), alcoholes y glicoles (metanol, etanol, metilcelosolve, etilenglicol, etc.), cetonas (acetona, metiletilcetona, metilpropilcetona, metilisobutilcetona, etc.), nitrilos (acetonitrilo, benzonitrilo, etc.), solventes dipolares apróticos (dimetilformamida, dimetilacetamida, hexametilfosforamida, dimetilsulfóxido, sulfolano, N-metilpirrolidona, etc.).

Son bases inorgánicas que resultan útiles para dicho propósito, por ejemplo, hidruros, hidróxidos y carbonatos de sodio o de potasio.

La reacción también puede llevarse a cabo ventajosamente en un sistema bifásico utilizando, a modo de solvente, agua y un solvente orgánico no miscible en agua, en presencia de catalizadores de transferencia de fase, según lo descrito por Dehmlow y Dehmlow en: "Phase Transfer Catalysis", (1983), Verlag Chemie.

Los compuestos que presenta la fórmula general (I), en la que G=O y R≠H, compuestos (Ic), también pueden prepararse mediante la reacción de un uracilo que presenta la fórmula general (Ib) con un compuesto de alquilación que presenta la fórmula general (VIII) según el esquema de reacción 4.

Esquema 4:



En las fórmulas generales indicadas en dicho esquema de reacción:

- X_1, X_2, X_3 y X_4 presentan los significados definidos anteriormente,

- R' representa un grupo alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_{1-3},

- L_1 representa un átomo de halógeno o un grupo R_LSO_2O-, en el que R_L representa un alquilo C_1-C_4 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4.

La reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (Ib) y los compuestos que presentan la fórmula general (VIII) preferentemente se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes y en presencia de una base, preferentemente una base inorgánica, a una temperatura comprendida entre -10ºC y la temperatura de ebullición de la mezcla de reacción.

Son solventes orgánicos que resultan útiles para dicho propósito, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), éteres (éter dietílico, éter diisopropílico, dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, etc.), alcoholes y glicoles (metanol, etanol, metilcelosolve, etilenglicol, etc.), cetonas (acetona, metiletilcetona, metilpropilcetona, metilisobutilcetona, etc.), nitrilos (acetonitrilo, benzonitrilo, etc.), solventes dipolares apróticos (dimetilformamida, dimetilacetamida, hexametilfosforamida, dimetilsulfóxido, sulfolano, N-metilpirrolidona, etc.).

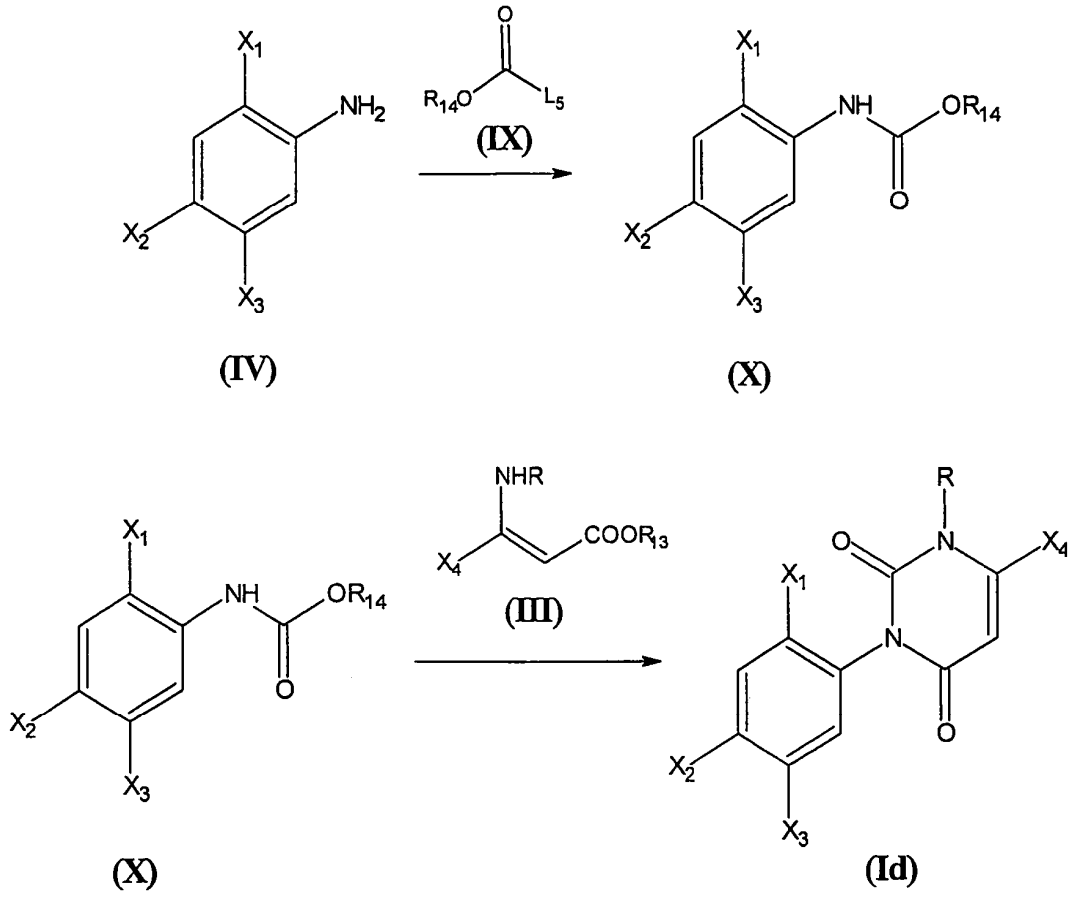
Las bases inorgánicas que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidruros, hidróxidos y carbonatos de sodio y de potasio.

La reacción también puede llevarse a cabo ventajosamente en un sistema bifásico utilizando, a modo de solvente, agua y un solvente orgánico no miscible en agua, en presencia de catalizadores de transferencia de fases, según lo descrito por Dehmlow y Dehmlow en: "Phase Transfer Catalysis" (1983) Verlag Chemie.

Los compuestos que presentan la fórmula general (I), en la que G=O, compuestos (Id), también pueden prepararse a partir de una anilina convenientemente sustituida que presenta la fórmula (IV) mediante reacción con cloroformato o un carbonato que presenta la fórmula (IX), proporcionando un carbamato que presenta la fórmula (X); lo anterior puede convertirse en compuestos de fórmula general (Id) mediante ciclocondensación con un 3-aminocrotonato que presenta la fórmula general (III).

Dicha secuencia de reacción se muestra en el esquema 5.

Esquema 5:



En las fórmulas generales mostradas en el esquema de reacción:

- X_1, X_2, X_3, X_4 y R presentan los significados definidos anteriormente,
- L_5 representa un átomo de halógeno o un grupo OR_{14},
- R_{13} y R_{14} representan un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4.

La reacción entre anilina que presenta la fórmula general (IV) y un compuesto que presenta la fórmula general (IX) preferentemente se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte, a una temperatura comprendida entre -10ºC y el punto de ebullición de la mezcla misma, en presencia de una base orgánica o inorgánica, en una cantidad comprendida entre 1 y 1,5 moles por mol de anilina (IV).

Son bases inorgánicas que resultan útiles para dicho propósito, por ejemplo, carbonato sódico, hidróxido sódico, etc.

Las bases orgánicas que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, trietilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, etc.

Los solventes orgánicos inertes que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidrocarburos clorados (por ejemplo cloruro de metileno, cloroformo, 1,2-dicloroetano, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), éteres (por ejemplo éter etílico, tetrahidrofurano, dioxano, etc.), ésteres (por ejemplo acetato de etilo, etc.).

