

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 401 924**

51 Int. Cl.:

C07D 231/20 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.11.2007 E 07831969 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.03.2013 EP 2084136**

54 Título: **Compuestos de benzoilpirazol, procedimiento para su producción y herbicidas que los contienen**

30 Prioridad:

28.11.2006 JP 2006319579

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

25.04.2013

73 Titular/es:

**ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (100.0%)
3-15, EDOBORI 1-CHOME, NISHI-KU
OSAKA-SHI OSAKA 550-0002, JP**

72 Inventor/es:

**KOMYOJI, TERUMASA;
TSUKAMOTO, MASAMITSU;
KIKUGAWA, HIROSHI y
HATA, HIROSHI**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 401 924 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

Compuestos de benzoilpirazol, procedimiento para su producción y herbicidas que los contienen

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a compuestos de benzoilpirazol novedosos útiles como ingredientes activos de herbicidas.

10 **Técnica anterior**

En el documento EP 0352543A y el documento EP 0282944A se describen compuestos de benzoilpirazol. Sin embargo, no se describen allí específicamente compuestos de benzoilpirazol representados por la siguiente fórmula (I).

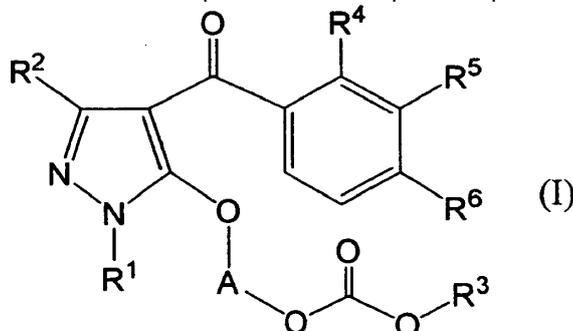
15 **Descripción de la invención****Objeto que se va a lograr mediante la invención**

20 Hata ahora, se han deseado herbicidas que tengan actividades herbicidas excelentes contra malas hierbas y que sean seguros para las plantas de cultivo, para el ahorro de trabajo en la operación de control de las malas hierbas y para la mejora de la productividad de las plantas agrícolas y hortícolas. En el desarrollo de nuevos herbicidas en el futuro, se desea desarrollar compuestos capaces de exhibir las actividades herbicidas deseadas a la vez que se controla que sus dosificaciones sean bajas. Adicionalmente, se desea desarrollar compuestos que no permanezcan en el suelo más de lo necesario a la vez que exhiben una eficacia residual práctica. Adicionalmente, se desea desarrollar compuestos que sean altamente seguros para los animales. Sin embargo, la búsqueda de compuestos novedosos adecuados para tal objeto depende del procedimiento de prueba-error.

30 **Medios para lograr el objeto**

Los autores de la presente invención han llevado a cabo estudios exhaustivos sobre compuestos de benzoilpirazol con el fin de encontrar mejores herbicidas que logren en objeto anterior y como resultado, completaron la presente invención.

35 A saber, la presente invención se refiere a un compuesto de benzoilpirazol representado por la fórmula (I) o su sal:



40 en donde R¹ es alquilo, R² es un átomo de hidrógeno o alquilo, R³ es alquilo, R⁴ es alquilo o halógeno, R⁵ es alquilo sustituido con un Y¹, haloalcoxi, alcoxi sustituido con un Y², o alcoxicarbonilo, R⁶ es alquilsulfonilo, A es alquileno sustituido al menos con un alquilo, Y¹ es alcoxi o haloalcoxi, e Y² es alcoxi; un procedimiento para producirlo; un herbicida que lo contenga como ingrediente activo; y un método para controlar plantas no deseadas o inhibir su crecimiento, que comprende aplicar una cantidad eficaz como herbicida del mismo a las plantas no deseadas o a un lugar en el que crecen.

45 Los compuestos representados por la fórmula (I) producen una mejora notable en las actividades herbicidas contra las malas hierbas en comparación con compuestos convencionales de tipos similares y tienen una alta seguridad para las plantas de cultivo.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

50 En la fórmula anterior (I), el alquilo o radical alquilo puede ser lineal o ramificado, y sus ejemplos específicos incluyen alquilo C₁-C₉ tales como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, iso-pentilo, neopentilo, tert-pentilo, n-hexilo, isohexilo, n-heptilo, n-octilo y n-nonilo.

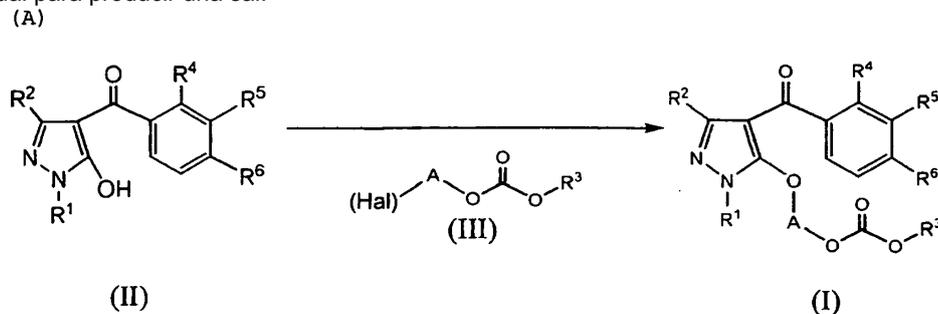
En la fórmula anterior (I), el halógeno o halógenos como sustituyente puede ser un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo. El número de halógenos como sustituyentes puede ser uno o más, y si fueran más, pueden ser iguales o diferentes. Adicionalmente, las posiciones para la sustitución de tales halógenos pueden ser posiciones cualesquiera.

En la fórmula anterior (I), el radical alquileo puede ser un alquileo C₁-C₉ tal como metileno, etileno, trimetileno, tetrametileno, pentametileno, hexametileno, heptametileno, octametileno o nonametileno.

La sal del compuesto de benzoilpirazol representado por la anterior fórmula (I) incluye todas las clases de sales con la que sean aceptables desde el punto de vista agrícola. Sus ejemplos incluyen sales de metales alcalinos tales como una sal de sodio y una sal de potasio; sales de metales alcalinotérreos tales como una sal de magnesio y una sal de calcio; sales de aminas tales como una sal de dimetilamina y una sal de trietilamina; sales de ácidos inorgánicos tales como un hidrocloreto, un perclorato, un sulfato y un nitrato; y sales de ácidos orgánicos tales como un acetato y un metanosulfonato.

Para los compuestos de benzoilpirazol representados por la anterior fórmula (I), pueden estar presentes a veces isómeros ópticos, y la presente invención incluye todos estos isómeros. En esta memoria, el compuesto se describe como una mezcla de isómeros, a no ser que se especifique lo contrario.

El compuesto de benzoilpirazol representado por la anterior fórmula (I) o su sal (referido más adelante simplemente como el compuesto de la presente invención) se puede producir mediante la siguiente reacción (A) y de acuerdo con un método usual para producir una sal.



en donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y A se definen como antes, y Hal es halógeno.