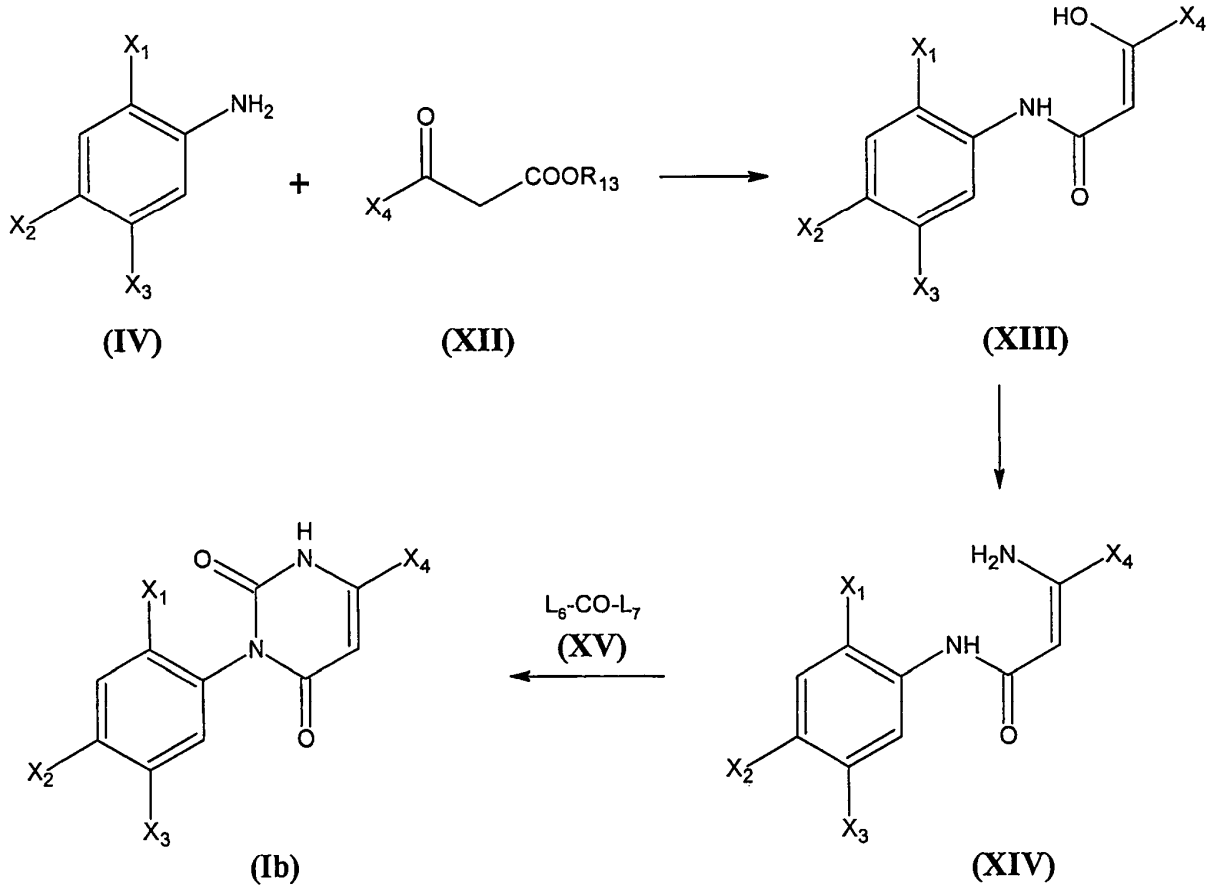
En la reacción, se utiliza una cantidad del compuesto que presenta la fórmula (IX) comprendida entre 1 y 1,5 moles por mol de anilina (IV).

Las condiciones operativas, así como la tipología de solvente y bases que resultan útiles para llevar a cabo la reacción de ciclocondensación de un carbamato que presenta la fórmula general (X) con un 3-aminocrotonato que presenta la fórmula general (III) mostrada en el esquema 5, son análogas a las mostradas para la reacción del esquema 1.

Los compuestos que presenta la fórmula general (Ib) también pueden prepararse partiendo de una anilina sustituida adecuada que presenta la fórmula general (IV), mediante reacción con un β-cetoéster que presenta la fórmula general (XII), proporcionando una anilida que presenta la fórmula general (XIII); lo anterior puede convertirse fácilmente en el intermediario de fórmula general (XIV) mediante aminación con amonio o sales amónicas; este último intermediario puede convertirse en los compuestos de fórmula general (Ib) mediante ciclización con un compuesto de fórmula general (XV), tal como fosgeno o difosgeno.

Dicha secuencia de reacción se muestra en el esquema 6.

Esquema 6:



En las fórmulas generales indicadas en dicho esquema de reacción:

- X_1, X_2, X_3 y X_4 presentan los significados definidos anteriormente,

- R_{13} representa un grupo alquilo o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4,

- L_6 y L_7 presentan el mismo significado o significados diferentes, representando un átomo de cloro, un grupo CCl_3O-, un grupo alcoxi C_1-C_4, un grupo fenoxi, un grupo imidazol-1-ilo o un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo.

La reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (IV) y los compuestos que presentan la fórmula general (XII) preferentemente se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes, a una temperatura comprendida entre -10ºC y la temperatura de ebullición de la mezcla de reacción; se utiliza una cantidad de compuesto (XII) comprendida entre 1 y 3 moles por mol de anilina (IV).

La reacción también puede llevarse a cabo eliminando simultáneamente mediante destilación el compuesto $R_{13}OH$ formado durante la reacción, solo o en una mezcla con el solvente utilizado.

Los solventes orgánicos inertes que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos (éter de petróleo, hexano, ciclohexano, etc.), hidrocarburos clorados (por ejemplo cloruro de metileno, cloroformo, 1,2-dicloroetano, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), éteres (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano, etc.), nitrilos (acetonitrilo, benzonitrilo, etc.), solventes dipolares apróticos (dimetilformamida, dimetilacetamida, hexametilfosforamida, dimetilsulfóxido, sulfolano, N-metilpirrolidona, etc.).

La reacción también puede llevarse a cabo en presencia de una base orgánica adecuada, por ejemplo piridina, 4-dimetilaminopiridina, etc., en una cantidad comprendida entre 0,001 y 1 mol por cada mol de compuesto (IV).

La transformación de compuestos que presentan la fórmula general (XIII) en compuestos que presentan la fórmula general (XIV) preferentemente se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes, a una temperatura comprendida entre -10ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción; en la reacción se utiliza amonio o una sal amónica adecuada, por ejemplo acetato amónico, en una cantidad comprendida entre 1 y 20 moles por cada mol de compuesto (XIII).

Los solventes orgánicos inertes que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidrocarburos clorados (por ejemplo cloruro de metileno, cloroformo, 1,2-dicloroetano, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), éteres (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano, etc.), nitrilos (acetonitrilo, benzonitrilo, etc.), solventes dipolares apróticos (dimetilformamida, dimetilacetamida, hexametilfosforamida, dimetilsulfóxido, sulfolano, N-metilpirrolidona, etc.).

Alternativamente, en el caso de que se utilice una sal amónica, la reacción puede llevarse a cabo en ausencia de solvente, a una temperatura comprendida entre 20ºC y 200ºC.

La reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (XIV) y los compuestos que presentan la fórmula general (XV) preferentemente se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes, a una temperatura comprendida entre -10ºC y la temperatura de ebullición de la mezcla de reacción; se utiliza una cantidad de compuesto (XV) comprendida entre 1 y 5 moles por cada mol de compuesto (XIV).

La reacción preferentemente se lleva a cabo en presencia de una base orgánica o inorgánica adecuada, en una cantidad comprendida entre 1 y 5 moles por cada mol de compuesto (XIV).

Las bases inorgánicas que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, hidróxidos y carbonatos de sodio y de potasio, etc.

Las bases orgánicas que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, trietilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, etc.

Además de la base, preferentemente se utiliza un catalizador adecuado, por ejemplo 4-dimetilaminopiridina, en una cantidad comprendida entre 0,001 y 1 mol por cada mol de compuesto (XIV).

Los solventes orgánicos inertes que resultan útiles para dicho propósito son, por ejemplo, ésteres (por ejemplo acetato de etilo, etc.), hidrocarburos clorados (por ejemplo cloruro de metileno, cloroformo, 1,2-dicloroetano, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), alcoholes y glicoles (metanol, etanol, metilcelosolve, etilenglicol, etc.), cetonas (acetona, metiletilcetona, metilpropilcetona, metilisobutilcetona, etc.), éteres (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano, etc.), nitrilos (acetonitrilo, benzonitrilo, etc.), solventes dipolares apróticos (dimetilformamida, dimetilacetamida, hexametilfosforamida, dimetilsulfóxido, sulfolano, N-metilpirrolidona, etc.).