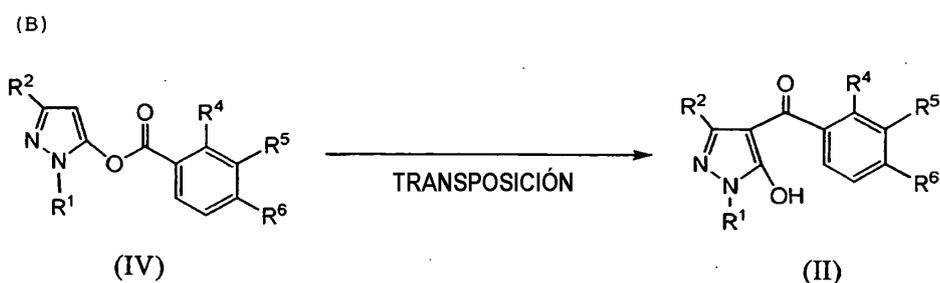
La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción. Puede ser, por ejemplo, una cetona tal como acetona, etil metil cetona o dietil cetona; un hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno, cloroformo, dicloroetano o tricloroetano; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno, xileno, o nitrobenzono; un éster tal como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; un disolvente polar aprótico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida (DMF), dimetilsulfóxido (DMSO), dimetilacetamida (DMA), triamida de ácido hexametilfosfórico (HMPA) o sulfolano; o un éter tal como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano (THF) o dimetoxietano. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. La base puede ser una base inorgánica o una base orgánica. La base orgánica puede ser, por ejemplo, una amina terciaria tal como trietilamina o diisopropiletilamina; piridina, 4-(dimetilamino)piridina, o 2,6-lutidina. La base inorgánica puede ser, por ejemplo, un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio; un carbonato de metal alcalinotérreo tal como carbonato de calcio o carbonato de bario; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; o un cianuro de metal alcalino tal como cianuro de sodio o cianuro de potasio. Con respecto a tales bases, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos y mezclar para su uso, en una cantidad de 0,01 a 100 equivalentes con respecto al compuesto de fórmula (II).

La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un catalizador. El catalizador puede ser, por ejemplo, bromuro de n-butilamonio, cloruro de n-butilamonio, bromuro de tetra-n-butilfosfonio, yoduro de sodio o yoduro de potasio.

La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

El compuesto representado por la anterior fórmula (II) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (B).



en donde R^1 , R^2 , R^4 , R^5 y R^6 se definen como antes.

- 5 A saber, el compuesto representado por la fórmula (II) se puede producir sometiendo un compuesto representado por la fórmula (IV) a una reacción de transposición.

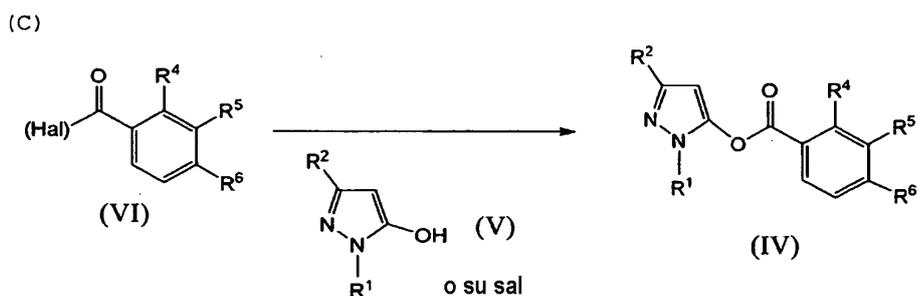
10 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción. Puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno, cloroformo, dicloroetano o tricloroetano; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno, xileno o nitrobenzono; un éster tal como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; un disolvente polar aprótico tal como acetonitrilo, DMF, DMSO, DMA, HMPA o sulfolano; o un éter tal como éter dietílico, dioxano, THF o dimetoxietano. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

15 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. La base puede ser una base orgánica o una base inorgánica, y se pueden mencionar aquellas ejemplificadas en la reacción (A) anterior. Con respecto a estas bases, se pueden seleccionar adecuadamente una o más de ellas y mezclar para su uso en una cantidad de 0,01 a 100 equivalentes con respecto al compuesto de fórmula (IV).

20 Adicionalmente, en la reacción anterior, se puede añadir un catalizador según requiera el caso. En cuanto a tal catalizador, se puede utilizar cianhidrina de acetona de 0,01 a 10 equivalentes con respecto al compuesto de fórmula (IV).

- 25 La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

El compuesto representado por la anterior fórmula (IV) se puede preparar de acuerdo con la siguiente reacción (C).



30 en donde R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 y Hal se definen como antes.

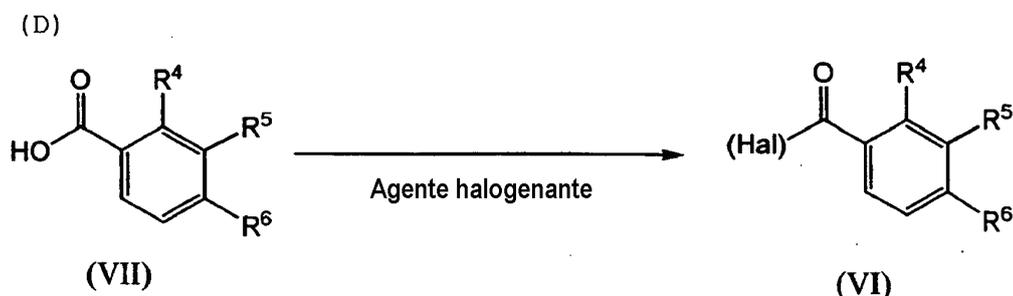
- 35 A saber, el compuesto representado por la fórmula (IV) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (V) o su sal, tal como un hidrocloreto, un sulfato o un nitrato, con un compuesto representado por la fórmula (VI).

40 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y se pueden mencionar, por ejemplo, aquellos ejemplificados en la reacción (B) anterior. Se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

45 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. La base puede ser una base orgánica o una base inorgánica, y se pueden mencionar aquellas ejemplificadas en la reacción (A) anterior. Con respecto a estas bases, se pueden seleccionar adecuadamente una o más de las mismas y mezclar para su uso en una cantidad de 1 a 100 equivalentes con respecto al compuesto de fórmula (VI).

La temperatura de reacción para la reacción anterior es usualmente de 0°C a 150°C, y el tiempo de reacción es usualmente de 1 minuto a 48 horas.

- 5 El compuesto representado por la anterior fórmula (VI) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (D).



en donde R⁴, R⁵, R⁶ y Hal se definen como antes.

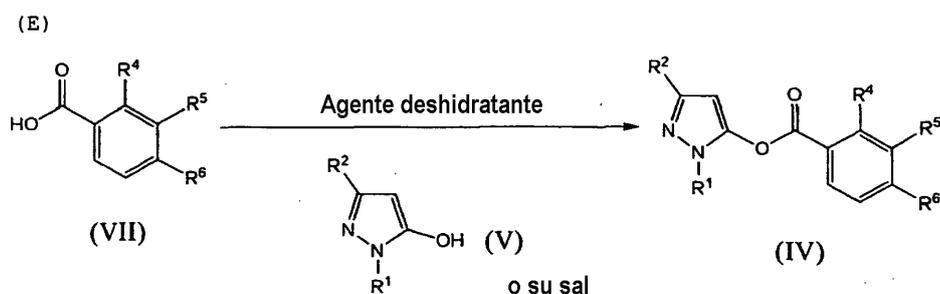
- 10 En la reacción anterior, se hace reaccionar un agente halogenante tal como cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo en una cantidad de 1 a 100 equivalentes con respecto al compuesto representado por la fórmula (VII).

- 15 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea un disolvente inerte para la reacción, y se pueden mencionar, por ejemplo, aquellos ejemplificados en la reacción (B) anterior. Se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

- 20 Para la reacción anterior, se puede utilizar un catalizador según requiera el caso. El catalizador puede ser, por ejemplo, DMF.

La temperatura de reacción para la reacción anterior es usualmente de 0°C a 150°C, y el tiempo de reacción es usualmente de 1 minuto a 48 horas.

- 25 El compuesto representado por la anterior fórmula (IV) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (E), distinta de los métodos anteriormente mencionados.



- 30 en donde R¹, R², R⁴, R⁵ y R⁶ se definen como antes.

A saber, el compuesto representado por la fórmula (IV) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (V) o su sal, tal como un hidrocloreto, un sulfato o un nitrato, con un compuesto representado por la fórmula (VII) por medio de un agente deshidratante.

- 35 El agente deshidratante que se va a utilizar para la reacción anterior puede ser, por ejemplo, DCC (diciclohexilcarbodiimida) o hidrocloreto de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida.

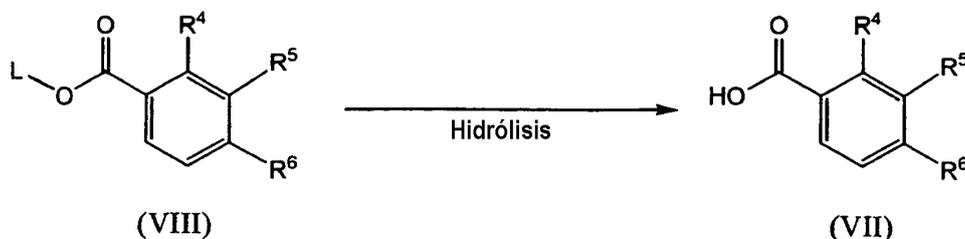
- 40 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y se pueden mencionar, por ejemplo, aquellos ejemplificados en la reacción (B) anterior. Se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

- 45 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. La base puede ser, por ejemplo, una amina terciaria tal como trietilamina y diisopropilamina; piridina, 4-(dimetilamino)piridina o 2,6-lutidina. En cuanto a la base, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos y mezclar para su

uso en una cantidad de 1 a 100 equivalentes con respecto al compuesto representado por la fórmula (VII).

La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

5 El compuesto representado por la anterior fórmula (VII) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (F).
(F)



10 en donde R⁴, R⁵ y R⁶ se definen como antes, y L es un grupo protector tal como alquilo.

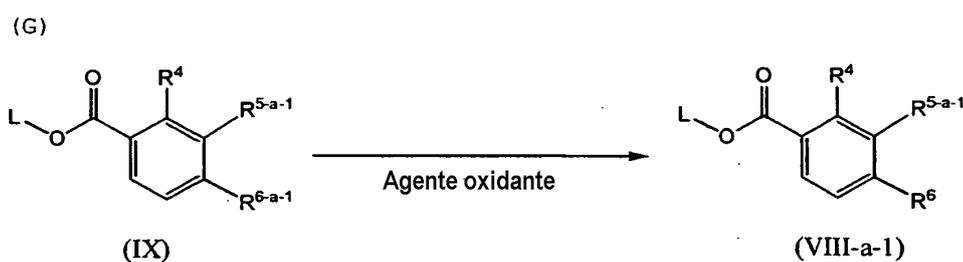
El compuesto representado por la fórmula (VII) se puede producir sometiendo un compuesto representado por la fórmula (VIII) a hidrólisis en presencia de agua.

15 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y éste puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un disolvente polar aprótico tal como acetonitrilo, DMF, DMSO, DMA, HMPA o sulfolano; un éter tal como éter dietílico, dioxano, THF o dimetoxietano; un alcohol tal como metanol o etanol; o agua. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

20 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de una base o un ácido, según requiera el caso. La base puede ser una base orgánica o una base inorgánica, y se pueden mencionar aquellas ejemplificadas en la reacción (A) anterior. El ácido puede ser, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico o ácido perclórico. En cuanto a la base o al ácido, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos y mezclar para su uso en una cantidad de 1 a 100 equivalentes con respecto al compuesto representado por la fórmula (VIII).

25 La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

30 Entre los compuestos representados por la anterior fórmula (VIII), se puede producir un compuesto en donde R⁵ es R^{5-a-1} de acuerdo con la siguiente reacción (G).



35 en donde R^{5-a-1} es alcoxi sustituido con un Y², o haloalcoxi, R^{6-a-1} es alquilitio, y L, R⁴, R⁶ e Y² se definen como antes.

A saber, el compuesto representado por la fórmula (VIII-a-1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IX) con un agente oxidante en presencia de un disolvente.

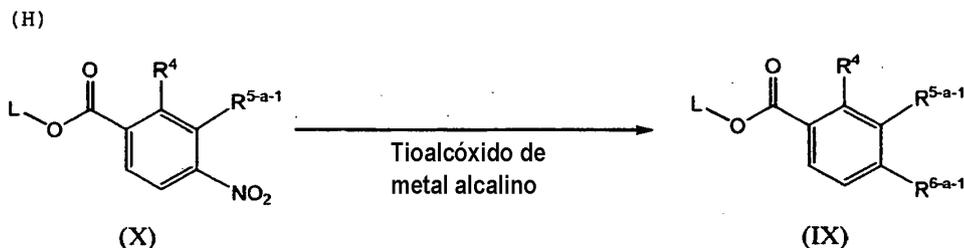
40 El agente oxidante que se va a utilizar en la reacción anterior puede ser, por ejemplo, peróxido de hidrógeno, ácido peracético o ácido metacloroperbenzoico.

45 El disolvente que se va a utilizar para la reacción anterior puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y éste puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno, cloroformo, dicloroetano o tricloroetano; una cetona tal como acetona o metil etil cetona; un éter tal como éter dietílico, dioxano, THF o dimetoxietano; o ácido acético. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

- 5 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un catalizador, según requiera el caso. El catalizador puede ser, por ejemplo, tungstato de sodio o su hidrato.

El compuesto representado por la anterior fórmula (IX) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (H).



10

en donde L, R⁴, R^{5-a-1} y R^{6-a-1} se definen como antes.

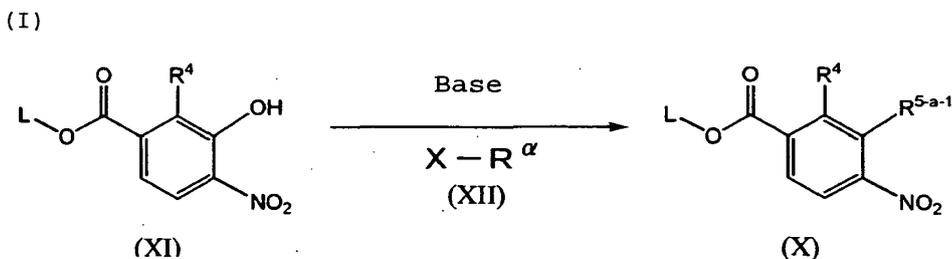
- 15 A saber, el compuesto representado por la fórmula (IX) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (X) con un tioalcóxido de metal alcalino.

El tioalcóxido de metal alcalino que se va a utilizar para la reacción anterior puede ser, por ejemplo, tiometóxido de sodio o tioetóxido de sodio.

- 20 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y éste puede ser, por ejemplo, un disolvente polar aprótico tal como acetonitrilo, DMF, DMSO, DMA, HMPA, sulfolano o dimetoxietano. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

- 25 La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

El compuesto representado por la anterior fórmula (X) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (I).



30

en donde R^α es alquilo sustituido con un Y², o haloalquilo, X es un grupo eliminable tal como halógeno o un grupo metanosulfonilo, y L, R⁴, R^{5-a-1} e Y² se definen como antes.

- 35 A saber, el compuesto representado por la fórmula (X) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XI) con un compuesto representado por la fórmula (XII) en presencia de una base.

- La base que se va a utilizar en la reacción anterior puede ser una base inorgánica o una base orgánica. La base orgánica puede ser, por ejemplo, trietilamina, diisopropilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina o 2,6-lutidina. La base inorgánica puede ser, por ejemplo, un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; o un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio. En cuanto a la base, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos y mezclar para su uso en una cantidad de 0,5 a 100 equivalentes con respecto al compuesto representado por la fórmula (XI).

45

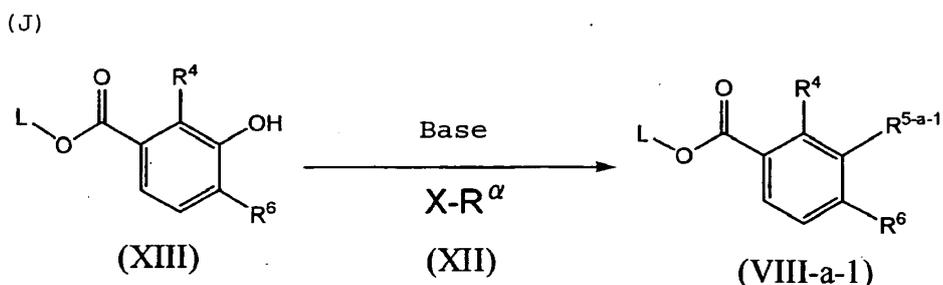
La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y se pueden mencionar, por ejemplo, aquellos ilustrados en la anterior reacción (B). Se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un catalizador, según requiera el caso. El catalizador puede ser, por ejemplo, yoduro de potasio o yoduro de tetra-n-butilamonio.