Los productos intermediarios que presentan las fórmulas generales (III), (V), (VII), (VIII), (IX), (XII) y (XV), en el caso de que no sean conocidas *per se*, se preparan fácilmente siguiendo métodos conocidos de química orgánica.

En algunos casos, los compuestos que presentan la fórmula general (I) pueden obtenerse en forma de dos o más isómeros ópticos o geométricos, o posicionales.

Por lo tanto, se encuentra comprendido dentro del espíritu de la presente invención considerar ambos compuestos isoméricamente puros que presentan la fórmula general (I), y mezclas de los mismos, opcionalmente obtenidos durante la preparación de los compuestos que presentan la fórmula general (I) o derivados de una separación incompleta de los isómeros, en cualquier proporción.

Tal como ya se ha mencionado, los compuestos que presentan la fórmula general (I) presentan una elevada actividad herbicida, lo que implica que resultan adecuados para la utilización en el campo agrícola para la protección de cultivos útiles frente a malezas.

En particular, los compuestos que son objeto de la presente invención resultan efectivos en el control, tanto preemergente como postemergente, de numerosas malezas monocotiledóneas y dicotiledóneas. Simultáneamente, dichos compuestos pueden mostrar compatibilidad o ausencia de efectos tóxicos, con respecto a cultivos útiles en el tratamiento preemergente o postemergente.

Los compuestos de la presente invención pueden actuar como herbicidas totales o selectivas también en relación a la cantidad del principio activo utilizado.

Son ejemplos de malezas que pueden controlarse eficazmente mediante la utilización de los compuestos que presentan la fórmula general (I): *Abutilon theofrasti, Alisma plantago, Amaranthus* spp*., Amni maius, Capsella bursa-pastoris, Chenopodium album, Convolvulus sepium, Galium aparine, Geranium dissectum, Ipomea* spp*., Matricaria* spp*., Papaver rhoaes, Phaseolus aureus, Polygonum persicaria, Portulaca oleracea, Sida spinosa, Sinapsis arvensis, Solanum nigrum, Stellaria media, Veronica* spp*., Viola* spp*., Xanthium* spp*., Alopecurus myosuroides, Avena fatua, Cyperus spp., Digitaria sanguinalis, Echinocloa spp., Heleocaris avicularis, Heteranthera spp., Panicum* spp*., Poa* spp*., Scirpus* spp*., Sorghum* spp., etc.

Muchos de los compuestos anteriormente indicados no presentan efectos tóxicos, a la dosis utilizada en las aplicaciones agronómicas, contra uno o más cultivos importantes, tales como arroz (*Oryza sativa*), trigo (*Triticum* sp.), cebada (*Hordeum vulgare*), maíz (*Zea mays*) y soja (*Glycine max*).

Un objetivo adicional de la presente invención se refiere a un método para el control de malezas en zonas cultivadas, mediante la aplicación de los compuestos que presentan la fórmula general (I).

La cantidad del compuesto que debe utilizarse para obtener el efecto deseado puede variar en relación a varios factores, tales como, por ejemplo, el compuesto utilizado, el cultivo que deba protegerse, la maleza que deba combatirse, el grado de infestación, las condiciones climáticas, las características del suelo, el método de aplicación, etc.

Las dosis de compuesto comprendidas entre 1 g y 1.000 g por hectárea generalmente proporcionan un control suficiente.

Para la utilización en agricultura, con frecuencia resulta ventajoso utilizar composiciones con una actividad herbicida, que contengan, como sustancia activa, uno o más compuestos que presenten la fórmula (I), posiblemente también en forma de mezcla de isómeros.

Pueden utilizarse composiciones en forma de polvos secos, polvos húmedos, productos concentrados emulsionables, microemulsiones, pastas, granulados, soluciones, suspensiones, etc.: la selección del tipo de composición depende del uso específico.

Las composiciones se preparan según métodos conocidos, por ejemplo mediante dilución o disolución del ingrediente activo en un medio solvente y/o diluyente sólido, posiblemente en presencia de agentes activos en superficie.

Puede utilizarse caolín, alúmina, sílice, talco, bentonita, yeso, cuarzo, dolomita, atapulgita, montmorillonita, tierra diatomácea, celulosa, almidón, etc., a modo de diluyente o portador sólido inerte.

Puede utilizarse agua, o solventes orgánicos tales como hidrocarburos aromáticos (xiloles, mezclas de alquilbencenos, etc.), hidrocarburos alifáticos (hexano, ciclohexano, etc.), hidrocarburos aromáticos halogenados (clorobenceno, etc.), alcoholes (metanol, propanol, butanol, octanol, etc.), ésteres (acetato de isobutilo, etc.), cetonas (acetona, ciclohexanona, acetofenona, isoforona, etilamilcetona, etc.) o aceites vegetales o minerales o una mezcla de los mismos, etc., como diluyentes líquidos inertes.

Los agentes activos en superficie que pueden utilizarse son agentes humectantes y emulsionantes del tipo no iónico (alquilfenoles polietoxilados, alcoholes grasos polietoxilados, etc.), del tipo aniónico (sulfonatos de alquilbenceno, sulfonatos de alquilo, etc.), del tipo catiónico (sales cuaternarias de alquilamonio, etc.).

También pueden añadirse dispersantes (por ejemplo lignina y las sales de la misma, derivados de celulosa, alginatos, etc.), estabilizadores (por ejemplo antioxidantes, absorbentes de U.V., etc.).

Con el fin de ampliar el abanico de actividades de las composiciones anteriormente indicadas, resulta posible añadir otros ingredientes activos, tales como, por ejemplo, otros herbicidas, fungicidas, insecticidas, acaricidas, fertilizantes, etc.

Son ejemplos de otros herbicidas que pueden añadirse a las composiciones que contienen uno o más compuestos que presentan la fórmula general (I):

acetoclor, acifluorfén, aclonifén, AKH-7088, alaclor, aloxidim, ametrina, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidín, azimsulfurón, aziprotrín, BAY MKH 6561, beflubutámido, benazolín, benfluralín, benfuresato, bensulfurón, bensulida, bentazona, benzfendizona, benzobiciclón, benzofenap, benztiazurón, bifenox, bilanafos, bispiribac-sodio, bromacilo, bromobútido, bromofenoxim, bromoxinil, butaclor, butafenacil, butamifos, butenaclor, butralín, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona-etilo, clometoxifén, clorambén, clorbromurón, clorbufam, clorflurenol, cloridazón, clorimuron, clornitrofén, clorotolurón, cloroxurón, clorprofám, clorsulfurón, clortal, clortiamida, cinidon-etilo, cinmetilín, cinosulfurón, cletodim, clodinafop, clomazona, clomeprop, clopirálido, cloransulam-metilo, cumilurón (JC-940), ciaazina, cicloato, ciclosulfamurón, cicloxidim, cihalofop-butilo, 2,4-D, 2,4-DB, daimurón, dalapón, desmedifam, desmetrín, dicamba, diclobenil, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclosulam, dietatil, difenoxurón, difenzoquat, diflufenicán, diflufenzopir, dimefurón, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrín, dimetenamida, dinitramina, dinoseb, dinoseb acetato, dinoterb, difenamida, dipropetrín, diquat, ditiopir, 1-diurón, eglinazina, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralín, etametsulfurón-metilo, etidimurón, etiozina (SMY 1500), etofumesato, etoxifén-etilo (HC-252), etoxisulfurón, etobenzanida (HW 52), fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentrazamida, fenurón, flamprop, flamprop-M, flazasulfurón, florasulám, fluazifop, fluazifop-P, fluazolato (JV 485), flucarbazona-sodio, flucloralín, flufenacet, flufenpir-etilo, flumetsulám, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, flumipropín, fluometurón, fluoroglicofén, fluoronitrofén, flupoxam, flupropanato, flupirsulfurón, flurenol, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, flurtamina, flutiacet-metilo, fomesafén, foramsulfurón, fosamina, furiloxifén, glufosinato, glifosato, halosulfurón-metilo, haloxifop, haloxifop-P-metilo, hexazinona, imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquín, imazetapir, imazosulfurón, indanofán, yodosulfurón, ioxinil, isopropalín, isoproturón, isourón, isoxabén, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, KPP-421, lactofén, lenacilo, linurón, LS830556, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPS, mecoprop, mecoprop-P, mefenacet, metosulfurón, mesotrión, metamitrón, metazaclor, metabenztiazurón, metazol, metoprotrín, metildimrón, metobenzurón, metobromurón, metolaclor, S-metoclaclor, metosulám, metoxurón, metribuzín, metsulfurón, molinato, monálido, monolinurón, naproanilida, naproamida, napftalám, NC-330, neburón, nicosulfurón, nipiraclofén, norflurazón, orbencarb, orizalín, oxadiargilo, oxadiazón, oxasulfurón, oxaziclomefona, oxifluorfén, paraquat, pebulato, pendimetalín, penoxsulám, pentanoclor, pentoxazona, petoxamida, fenmedifám, piclorám, picolinafén, piperofos, pretilaclor, primisulfurón, prodiamina, profluazol, proglinazina, prometon, prometrín, propaclor, propanil, propaquizafop, propazina, profám, propisoclor, propizamida, prosulfocarb, prosulfurón, piraclonil, piraflufén-etilo, pirazoglilo (HSA-961), pirazolinato, pirazosulfurón, pirazoxifén, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftálido, piriminobac-metilo, piritiobac-sodio, quinclorac, quinmerac, quizalofop, quizalofop-P, rimsulfurón, setoxidim, sidurón, simazina, simetrín, sulcotrión, sulfentrazona, sulfometurón-metilo, sulfosulfurón, 2,3,6-TBA, TCA-sodio, tebutám, tebutiurón, tepraloxidim, terbacilo, terbumetón, terbutil-azina, terbutrín, tenilclor, tiazaflurón, tiazopir, tidiazimín, tifensulfurón-metilo, tiobencarb, tiocarbazilo, tioclorim, tralcoxidim, tri-alato, triasulfurón, triaziflam, tribenurón, triclopir, trietazina, trifloxisulfurón, trifluralín, triflusulfurón-metilo, tritosulfurón, UBI-C4874, vernolato.