- 5 La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

El compuesto representado por la anterior fórmula (VIII-a-1) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (J), distinta del método anterior.

10

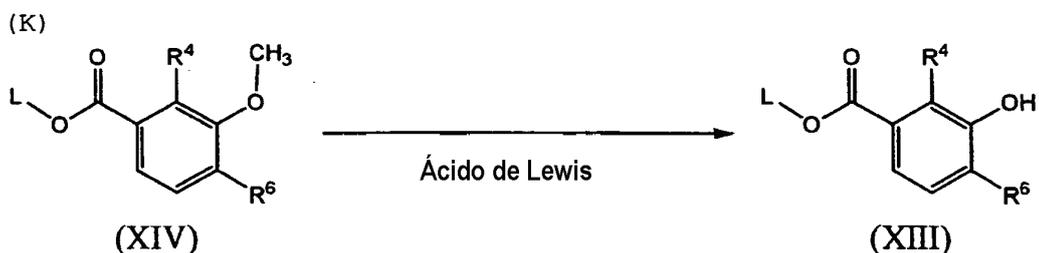


en donde L, R⁴, R^{5-a-1}, R⁶, R^α y X se definen como antes.

- 15 A saber, el compuesto representado por la fórmula (VIII-a-1) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIII) con un compuesto representado por la fórmula (XII) en presencia de una base.

La reacción anterior se puede llevar a cabo de la misma manera que la anterior reacción (I).

- 20 El compuesto representado por la anterior fórmula (XIII) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (K).



en donde R⁴, R⁶ y L se definen como antes.

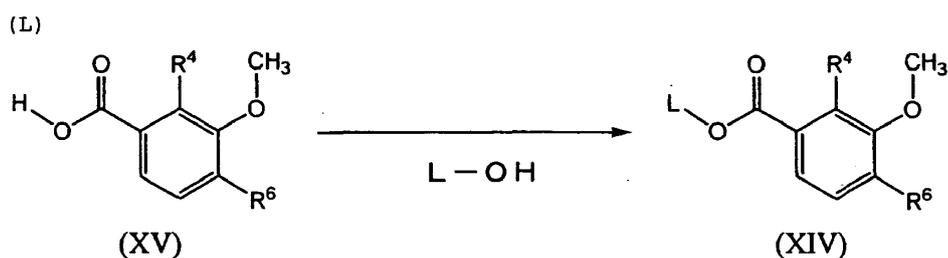
- 25 A saber, el compuesto representado por la fórmula (XIII) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIV) con un ácido de Lewis tal como tribromuro de boro, cloruro de aluminio o bromuro de hierro.

- 30 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y éste puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno, cloroformo, dicloroetano o tricloroetano; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; o un éster tal como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

35

La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

El compuesto representado por la anterior fórmula (XIV) se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (L).



en donde R^4 , R^6 y L se definen como antes.

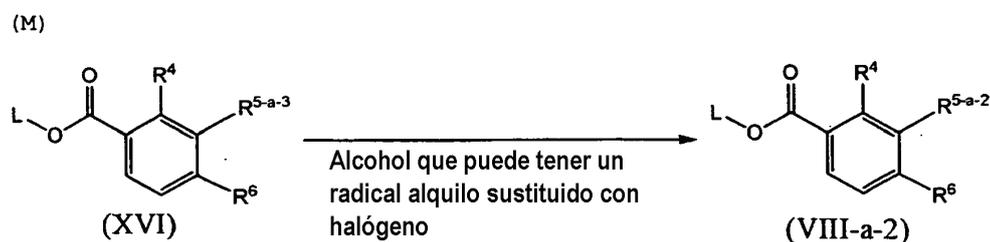
- 5 A saber, el compuesto representado por la fórmula (XIV) se puede producir mediante una reacción de introducción de un grupo protector L en un compuesto representado por la fórmula (XV).

10 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y éste puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un éster tal como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; un hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno, cloroformo, dicloroetano o tricloroetano; o un disolvente polar aprótico tal como acetonitrilo, DMF, DMSO, DMA, HMPA o sulfolano. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

- 15 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un ácido, según requiera el caso. El ácido que se va a utilizar para la reacción anterior puede ser, por ejemplo, ácido clorhídrico o ácido sulfúrico.

20 La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

Entre los compuestos representados por la anterior fórmula (VIII), un compuesto en donde R^5 es R^{5-a-2} se puede producir de acuerdo con la siguiente reacción (M).



25 en donde R^{5-a-2} es alquilo sustituido con un Y^1 , R^{5-a-3} es bromoalquilo, y L, R^4 , R^6 e Y^1 se definen como antes.

30 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y éste puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol o etanol; un éster tal como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; un éter tal como éter dietílico, dioxano, THF o dimetoxietano; o un disolvente polar aprótico tal como acetonitrilo, DMF, DMSO, DMA, HMPA o sulfolano. En cuanto al disolvente, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más de los mismos.

35 La reacción anterior se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio.

La reacción anterior se puede llevar a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0°C a 150°C durante un tiempo de reacción usualmente de 1 minuto a 48 horas.

40 Los compuestos de la presente invención tienen excelentes efectos herbicidas cuando se utilizan como ingrediente activo de herbicidas. El intervalo de aplicación se extiende a campos agrícolas tales como arrozales, campos de cultivo, huertos y cultivos de morera y campos no agrícolas tales como terrenos forestales, caminos de granjas, terrenos de juego y recintos fabriles. El método de aplicación se puede seleccionar apropiadamente entre aplicación al suelo, aplicación foliar, aplicación al agua, etc.

45 Los compuestos de la presente invención son capaces de controlar una amplia gama de malas hierbas no deseadas, por ejemplo gramíneas tales como el cerreig (*Echinochloa crus-galli* L., *Echinochloa oryzicola* Vasing.), el garranchuelo (*Digitaria sanguinalis* L., *Digitaria ischaemum* Muhl., *Digitaria adscendens* Henr., *Digitaria microbachne*