La concentración de sustancia activa en las composiciones anteriormente indicadas puede variar dentro de un intervalo amplio, dependiendo de la sustancia activa, las aplicaciones a las que se encuentre destinado, las condiciones ambientales y el tipo de formulación utilizado. En general, la concentración de sustancia activa preferentemente se encuentra comprendida entre 1% y 90%.

A continuación, se proporcionan algunos ejemplos ilustrativos y no limitativos de la presente invención.

Ejemplo 1

Preparación de 3-{5-[(5-terc-butil-1,3,4-oxadiazol-2-il)metoxi]-4-cloro-2-fluorofenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (compuesto nº 1)

Se añadió 2-terc-butil-5-(clorometil)-1,3,4-oxadiazol (0,22 g) a una mezcla de 3-(4-cloro-2-fluoro-5-hidroxifenil)-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (0,40 g) y carbonato potásico (0,25 g) en dimetilformamida (5 ml). La mezcla de reacción se calentó a 60ºC durante 5 horas.

Al final de la reacción, la mezcla se vertió en agua (50 ml) y se extrajo con acetato de etilo (2x30 ml); la fase orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato sódico y se concentró al vacío. Se purificó el residuo mediante cromatografía en una columna de gel de sílice, eluyendo con n-hexano/acetato de etilo 8:2. Se obtuvieron 0,24 g de producto en forma de un aceite incoloro.

RMN-^{1}H ($CDCl_3$): δ a 1,41 (s, 9H, $C(CH_3)_3$), 3,53 (bs, 3H, NCH_3), 5,25 (s, 2H, OCH_2), 6,33 (s, 1H, CH uracilo), 7,1 (d, 1H, aromático), 7,3 (d, 1H, aromático).

Ejemplo 2

Se prepararon los compuestos siguientes (identificados mediante análisis elemental de RMN ^{1}H y ^{19}F) siguiendo procedimientos adecuados, tal como se describe en el ejemplo 1 anterior:

- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (compuesto nº 2),

- 3-{2,4-dicloro-5-[(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (compuesto nº 3), p.f.: 167ºC,

- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (compuesto nº 4), p.f.: 60ºC,

- 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(1,2,4-oxadiazol-3-ilmetoxi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (compuesto nº 5), p.f.: 122ºC,

- 3-[4-cloro-3-(1,2,4-oxadiazol-3-ilmetoxi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona (compuesto nº 6).

Ejemplo 3

Determinación de la actividad herbicida y de la fitotoxicidad en la preemergencia

Se evaluó la actividad herbicida de los compuestos de la invención en la preemergencia siguiendo los procedimientos operativos siguientes.

Se sembraron las especies vegetales de interés (malezas o cultivos) en macetas con un diámetro superior de 10 cm, una altura de 10 cm y que contenían tierra arenosa. Se utilizaron 10 macetas para cada especie vegetal.

Se añadió agua a cada maceta y cantidad suficiente para que germinasen las semillas. Se dividieron las macetas en dos grupos, conteniendo cada uno 5 macetas para cada maleza o cultivo.

Un día después de la siembra, se trató el primer conjunto de macetas con una dispersión hidroacetónica que contenía acetona al 10% en volumen, el producto bajo evaluación a la concentración deseada y Tween-20 al 0,5%.

El segundo conjunto se trató con una solución hidroacetónica únicamente, que contenía acetona al 10% en volumen y Tween-20 al 0,5%, y se utilizó a título comparativo (blanco).

Todas las macetas se mantuvieron bajo observación en un ambiente acondicionado, bajo las condiciones siguientes:

- temperatura: 24ºC,

- humedad relativa: 60%,

- fotoperiodo: 16 horas,

- intensidad lumínica: 10.000 lux.

Se regaron uniformemente las macetas con el fin de garantizar un grado de humedad suficiente para un buen desarrollo de las plantas.

Quince días después del tratamiento, se evaluó la actividad herbicida basándose en los valores siguientes, referidos al porcentaje de daños evaluados en las plantas tratadas, con respecto a las plantas no tratadas (blancos):

- 0 = 0% a 10% de daños,

- 1 = 11% a 30% de daños,

- 2 = 31% a 50% de daños,

- 3 = 51% a 70% de daños,

- 4 = 71% a 90% de daños,

- 5 = 91% de daños - muerte de la planta.

La Tabla 1 muestra los resultados obtenidos mediante tratamiento de las especies vegetales listadas posteriormente, con los compuestos 2, 6 y 13 con una dosis de 15 g/ha:

Abutilon theofrasti (AT), *Amaranthus retroflexus* (AR), *Chenopodium album* (CA), *Convolvulus sepium* (CS), *Galium aparine* (GA), *Ipomea purpurea* (IP), *Portulaca oleracea* (PO), *Solanum nigrum* (SN), *Sida spinosa* (SS).

Tabla 1: actividad herbicida en la preemergencia con una dosis de 15 g/ha

Especie vegetal	AT	AR	CA	CS	GA	IP	PO	SN	SS
Compuesto nº 1	5	4	5	-	5	4	5	5	5

Ejemplo 4

Determinación de la actividad herbicida y de la fitotoxicidad en la postemergencia

Se evaluó la actividad herbicida de los compuestos de la invención en la postemergencia siguiendo los procedimientos operativos siguientes.

Se sembraron las especies vegetales de interés (malezas o cultivos) en macetas con un diámetro superior de 10 cm, una altura de 10 cm y que contenían tierra arenosa. Se utilizaron 10 macetas para cada especie vegetal.

Se añadió agua a cada maceta en cantidad suficiente para que germinasen las semillas. Se dividieron las macetas en dos grupos, conteniendo cada uno 5 macetas para cada maleza o cultivo.

Quince días después de la siembra (diez en el caso del trigo), cuando las malezas y cultivos, según la especie, presentaban una altura de entre 10 y 15 cm, se trató el primer conjunto de macetas con una dispersión hidroacetónica que contenía acetona al 10% en volumen, el producto bajo evaluación a la concentración deseada y Tween-20 al 0,5%.

Se trató el segundo conjunto con sólo solución hidroacetónica, que contenía acetona al 10% en volumen y Tween-20 al 0,5%, y se utilizó a título comparativo (blanco).