Henr. , Digitaria horizontalis Willd.), el almorejo verde (Setaria viridis L.), la cola de zorra gigante (Setaria faberi Herrm.), la cola de zorra amarilla yellow foxtail (Setaria lutescens Hubb.), la pata de gallina (Eleusine indica L.), la avena loca (Avena fatua L.), el sorgo (Sorghum halepense L.), el agrópiro invasor (Agropyron repens L.), la brachiaria (Brachiaria plantaginea), la hierba de guinea (Panicum maximum Jacq.), el pasto pará (Panicum purpurascens), el pasto chino (Leptochloa chinensis), el pasto morado (Leptochloa panicea), la poa de los prados (Poa annua L.), el pasto negro (Alopecurus myosuroides Huds.), el agrópiro de colorado (Agropyron tsukushiense (Honda) Ohwi), la braquiaria de hoja ancha (Brachiaria platyphilla Nash), el cadillo (Cenchrus echinatus L.), el ballico (Lolium multiflorum Lam.), y el gramón (Cynodon dactylon Pers.); cyperaceae tales como la juncia de los arrozales (Cyperus iria L.), la juncia redonda (Cyperus rotundus L.), la chufa (Cyperus esculentus L.), el junco Japonés (Scirpus juncooides), la juncia de tierras bajas (u serotinus), el coquito (Cyperus difformis), el junco acicular (Eleocharis acicularis), y la castaña de agua (Eleocharis kuroguwai); alismataceae tales como la punta de flecha enana (u pygmaea), la cola de golondrina (Sagittaria trifolia), y la alisma de hoja estrecha (Alisma canaliculatum); pontederiaceae tales como la monocoria (Monochoria vaginalis), y especies de monocoria (Monochoria korsakowii); scrophulariaceae tales como la falsa pamplina (Lindernia pyxidaria), y la abunoma (Dopatrium junceum); lythraceae tales como la rotala (Rotala india), y la amania de tallo rojo (Ammannia multiflora); elatinaceae tales como la hierba de agua de tallo largo (Elatine triandra SCHK.); malvaceae tales como el abutilón (Abutilon theophrasti MEDIC.), y la sida espinosa (Sida spinosa L.); compositae tales como el cadillo común (Xanthium strumarium L.), la ambrosía común (Ambrosia elatior L.), el cardo (Breea setosa (BIEB.) KITAM.), la guasca (Galinsoga ciliata Blake), la manzanilla silvestre (Matricaria chamomilla L.); solanaceae tales como la hierbamora (Solanum nigrum L.), y el estramonio (Datura stramonium); amaranthaceae tales como el bleado verde (Amaranthus viridis L.), y el bleado (Amaranthus retroflexus L.); polygonaceae tales como el poligono pata de perdiz (Polygonum lapathifolium L.), el poligono pejiquera (Polygonum persicaria L.), la enredadera anual (Polygonum convolvulus L.), y la sanguinaria (Polygonum aviculare L.); cruciferae tales como la cardamina (Cardamina flexuosa WITH.), el zurrón de pasto (Capsella bursa-pastoris Medik.), y la mostaza india (Brassica juncea Czern.); convolvulaceae tales como la campanilla (Ipomoea purpurea L.), la correhuella (Calystegia arvensis L.), y el dondiego de día trepador (Ipomoea hederacea Jacq.); Chenopodiaceae tales como el cenizo (Chenopodium album L.), y la morenita (Kochia scoparia Schrad.); Portulacaceae tales como la verdolaga (Portulaca oleracea L.); leguminosae tales como la casia falcada (Cassia obtusifolia L.); caryophyllaceae tales como la hierba de los canarios (Stellaria media L.); labiatae tales como la ortiga mansa (Lamium amplexicaule L.); rubiaceae tales como el amor de hortelano (Galium spurium L.); euphorbiaceae tales como la hoja de cobre (Acalypha australis L.); y Commelinaceae tales como la flor de un día asiática (Commelina communis L.).

Por lo tanto, se pueden utilizar eficazmente para controlar selectivamente malas hierbas nocivas o controlar no selectivamente malas hierbas al cultivar cultivos útiles tales como maíz (Zea mays L.), soja (Glycine max Merr.), algodón (Gossypium spp.), trigo (Triticum spp.), arroz (Oryza sativa L.), cebada (Hordeum vulgare L.), centeno (Secale cereale L.), acena (Avena sativa L.), sorgo (Sorghum bicolor Moench), colza (Brassica napus L.), girasol (Helianthus annuus L.), remolacha azucarera (Beta vulgaris L.), caña de azúcar (Saccharum officinarum L.), zoísia japónica (Zoysia japonica stend), cacahuete (Arachis hypogaea L.), lino (Linum usitatissimum L.), tabaco (Nicotiana tabacum L.), y café (Coffea spp.). Concretamente, los compuestos de la presente invención se utilizan eficazmente para controlar selectivamente malas hierbas nocivas en el cultivo de maíz, soja, algodón, trigo, arroz, colza, girasol, remolacha azucarera, caña de azúcar, zoísia japónica, cacahuete, lino, tabaco, café, y similares, y entre estos, especialmente maíz, trigo, arroz, zoísia japónica y similares. En el cultivo de tales plantas de cultivo, por ejemplo, en el cultivo de maíz, entre las malas hierbas nocivas anteriormente mencionadas, las gramíneas y malvaceae son, por ejemplo, malas hierbas nocivas típicas, y el almorejo verde, al hierba de guinea y el abutilón pertenecientes a estas se pueden mencionar, por ejemplo, como malas hierbas difícilmente controlables. Mientras sean seguras para las plantas de cultivo, los compuestos de la presente invención pueden ser particularmente eficaces no solo para controlar las malas hierbas nocivas anteriores sino también para controlar malas hierbas nocivas difícilmente controlables tales como el almorejo verde, la hierba de guinea y el abutilón.

El compuesto de la presente invención se puede mezclar con diversos aditivos agrícolas y aplicar en forma de diversas formulaciones tales como espolvoreables, gránulos, gránulos dispersables en agua, polvos mojables, comprimidos, píldoras, cápsulas (incluyendo una formulación empaquetada con una película soluble en agua), suspensiones con una base acuosa, suspensiones con una base oleosa, microemulsiones, suspoemulsiones, polvos solubles en agua, concentrados emulsionables, concentrados solubles o pastas. Estas se pueden formar en cualquier formulación que se utilice normalmente en este campo, con tal que se pueda cumplir el objeto de la presente invención.

Los aditivos que se pueden utilizar para la formulación incluyen, por ejemplo, un portador sólido tal como tierra de diatomeas, cal apagada, carbonato de calcio, talco, hulla blanca, caolín, bentonita, una mezcla de caolinita y sericita, arcilla, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio, mirabilita, zeolita o almidón; un disolvente tal como agua, tolueno, xileno, nafta disolvente, dioxano, acetona, isoforona, metil isobutil cetona, clorobenceno, ciclohexano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o un alcohol; un tensioactivo aniónico tal como un sal de ácido graso, un benzoato, un alquilsulfosuccinato, un dialquilsulfosuccinato, un policarboxilato, una sal de ester de ácido alquilsulfúrico, un alquilsulfato, un alquilarilsulfato, un alquildiglicol eter sulfato, una sal de

éster de alcohol y ácido sulfúrico, un alquilsulfonato, un alquilarilsulfonato, un arilsulfonato, un lignosulfonato, un alquildifenileterdisulfonato, un poliestirensulfonato, una sal de éster alquilfosfórico, un alquilarilfosfato, un estirilarilfosfato, una sal de éster ácido polioxietilenaquiletersulfúrico, un polioxietilenaquiletersulfato, una sal de éster de ácido polioxietilenaquiletersulfúrico, un polioxietilenaquileterfosfato, una sal de éster de ácido polioxietilenaquilarilfosfórico, una sal de éster de ácido polioxietilenarileterfosfórico, un naftalenosulfonato condensado con formaldehído o un alquilnaftalenosulfonato condensado con formaldehído; un tensioactivo no iónico tal como un éster de ácido graso y sorbitán, un éster de ácido graso y glicerina, un poliglicérido de ácido graso, un poliglicol éter de alcohol de ácido graso, glicol de acetileno, alcohol de acetileno, un copolímero de bloques de oxialquileno, un polioxietilenaquileter, un polioxietilenaquilarileter, un polioxietilenestirilarileter, un polioxietilenglicolalquileter, polietilenglicol, un éster de ácido graso y polioxietileno, un éster de ácido graso y polioxietilensorbitán, un éster de ácido graso polioxietilenglicerina, un aceite de ricino hidrogenado con polioxietileno o un éster de ácido graso y polioxipropileno; y un aceite vegetal o aceite mineral tal como aceite de oliva, aceite de kapok, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia, aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de salvado de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semilla de algodón, aceite de soja, aceite de colza, aceite de linaza, aceite de tung o parafinas líquidas. Estos aditivos se pueden seleccionar apropiadamente para ser utilizados solos o combinados en forma de una mezcla de dos o más de los mismos, con tal que se logre el objeto de la presente invención. Adicionalmente, se pueden seleccionar adecuadamente aditivos distintos de los anteriormente mencionados para su uso entre los conocidos en este campo. Por ejemplo, se pueden utilizar diversos aditivos utilizados comúnmente, tales como una carga, un espesante, un agente antisedimentación, un agente anticongelante, un estabilizador de la dispersión, un protector, un agente anti-moho, un agente espumante, un disgregante y un aglutinante. La razón de mezcla y el peso del compuesto de la presente invención con respecto a tales diferentes aditivos pueden ser de 0,1:99,9 a 95:5, preferiblemente de 0,2:99,8 a 85:15.

La dosis del herbicida que contiene el compuesto de la presente invención no se puede definir generalmente, puesto que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, las condiciones del suelo, el tipo de formulación, el tipo de malas hierbas que se vayan a controlar, la temporada de aplicación, etc. Sin embargo, se aplica usualmente en una cantidad del compuesto de la presente invención de 0,1 a 5.000 g, preferiblemente de 0,5 a 1.000 g, more preferiblemente de 1 a 500 g, por hectárea. La presente invención incluye tal método para controlar las malas hierbas, mediante tales aplicaciones del herbicida.

Adicionalmente, el herbicida que contiene el compuesto de la presente invención se pueden mezclar con o se puede utilizar combinado con otros productos químicos agrícolas, fertilizantes o agentes reductores de la fitotoxicidad, por medio de lo cual se pueden obtener a veces efectos o actividades sinérgicos. Estos otros productos agrícolas incluyen, por ejemplo, un herbicida, un fungicida, un antibiótico, una hormona vegetal y un insecticida. Especialmente, con una composición herbicida mixta que tiene compuesto de la presente invención mezclado con o utilizado combinado con uno o más active compuestos de otros herbicidas, se pueden mejorar en las direcciones preferidas la gama de malas hierbas que se vaya a controlar, el tiempo de aplicación de esta composición, las actividades herbicidas, etc.. El compuesto de la presente invención y los compuestos activos de otros herbicidas se pueden formular de manera que se puedan mezclar para su uso en el momento de la aplicación, o se pueden formular juntos. La presente invención incluye tal composición herbicida mixta.

La razón de mezcla del compuesto de la presente invención con respecto a los compuestos activos de los otros herbicidas no se puede definir generalmente, puesto que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, las condiciones del suelo, los tipos de formulaciones, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, etc., pero los otros herbicidas se mezclan en una cantidad de 0,001 a 10.000 partes en peso, preferiblemente de 0,01 a 1.000 partes en peso por tipo de compuesto activo, basándose en 1 parte en peso del compuesto de la presente invención. Adicionalmente, la dosis para la aplicación es tal que la cantidad total de los compuestos activos es de 0,1 a 10.000 g, preferiblemente de 0,2 a 5.000 g, más preferiblemente de 10 a 3.000 g, por hectárea. La presente invención incluye un método para controlar malas hierbas no deseadas mediante la aplicación de tal composición herbicida mixta.

Otro compuesto activo como herbicida incluye, por ejemplo, los siguientes compuestos (incluyendo los nombres comunes aquellos aplicados para su aprobación por la ISO). Incluso cuando no se mencione aquí específicamente, en caso de que tales compuestos tengan sales, ésteres alquílicos, etc., estos están, por supuesto, incluidos.

(1) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas mediante la alteración de las actividades hormonales de las plantas, tales como un tipo fenoxi tal como 2,4-D, 2,4-D-butotilo, 2,4-D-butilo, 2,4-D-dimetilamonio, 2,4-D-diolamina, 2,4-D-etilo, 2,4-D-2-etilhexilo, 2,4-D-isobutilo, 2,4-D-isocitilo, 2,4-D-isopropilo, 2,4-D-isopropilamonio, 2,4-D-sodio, 2,4-D-isopropanolamonio, 2,4-D-trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butilo, 2,4-DB-dimetilamonio, 2,4-DB-isocitilo, 2,4-DB-potasio, 2,4-DB-sodio, diclorprop, diclorpropbutotilo, diclorprop-dimetilamonio, diclorpropisocitilo, diclorprop-potasio, diclorprop-P, diclorprop-P-dimetilamonio, diclorprop-P-potasio, diclorprop-P-sodio, MCPA, MCPA-butotilo, MCPA-dimetilamonio, MCPA-2-etilhexilo, MCPA-potasio, MCPA-sodio, MCPA-tioetilo, MCPB, MCPB-etilo, MCPB-sodio, mecoprop, mecoprop-butotilo, mecoprop-sodio, mecoprop-P, mecoprop-P-butotilo, mecoprop-P-dimetilamonio, mecoprop-P-2-etilhexilo, mecoprop-P-potasio, naproanilida o clomeprop; un tipo ácido carboxílico aromático tal como 2,3,6-TBA, dicamba, dicambabutotilo, dicamba-diglicolamina, dicamba-dimetilamonio, dicamba-