Todas las macetas se mantuvieron bajo observación en un ambiente acondicionado en las condiciones siguientes:

- temperatura: 24ºC,
- humedad relativa: 60%,
- fotoperiodo: 16 horas,
- intensidad lumínica: 10.000 lux.

Se regaron uniformemente las macetas cada dos días de manera que se garantizase un grado de humedad suficiente para un buen desarrollo de las plantas.

Se evaluó la actividad herbicida quince días después del tratamiento basándose en los valores siguientes, referidos al porcentaje de daños evaluado en las plantas tratadas con respecto a las plantas no tratadas (blancos):

- 0 = 0% a 10% de daños,
- 1 = 11% a 30% de daños,
- 2 = 31% a 50% de daños,
- 3 = 51% a 70% de daños,
- 4 = 71% a 90% de daños,
- 5 = 91% de daños - muerte de la planta.

La Tabla 2 muestra los resultados obtenidos mediante tratamiento de las especies vegetales listadas posteriormente, con los compuestos 2, 6 y 13 con una dosis de 15 g/ha:

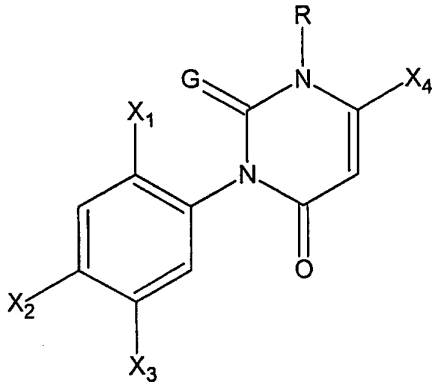
Abutilon theofrasti (AT), *Amaranthus retroflexus* (AR), *Chenopodium album* (CA), *Convolvulus sepium* (CS), *Galium aparine* (GA), *Ipomea purpurea* (IP), *Portulaca oleracea* (PO), *Solanum nigrum* (SN), *Sida spinosa* (SS).

Tabla 2: actividad herbicida en la postemergencia con una dosis de 15 g/ha

Especie vegetal	AT	AR	CA	CS	GA	IP	PO	SN	SS
Compuesto nº 1	5	3	4	-	-	5	4	5	4

REIVINDICACIONES

1. Uracilos que presentan la fórmula general (I):



en la que:

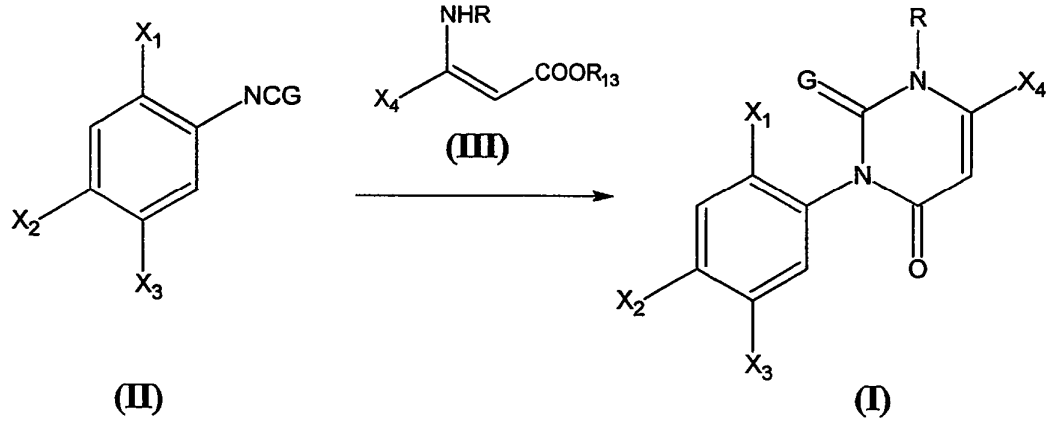
- X_1 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno,
- X_2 representa un átomo de halógeno,
- X_4 representa un grupo haloalquilo C_1-C_3,
- R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_3 o un grupo haloalquilo C_1-C_3,
- G representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,
- X_3 representa un grupo $Q(CR_1R_2)_nZ$-,
- Z representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,
- R_1, R_2, iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_4 o un grupo haloalquilo C_1-C_4,
- n representa 1, 2 ó 3,
- Q representa un grupo heterocíclico seleccionado de entre 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, encontrándose dichos grupos, a su vez, opcionalmente sustituidos con átomos de halógeno seleccionados de entre cloro, flúor, bromo o yodo, o sustituidos con grupos seleccionados de entre alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6, alquenilo C_2-C_6 o haloalquenilo C_2-C_6, alqueniloxi C_2-C_6 o haloalqueniloxi C_2-C_6, alquinilo C_2-C_6 o haloalquinilo C_2-C_6, alquiniloxi C_2-C_6 o haloalquiniloxi C_2-C_6, alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6, alcoxialquilo C_2-C_6 o haloalcoxialquilo C_2-C_6, alcoxialcoxi C_2-C_6, haloalcoxialcoxi C_2-C_6, haloalcoxihaloalcoxi C_2-C_6, alcoxialcoxialquilo C_3-C_8, alcoxialcoxialcoxi C_3-C_8, alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6, alquiltioalquilo C_2-C_6, alquilsulfínico C_1-C_6 o haloalquilsulfínico C_1-C_6, alquilsuflónico C_1-C_6 o haloalquilsulfónico C_1-C_6, alcoxicarbonilo C_2-C_6 o haloalcoxicarbonilo C_2-C_6, alqueniloxicarbonilo C_3-C_7 o alquiniloxicarbonilo C_3-C_7, alcoxicarbonilalquilo C_3-C_8 o haloalcoxicarbonilalquilo C_3-C_8, alqueniloxicarbonilalquilo C_4-C_9 o alquiniloxicarbonilalquilo C_4-C_9, alcoxicarbonilalcoxi C_3-C_8, alqueniloxicarbonilalcoxi C_4-C_9 o alquiniloxicarbonilalcoxi C_4-C_9, aminocarbonilalcoxi C_3-C_8 posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4 o con un grupo alquileno C_2-C_5, CN, CHO, NO_2, NH_2, OH, cianoalquilo C_1-C_3, cianoalquiloxi C_1-C_3, formilalquilo C_2-C_6, alquilcarbonilo C_2-C_6, haloalquilcarbonilo C_2-C_6, alquilcarbonilalquilo C_3-C_7, alcoxiimino C_2-C_6, haloalcoxiimino C_2-C_6, alcoxiiminoalquilo C_3-C_6, haloalcoxiiminoalquilo C_3-C_6, alcoxiiminohaloalquilo C_3-C_6, aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo C_2-C_6, aminosulfonilo o aminosulfonilalquilo C_2-C_6, posiblemente sustituyendo dichos cuatro últimos grupos con uno o dos grupos alquilo C_1-C_4 o con un grupo alquileno C_2-C_5, alquilsulfonilamino C_1-C_6, alquilcarbonilamino C_2-C_7 o alcoxicarbonilamino C_2-C_7, posiblemente sustituyendo dichos tres últimos grupos con grupos alquilo C_1-C_4, arilo C_6-C_{10}, arilalquilo C_6-C_{12}, arilalcoxi C_6-C_{10}, ariloxialquilo C_7-C_{12}, arilalquiloxialquilo C_8-C_{12}, posiblemente sustsituyendo dichos grupos, a su vez, con átomos de halógeno, grupos alquilo C_1-C_4, grupos haloalquilo C_1-C_3, CN, cicloalquilo C_3-C_7, cicloalquilalquilo C_6-C_{12}, cicloalquilalcoxi C_6-C_{10}, grupos tetrahidropirán-2-ilo posiblemente sustituidos, a su vez, con átomos de halógeno, grupos alquilo C_1-C_4 o grupos alcoxi C_1-C_4.

2. Uracilos según la reivindicación 1, caracterizados porque se seleccionan de entre:

- 3-{5-[(5-terc-butil-1,3,4-oxadiazol-2-il)metoxi]-4-cloro-2-fluorofenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H) pirimidindiona,
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-{2,4-dicloro-5-[(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-{4-cloro-2-fluoro-5-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metoxi]fenil}-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-[4-cloro-2-fluoro-5-(1,2,4-oxadiazol-3-ilmetoxi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona,
- 3-[4-cloro-3-(1,2,4-oxadiazol-3-ilmetoxi)fenil]-1-metil-6-(trifluorometil)-2,4(1H,3H)-pirimidindiona.

3. Procedimiento para la preparación de compuestos que presentan la fórmula general (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizado porque incluye una reacción de ciclocondensación de un isocianato o isotiocianato que presenta la fórmula general (II) con un 3-aminocrotonato que presenta la fórmula general (III) según el esquema de reacción 1:

Esquema 1:



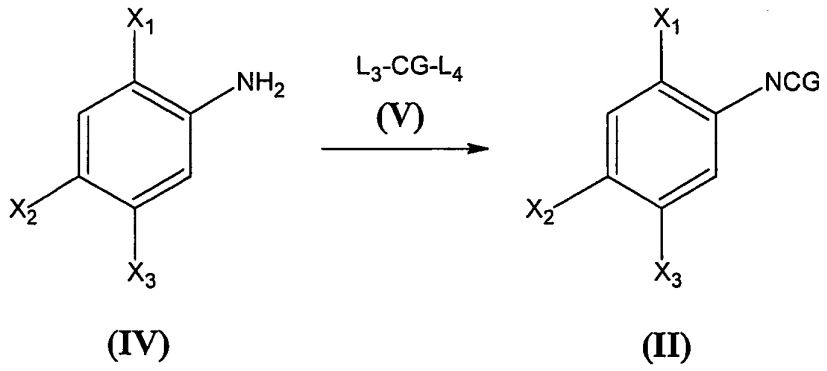
en el que:

- X_1, X_2, X_3, X_4, R y G presentan los significados definidos anteriormente,
- R_{13} representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4.

4. Procedimiento según la reivindicación 3, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte y en presencia de una base orgánica o preferentemente una base inorgánica, a una temperatura comprendida entre -20ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción.

5. Procedimiento según la reivindicación 3, caracterizado porque los isocianatos o isotiocianatos que presentan la fórmula general (II) se preparan partiendo de una anilina sustituida que presenta la fórmula general (IV) mediante reacción con un compuesto que presenta la fórmula general (V), tal como fosgeno, difosgeno, trifosgeno o tiofosgeno, según el esquema de reacción 2.

Esquema 2:



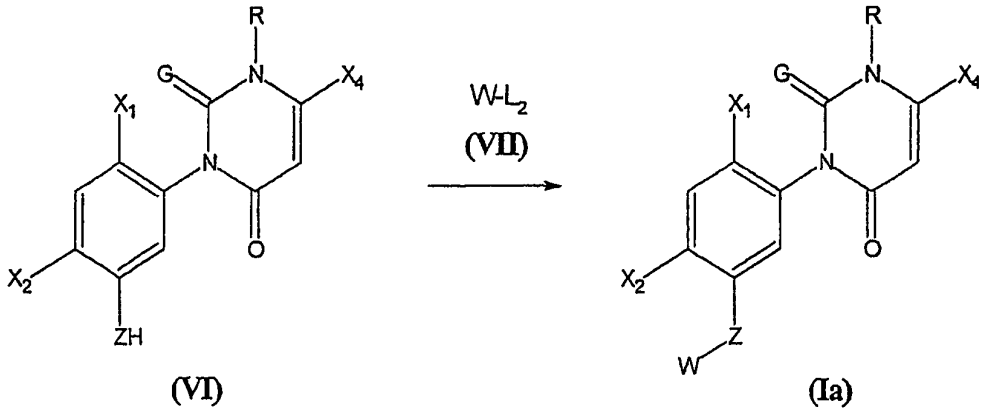
en el que:

- X_1, X_2, X_3 y G presentan los significados definidos anteriormente;
- L_3 y L_4, iguales o diferentes, representan un átomo de cloro o un grupo CCl_3O-.

6. Procedimiento según la reivindicación 5, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte, a una temperatura comprendida entre 0ºC y el punto de ebullición de la mezcla misma, posiblemente en presencia de un catalizador tal como trietilamina, en una cantidad comprendida entre 0,001% y 100% en peso con respecto a la anilina (IV), con una cantidad de reactivo (V) que varía entre 1 y 3 moles por cada mol de anilina (IV).

7. Procedimiento para la preparación de compuestos que presentan la fórmula general (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, representando X_3 un grupo $Q(CR_1R_2)Z$-, compuestos (Ia), caracterizado porque comprende la reacción de un uracilo que presenta la fórmula general (VI) con un compuesto que presenta la fórmula general (VII) según el esquema de reacción 3.

Esquema 3:



en el que:

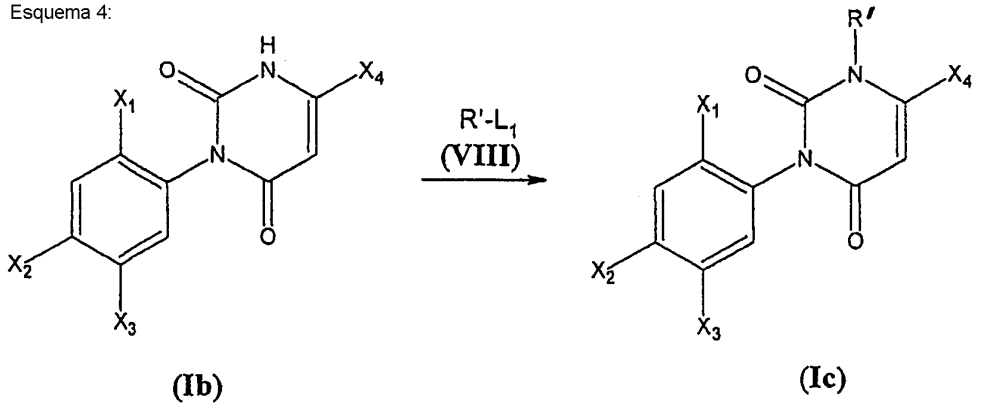
- X_1, X_2, X_4, G y Z presentan los significados definidos anteriormente,
- R representa un grupo alquilo C_1-C_3 o un grupo haloalquilo C_1-C_3,
- W representa un grupo $Q(CR_1R_2)_n$-, en el que R_1, R_2 presentan los significados definidos anteriormente,

- L_2 representa un átomo de halógeno, un grupo R_LSO_2O-, en el que R_L representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4, o representa un grupo $R_{L1}SO_2$- en el que R_{L1} representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4.

8. Procedimiento según la reivindicación 7, caracterizado porque la reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (VI) y los compuestos que presentan la fórmula general (VII) se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes y en presencia de una base, preferentemente una base inorgánica, a una temperatura comprendida entre -10ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción.

9. Procedimiento para la preparación de los compuestos que presentan la fórmula general (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que G=O y R≠H, compuestos (Ic), caracterizado porque comprende la reacción de un uracilo que presenta la fórmula general (Ib) con un compuesto alquilante que presenta la fórmula general (VIII) según el esquema de reacción 4:

Esquema 4:



en el que:

- X_1, X_2, X_3 y X_4 presentan los significados definidos anteriormente;

- R' representa un grupo alquilo C_1-C_3 o un grupo haloalquilo C_1-C_3;