- diolamina, dicamba-isopropilamonio, dicambapotasio, dicamba-sodio, diclobenilo, picloram, picloram-dimetilamonio, picloram-isocitilo, piclorampotasio, picloram-triisopropanolamonio, picloramtriisopropilamonio, picloram-trolamina, triclopir, triclopir-butotilo, triclopir-trietilamonio, clopiralida, clopiralida-olamina, clopiralida-potasio, clopiralida-triisopropanolamonio o aminopirialida; y otros tales como naptalam, naptalam-sodio, benazolina, benazolina-etilo, quinclorac, quinmerac, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, fluroxipir, fluroxipir-2-butoxi-1-metiletilo, fluroxipir-meptilo, clorflurenol o clorflurenol-metilo.
- (2) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas mediante la inhibición de la fotosíntesis de las plantas, tales como un tipo urea tal como clorotolurón, diurón, fluometurón, linurón, isoproturón, metobenzurón, tebutiurón, dimefurón, isourón, karbutilato, metabenztiázurón, metoxurón, monolinurón, neburón, sidurón, terbumetón o trietazina; un tipo triazina tal como simazina, atrazina, atratona, simetrina, prometrina, dimetametrina, hexazinona, metribuzina, terbutilazina, cianazina, ametrina, cibutrina, triaziflam, terbutrina, propazina, metamitrón o prometón; un tipo uracilo tal como bromacilo, bromacilo litio, lenacilo o terbacilo; un tipo anilida tal como propanilo o cipromida; un tipo carbamato tal como swep, desmedifam o phenmedifam; un tipo hidroxibenzonitrilo tal como bromoxinilo, octanoato de bromoxinilo, heptanoato de bromoxinilo, ioxinilo, octanoato de ioxinilo, ioxinil-potasio o ioxinil-sodio; y otros tales como piridato, bentazona, bentazona-sodio, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, cinidon-etilo o flutiacet-metilo.
- (3) Tipo sal de amonio cuaternario tal como paraquat o diquat, que se cree que es convertido en radicales libres por sí mismo para formar oxígeno activo en el cuerpo de la planta y muestra una rápida eficacia herbicida.
- (4) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas mediante la inhibición de la biosíntesis de clorofila de las plantas y la acumulación anómala de una sustancia peroxidada fotosintetizante en el cuerpo de la planta, tal como un tipo difeniléter tal como nitrofenol, clometoxifeno, bifenox, acifluorfenol, acifluorfenol-sodio, fomesafeno, fomesafeno-sodio, oxifluorfenol, lactofeno, aclonifeno, etoxifeno-etil(HC-252), fluoroglicofeno-etilo o fluoroglicofeno; un tipo imida cíclica tal como clorftalim, flumioxazina, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, cinidon-etilo o flutiacet-metilo; y otros tales como oxadiargilo, oxadiazona, sulfentrazona, carfentrazona-etilo, tidiazimina, pentoxazona, azafenidina, isopropazol, piraflufeno-etilo, benzfendizona, butafenacilo, flupoxam, fluazolato, profluzol, piraclonilo, flufenpir-etilo o bencarbazona.
- (5) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas caracterizados por actividades blanqueantes mediante la inhibición de la cromogénesis de plantas tales como carotenoides, tal como un tipo piridazinona tal como norflurazona, cloridazona o metflurazona; un tipo pirazol tal como pirazolinato, pirazoxifeno, benzofenap, topramezona (BAS-670H) o pirasulfotol; y otros tales como amitrol, fluridon, flurtamona, diflufenican, metoxifenona, clomazona, sulcotriona, mesotriona, tembotriona, tefuriltriona (AVH-301), isoxaflutol, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, isoxaclortol, benzobiclon, picolinafeno o beflubutamida.
- (6) Aquellos que exhiben fuertes efectos herbicidas específicamente contra plantas gramíneas, tales como un tipo ariloxifenoxipropiónico tal como diclofopmetilo, diclofop, pirifenop-sodio, fluazifop-butilo, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-P-butilo, haloxifopmetilo, haloxifop, haloxifop-etotilo, haloxifop-P, haloxifop-P-metilo, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, cihalofopbutilo, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-etilo, metamifop-propilo, metamifop, clodinafop-propargilo, clodinafop o propaquizafop; un tipo ciclohexanediona tal como aloxidim-sodio, aloxidim, cletodim, setoxidim, tralcoxidim, butroxidim, tepraloxidim, profoxidim o cicloxidim; u otros tales como flamprop-M-metilo, flamprop-M o flamprop-M-isopropilo.
- (7) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas mediante la inhibición de la biosíntesis de aminoácidos de plantas, tales como un tipo sulfonilurea tal como clorimurón-etilo, clorimurón, sulfometurón-metilo, sulfometurón, primisulfuron-metilo, primisulfurón, bensulfuron-metilo, bensulfurón, clorsulfurón, metsulfuron-metilo, metsulfurón, cinosulfurón, pirazosulfuron-etilo, pirazosulfurón, azimsulfurón, flazasulfurón, rimsulfurón, nicosulfurón, imazosulfurón, ciclosulfamurón, prosulfurón, flupirsulfuron-metil-sodio, flupirsulfurón, triflusulfuron-metilo, triflusulfurón, halosulfuron-metilo, halosulfurón, tifensulfuron-metilo, tifensulfurón, etoxisulfurón, oxasulfurón, etametsulfurón, etametsulfuron-metilo, yodosulfurón, yodosulfuron-metil-sodio, sulfosulfurón, triasulfurón, tribenurón-metilo, tribenurón, tritosulfurón, foramsulfurón, trifloxisulfurón, trifloxisulfurón-sodio, mesosulfurón-metilo, mesosulfurón, ortosulfamurón, flucetosulfurón, amidosulfurón, TH-547, un compuesto descrito en el documento WO 2005092104; un tipo triazolopirimidinulfonamida tal como flumetsulam, metosulam, diclosulam, cloransulam-metilo, florasulam o penoxsulam; un tipo imidazolinona tal como imazapir, imazapir-isopropilamonio, imazetapir, imazetapiramonio, imazaquina, imazaquin-amonio, imazamox, imazamox-amonio, imazametabenz, imazametabenz-metilo o imazapic; un tipo ácido pirimidinilsalicílico tal como piritiobac-sodio, bispiribac-sodio, piriminobacmetilo, piribenzoxima, piriftalid, pirimisulfán (KUH-021); un tipo sulfonilaminocarboniltriazolinona tal como flucarbazona, flucarbazona-sodio, propoxicarbazona-sodio o propoxicarbazona; y otros tales como glifosato, glifosato-sodio, glifosato-potasio, glifosato-amonio, glifosato-diamonio, glifosato-isopropilamonio, glifosato-trimesium, glifosato-sesquisodio, glufosinato, glufosinato-amonio, bilanafos, bilanafos-sodio o cinmetilina.
- (8) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas mediante la inhibición de las mitosis de las plantas, tales como un tipo dinitroanilina tal como trifluralina, orizalina, nitralina, pendimetalina, etalfuralina, benfluralina, prodiamina, butralina o dinitramina; un tipo amida tal como bensulida, napropamida, propizamida o pronamida; un tipo fósforo orgánico tal como amiprofos-metilo, butamifos, anilofos o piperofos; un tipo fenilcarbamato tal como profam, clorprofam, barban o carbetamida; un tipo cumilamina tal como daimurón, cumilurón, bromobutida o metildimurón; y otros tales como asulam, asulam-sodio, ditiopir, tiazopir, clorthal-dimetilo, clorthal o difenamida.
- (9) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas mediante la inhibición de la biosíntesis de proteínas o la biosíntesis de lípidos de plantas, tal como un tipo cloroacetamida tal como alaclor, metazaclor, butaclor, pretilaclor, metolaclor, S-metolaclor, tenilclor, petoxamida, acetoclor, propaclor, dimetenamida, dimetenamida-P, propisoclor o

dimetaclor; un tipo tiocarbamato tal como molinato, dimepiperato, piributicarb, EPTC, butilato, vernolato, pebulato, cicloato, prosulfocarb, esprocarb, tiobencarb, dialato, tri-alato o orbencarb; y otros tales como etobenzanida, mefenacet, flufenacet, tridifano, cafenstrol, fentrazamida, oxaziclomefona, indanofano, benfuresato, piroxasulfona (KIH-485), dalapon, dalapon-sodio, TCA-sodio o ácido tricloroacético.

(10) MSMA, DSMA, CMA, endothall, endothall-dipotasio, endothall-sodio, endothall-mono(N,N-dimetilalquilamonio), etofumesato, clorato de sodio, ácido pelargónico, ácido nonanoico, fosamina, fosamina-amonio, pinoadeno, HOK-201, acroleína, sulfamate de amonio, bórax, ácido cloroacético, cloroacetato de sodio, cianamida, ácido metilarsónico, ácido dimetilarsínico, dimetilarsinato de sodio, dinoterb, dinoterb-amonio, dinoterb-diolamina, dinoterb-acetato, DNOC, sulfato ferroso, flupropanato, flupropanato-sodio, isoxaben, mefluidida, mefluidida-diolamina, metam, metam-amonio, metam-potasio, metam-sodio, isotiocianato de metilo, pentaclorofenol, pentaclorofenóxido de sodio, laurato de pentaclorofenol, quinoclamina, ácido sulfúrico, urea sulfato, etc.

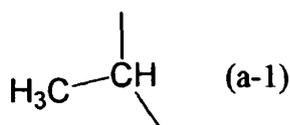
(11) Aquellos que se cree que exhiben sus efectos herbicidas siendo parásitos de plantas, tales como Xanthomonas campestris, Epicoccosirus nematosorus, Epicoccosirus nematosperus, Exserohilum monoseras o Drechsrela monoceras.

Los ejemplos de las realizaciones preferidas de la presente invención se muestran más abajo, pero la presente invención no se restringe a las mismas de ningún modo.

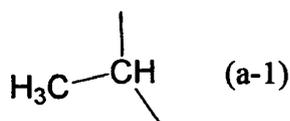
(1) Un compuesto de benzoilpirazol de la anterior fórmula (I) o su sal, en donde R¹ es alquilo, R² es un átomo de hidrógeno o alquilo, R³ es alquilo, R⁴ es alquilo, R⁵ es alquilo sustituido con un Y¹, alcoxi sustituido con un Y², o alcoxicarbonilo, R⁶ es alquilsulfonilo, A es alquileo sustituido con un alquilo, Y¹ es alcoxi o haloalcoxi, e Y² es alcoxi.

(2) El compuesto de benzoilpirazol o su sal del anterior apartado (1), en donde R² es un átomo de hidrógeno y R⁵ es alcoxi sustituido con un alcoxi.