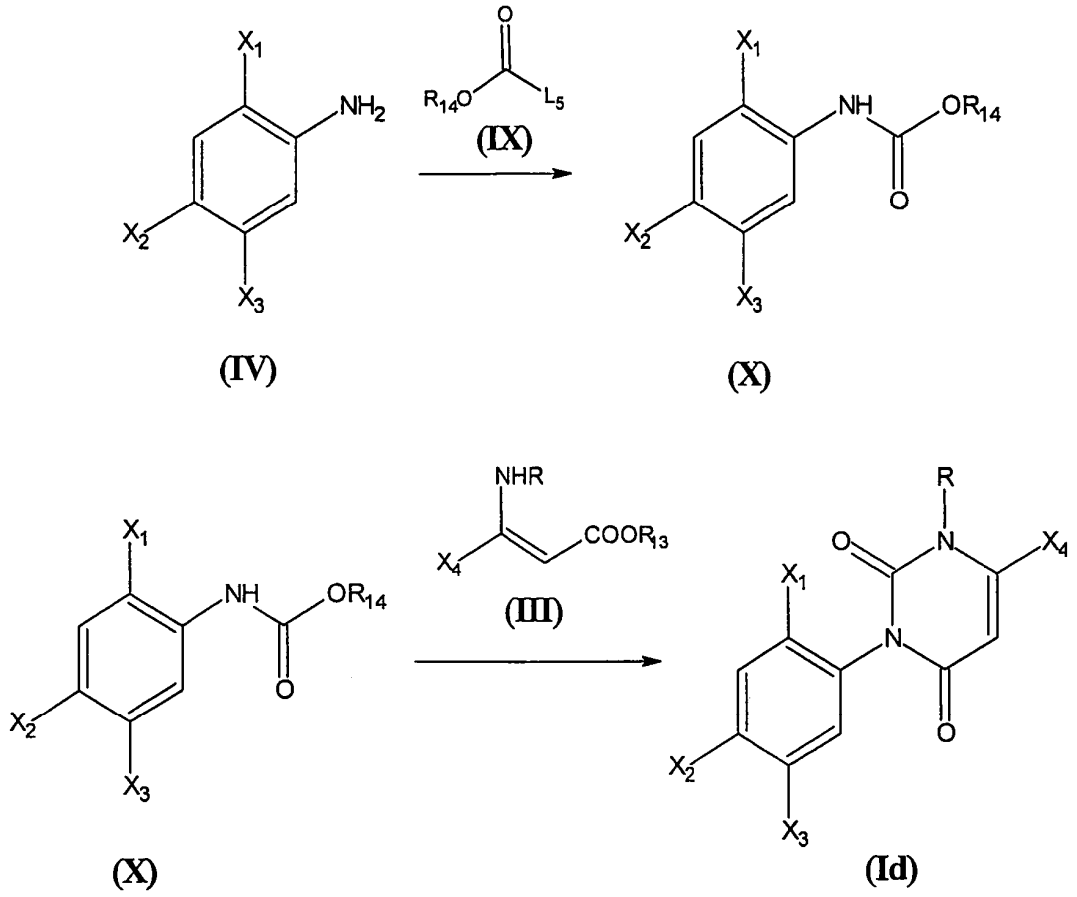
- L_1 representa un átomo de halógeno, o un grupo R_LSO_2O-, en el que R_L representa un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4.

10. Procedimiento según la reivindicación 9, caracterizado porque la reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (Ib) y el compuesto que presenta la fórmula general (VIII) se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes y en presencia de una base, preferentemente una base inorgánica, a una temperatura comprendida entre -10ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción.

11. Procedimiento según la reivindicación 7 ó 9, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en un sistema bifásico utilizando agua como solvente y un solvente orgánico inmiscible con agua, en presencia de catalizadores de transferencia de fase.

12. Procedimiento para la preparación de compuestos que presentan la fórmula general (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en la que G=O, compuestos (Id), caracterizado porque comprende una primera reacción entre una anilina sustituida que presenta la fórmula (IV) y un cloroformato o un carbonato que presenta la fórmula (IX), proporcionando un carbamato que presenta la fórmula (X) y una segunda reacción en la que el carbamato se convierte en compuestos que presentan la fórmula general (Id) mediante ciclocondensación con un 3-aminocrotonato que presenta la fórmula general (III), según el esquema de reacción 5.

Esquema 5:



en el que:

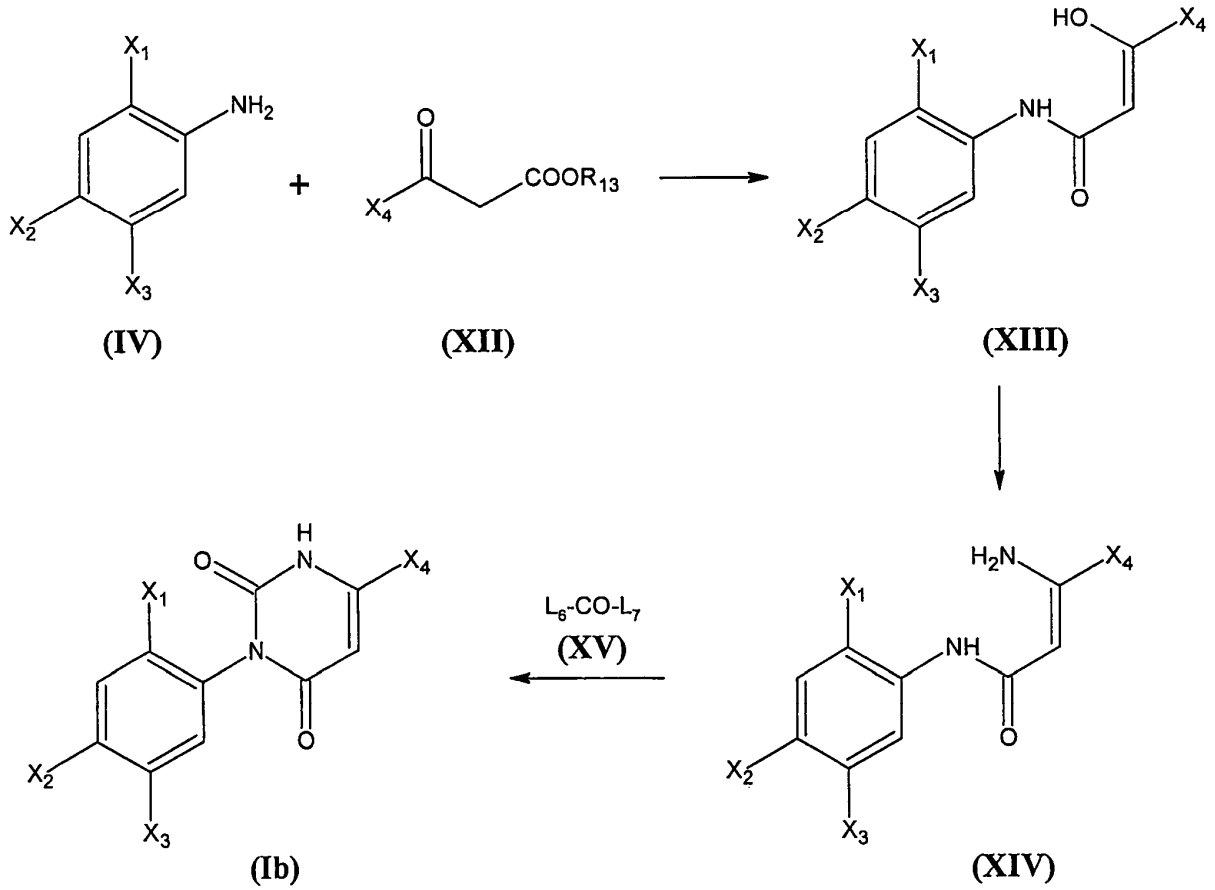
- X_1, X_2, X_3, X_4 y R presentan los significados definidos anteriormente,
- L_5 representa un átomo de halógeno o un grupo OR_{14},
- R_{13} y R_{14} representan un grupo alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4.

13. Procedimiento según la reivindicación 12, caracterizado porque la primera reacción se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte, a una temperatura comprendida entre -10ºC y el punto de ebullición de la mezcla misma, en presencia de una base orgánica o inorgánica, en una cantidad que varía entre 1 y 1,5 moles por cada mol de anilina (IV), con una cantidad de compuesto que presenta la fórmula (IX) que varía entre 1 y 1,5 moles por cada mol de anilina (IV).

14. Procedimiento según la reivindicación 12, caracterizado porque la reacción de ciclocondensación del carbamato que presenta la fórmula general (X) con el 3-aminocrotonato que presenta la fórmula general (III) se lleva a cabo en presencia de un solvente orgánico inerte y en presencia de una base orgánica o preferentemente inorgánica, a una temperatura comprendida entre -20ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción.

15. Procedimiento según la reivindicación 9, caracterizado porque los compuestos que presentan la fórmula general (Ib) se preparan partiendo de una anilina que presenta la fórmula general (IV) mediante la reacción con un β-cetoéster que presenta la fórmula general (XII), proporcionando una anilida que presenta la fórmula general (XIII), posteriormente se convierte en el intermediario de fórmula general (XIV) mediante aminación con amonio o sales amónicas, convirtiendo dicho intermediario en los compuestos de fórmula general (Ib) mediante ciclización con un compuesto de fórmula general (XV), tal como fosgeno, o difosgeno, según el esquema de reacción 6:

Esquema 6:



en la que:

- X_1, X_2, X_3 y X_4 presentan los significados definidos anteriormente;
- R_{13} representa un grupo alquilo o haloalquilo C_1-C_4, o un grupo fenilo posiblemente sustituido con grupos alquilo C_1-C_4;
- L_6 y L_7, que presentan el mismo significado o significados diferentes, representan un átomo de cloro, un grupo CCl_3O-, un grupo alcoxi C_1-C_4, un grupo fenoxi, un grupo imidazol-1-ilo o un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo.

16. Procedimiento según la reivindicación 15, caracterizado porque la reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (IV) y los compuestos que presentan la fórmula general (XII) se llevan a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes, a una temperatura comprendida entre -10ºC y el punto de ebullición de la mezcla de reacción, utilizando una cantidad de compuesto (XII) comprendida entre 1 y 3 moles por cada mol de anilina (IV).

17. Procedimiento según la reivindicación 16, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo durante la eliminación mediante destilación del compuesto $R_{13}OH$ formado durante la reacción, solo o mezclado con el solvente utilizado.

18. Procedimiento según la reivindicación 15, caracterizado porque la transformación de compuestos que presentan la fórmula general (XIII) en compuestos que presentan la fórmula general (XIV) se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes, a una temperatura comprendida entre -10ºC y la temperatura de ebullición de la mezcla de reacción, utilizando amonio o una sal amónica, en una cantidad comprendida entre 1 y 20 moles por cada mol de compuesto (XIII).

19. Procedimiento según la reivindicación 15, caracterizado porque la reacción entre los compuestos que presentan la fórmula general (XIV) y los compuestos que presentan la fórmula general (XV) se lleva a cabo en presencia de uno o más solventes orgánicos inertes, a una temperatura comprendida entre -10ºC y la temperatura de ebullición de la mezcla de reacción, utilizando una cantidad de compuesto (XV) comprendida entre 1 y 5 moles por cada mol de compuesto (XIV) en presencia de una base orgánica o inorgánica adecuada, en una cantidad comprendida entre 1 y 5 moles por cada mol de compuesto (XIV).

20. Utilización de uracilos que presentan la fórmula general (I) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, a modo de herbicidas.

21. Utilización según la reivindicación 20 para el control preemergencia y/o postemergencia de malezas monocotiledóneas o dicotiledóneas.

22. Método para el control de malezas en zonas cultivadas mediante la aplicación de los compuestos que presentan la fórmula general (I) según las reivindicaciones 1 a 2.

23. Método según la reivindicación 22, caracterizado porque la cantidad de compuesto que presenta la fórmula (I) que debe aplicarse varía entre dosis de compuestos comprendidas entre 1 y 1.000 gramos por hectárea.

24. Composiciones herbicidas que contienen, a modo de principio activo, uno o más compuestos que presentan la fórmula general (I) según las reivindicaciones 1 a 2, posiblemente también en forma de mezcla de isómeros.

25. Composiciones herbicidas según la reivindicación 24, que comprenden otros principios activos que son compatibles con los compuestos que presentan la fórmula general (I), tales como otros herbicidas, fungicidas, insecticidas, acaricidas, fertilizantes, etc.

26. Composiciones herbicidas según la reivindicación 24, caracterizadas porque los herbicidas adicionales se seleccionan de entre:

acetoclor, acifluorfén, aclonifén, AKH-7088, alaclor, aloxidim, ametrina, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidín, azimsulfurón, aziprotrín, BAY MKH 6561, beflubutámido, benazolín, benfluralín, benfuresato, bensulfurón, bensulida, bentazona, benzfendizona, benzobiciclón, benzofenap, benztiazurón, bifenox, bilanafos, bispiribac-sodio, bromacilo, bromobútido, bromofenoxim, bromoxinil, butaclor, butafenacil, butamifos, butenaclor, butralín, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona-etilo, clometoxifén, clorambén, clorbromurón, clorbufam, clorflurenol, cloridazón, clorimuron, clornitrofén, clorotolurón, cloroxurón, clorprofám, clorsulfurón, clortal, clortiamida, cinidon-etilo, cinmetilín, cinosulfurón, cletodim, clodinafop, clomazona, clomeprop, clopirálido, cloransulam-metilo, cumilurón (JC-940), ciaazina, cicloato, ciclosulfamurón, cicloxidim, cihalofop-butilo, 2,4-D, 2,4-DB, daimurón, dalapón, desmedifam, desmetrín, dicamba, diclobenil, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclosulam, dietatil, difenoxurón, difenzoquat, diflufenicán, diflufenzopir, dimefurón, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrín, dimetenamida, dinitramina, dinoseb, dinoseb acetato, dinoterb, difenamida, dipropetrín, diquat, ditiopir, 1-diurón, eglinazina, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralín, etametsulfurón-metilo, etidimurón, etiozina (SMY 1500), etofumesato, etoxifén-etilo (HC-252), etoxisulfurón, etobenzanida (HW 52), fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentrazamida, fenurón, flamprop, flamprop-M, flazasulfurón, florasulám, fluazifop, fluazifop-P, fluazolato (JV 485), flucarbazona-sodio, flucloralín, flufenacet, flufenpir-etilo, flumetsulám, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, flumipropín, fluometurón, fluoroglicofén, fluoronitrofén, flupoxam, flupropanato, flupirsulfurón, flurenol, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, flurtamina, flutiacet-metilo, fomesafén, foramsulfurón, fosamina, furiloxifén, glufosinato, glifosato, halosulfurón-metilo, haloxifop, haloxifop-P-metilo, hexazinona, imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquín, imazetapir, imazosulfurón, indanofán, yodosulfurón, ioxinil, isopropalín, isoproturón, isourón, isoxabén, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, KPP-421, lactofén, lenacilo, linurón, LS830556, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPS, mecoprop, mecoprop-P, mefenacet, metosulfurón, mesotrión, metamitrón, metazaclor, metabenztiazurón, metazol, metoprotrín, metildimrón, metobenzurón, metobromurón, metolaclor, S-metoclaclor, metosulám, metoxurón, metribuzín, metsulfurón, molinato, monálido, monolinurón, naproanilida, naproamida, napftalám, NC-330, neburón, nicosulfurón, nipiraclofén, norflurazón, orbencarb, orizalín, oxadiargilo, oxadiazón, oxasulfurón, oxaziclomefona, oxifluorfén, paraquat, pebulato, pendimetalín, penoxsulám, pentanoclor, pentoxazona, petoxamida, fenmedifám, piclorám, picolinafén, piperofos, pretilaclor, primisulfurón, prodiamina, profluazol, proglinazina, prometon, prometrín, propaclor, propanil, propaquizafop, propazina, profám, propisoclor, propizamida, prosulfocarb, prosulfurón, piraclonil, piraflufén-etilo, pirazoglilo (HSA-961), pirazolinato, pirazosulfurón, pirazoxifén, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftálido, piriminobac-metilo,

piritiobac-sodio, quinclorac, quinmerac, quizalofop, quizalofop-P, rimsulfurón, setoxidim, sidurón, simazina, simetrín, sulcotrión, sulfentrazona, sulfometurón-metilo, sulfosulfurón, 2,3,6-TBA, TCA-sodio, tebutám, tebutiurón, tepraloxidim, terbacilo, terbumetón, terbutil-azina, terbutrín, tenilclor, tiazaflurón, tiazopir, tidiazimín, tifensulfurón-metilo, tiobencarb, tiocarbazilo, tioclorim, tralcoxidim, tri-alato, triasulfurón, triaziflam, tribenurón, triclopir, trietazina, trifloxisulfurón, trifluralín, triflusulfurón-metilo, tritosulfurón, UBI-C4874, vernolato.

27. Composiciones según cualquiera de las reivindicaciones 24 a 26, caracterizadas porque la concentración de la sustancia activa se encuentra comprendida entre 1% y 90%.