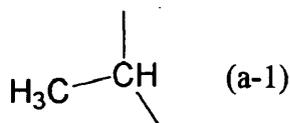
(3) El compuesto de benzoilpirazol o su sal del anterior apartado (1), en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es metilo, R⁴ es metilo, R⁵ es 2-metoxietoxi, R⁶ es metilsulfonilo, y A es la fórmula (a-1):



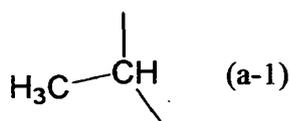
(4) El compuesto de benzoilpirazol o su sal del anterior apartado (1), en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es etilo, R⁴ es metilo, R⁵ es 2-metoxietoxi, R⁶ es metilsulfonilo, y A es la fórmula (a-1):



(5) El compuesto de benzoilpirazol o su sal del anterior apartado (1), en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es isopropilo, R⁴ es metilo, R⁵ es 2-metoxietoxi, R⁶ es metilsulfonilo, y A es la fórmula (a-1):



(6) El compuesto de benzoilpirazol o su sal del anterior apartado (1), en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es etilo, R⁴ es metilo, R⁵ es metoximetilo, R⁶ es metilsulfonilo, y A es la fórmula (a-1):



(7) Una composición herbicida que comprende un compuesto de benzoilpirazol de la anterior fórmula (I) o su sal, y un coadyuvante agrícola.

(8) Un método para controlar plantas no deseadas o inhibir su crecimiento, que comprende aplicar una cantidad eficaz como herbicida del compuesto de benzoilpirazol de la anterior fórmula (I) o su sal a las plantas no deseadas o a un lugar en el que crecen .

(9) El método del anterior apartado (8), en donde las plantas no deseadas se controlan o su crecimiento se inhibe en

un campo de maíz.

(10) El método del anterior apartado (9), en donde el maíz es uno transformado.

(11) El método del anterior apartado (8), en donde las plantas no deseadas se controlan o su crecimiento se inhibe en un campo de trigo, cebada, o centeno.

5 (12) El método del anterior apartado (8), en donde las plantas no deseadas se controlan o su crecimiento se inhibe en un campo de arroz.

(13) El método del anterior apartado (8), en donde las plantas no deseadas se controlan o su crecimiento se inhibe en un terreno no agrícola.

10 (14) El uso de un compuesto de benzoilpirazol de la anterior fórmula (I) o su sal, como ingrediente activo para un herbicida selectivo en un campo de maíz.

Ahora, la presente invención se describirá con más detalle con referencia a los Ejemplos. Sin embargo, se debe entender que la presente invención no está restringida de ningún modo a tales Ejemplos específicos.

15 Más abajo se describe un Ejemplo de Preparación para un compuesto de la presente invención.

Ejemplo de preparación

20 Preparación de etilcarbonato de 1-(4-(3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoil)-1-metil-1H-pirazol-5-ilo)etilo (compuesto No. 2 como se ha descrito anteriormente)

(1) Se disolvieron 3-hidroxi-2-metil-4-nitrobenzoato de metilo (1,55 g) y 2-cloroetil metil eter (1,8 g) en DMF anhidra (20 mL), y se añadieron carbonato de potasio (1,25 g) y yoduro de potasio (300 mg), seguido de agitación a 90°C durante 20 horas. A la mezcla de reacción, se le añadió acetato de etilo (200 mL), lavando dos veces a continuación con salmuera saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y a 25 continuación se concentró a presión reducida para obtener 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-nitrobenzoato de metilo (2,1 g) en forma de un sólido de color amarillo pálido.

RMN H^1 (400 MHz $CDCl_3$ δ ppm) : 2,54 (3H, s), 3,39 (3H, s), 3,70 (2H, m), 3,91 (3H, m), 4,11 (2H, m), 7,59 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,64 (1H, d, J = 8,0 Hz).

(2) Se disolvió 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-nitrobenzoato de metilo (31 g) en DMF anhidra (300 mL), y se añadió tiometóxido de sodio (pureza: 95%, 8,92 g) a temperatura ambiente, seguido de agitación durante 45 minutos. A la 30 mezcla de reacción, se le añadió acetato de etilo (400 mL) y se lavó una vez con ácido clorhídrico 1 N (150 mL) y se lavó dos veces con salmuera saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida para obtener 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metiltio)benzoato de metilo (30 g) en forma de un sólido.

35 RMN H^1 (400 MHz $CDCl_3$ δ ppm): 2,24 (3H, s), 2,53 (3H, s), 3,48 (3H, s), 3,78 (2H, m), 3,86 (3H, s), 4,01 (2H, m), 6,96 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,68 (1H, d, J = 8,4 Hz).

(3) Se disolvió 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metiltio)benzoato de metilo (30 g) en ácido acético (300 mL), y se añadió dihidrato de tungstato de sodio (0,08 equivalentes, 2,9 g). Se añadió gota a gota a esto peróxido de hidrógeno (30%, 38 mL) a temperatura ambiente a lo largo de un período de 10 minutos. La mezcla de reacción se agitó a 40 temperatura ambiente durante tres horas, y a continuación, se añadieron acetato de etilo (300 mL) y hexano (300 mL), lavando a continuación tres veces con salmuera saturada. La capa orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente se separó mediante destilación a presión reducida para obtener 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoato de metilo (26 g).

45 RMN H^1 (400 MHz $CDCl_3$ δ ppm) : 2,54 (3H, s), 3,26 (3H, s), 3,46 (3H, s), 3,79 (2H, m), 3,91 (3H, s), 4,19 (2H, m), 7,71 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,84 (1H, d, J = 8,4 Hz)

(4) Se disolvió 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoato de metilo (26 g) en metanol (200 mL), y se añadió una disolución acuosa al 20% de NaOH (50 mL) a temperatura ambiente. Después de agitar durante una hora, el metanol se separó mediante destilación a presión reducida. Al residuo, se le añadió ácido clorhídrico 2 N (100 mL), 50 seguido de extracción con acetato de etilo (500 mL). La capa orgánica se lavó con salmuera saturada y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, y a continuación, el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. Al residuo, se le añadió una mezcla disolvente (acetato de etilo:hexano = 1:1, 50 mL), y la mezcla se dejó estar a 5°C durante 12 horas. Los cristales obtenidos se recogieron mediante filtración para obtener ácido 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoico (19,5 g).

55 RMN H^1 (400 MHz $CDCl_3$ δ ppm) : 2,63 (3H, s), 3,31 (3H, s), 3,49 (3H, s), 3,83 (2H, m), 4,23 (2H, m), 7,91 (2H, s).

(5) Se disolvió ácido 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoico (10 g) en cloroformo (200 mL), y se añadieron cloruro de oxalilo (6,0 mL) y DMF (cantidad catalítica) a temperatura ambiente. Después de agitar durante una hora, el cloroformo y el cloruro de oxalilo que no había reaccionado se separaron mediante destilación a presión reducida. Al residuo, se le añadieron 1-metil-1H-pirazol-5-ol (3,8 g), 4-dimetilaminopiridina (8,5 g), tetrahydrofurano (200 mL) y 60 trietilamina (7,3 mL), seguido de reflujo con calentamiento durante una hora. A continuación, a la mezcla de reacción refrigerada se le añadió, acetato de etilo (50 mL) y se lavó sucesivamente con salmuera saturada y ácido clorhídrico 0,30 N (200 mL) y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se lavó con hexano para obtener éster 1-metil-1H-pirazol-5-ílico de ácido 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoico (7,8 g).

RMN H₁ (400 MHz CDCl₃ δ ppm): 2,66 (3H, s), 3,32 (3H, s), 3,49 (3H, s), 3,81 (3H, s), 3,83 (2H, m), 4,25 (2H, m), 6,28 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,49 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,99 (2H, s).

(6) Se disolvió éster 1-metil-1H-pirazol-5-ílico de ácido 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonyl)benzoico (7,8 g) en acetonitrilo (100 mL), y se añadieron trietilamina (7,9 mL) y cianhidrina de acetona (0,87 mL) a temperatura ambiente. Después de agitar durante 6 horas, el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. Al residuo, se le añadió acetato de etilo (100 mL), lavando sucesivamente a continuación con ácido clorhídrico 1N (50 mL), agua y salmuera saturada, y secando sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se lavó con hexano para obtener 4-(3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonyl)benzoil)-1-metil-1H-pirazol-5-ol (4,2 g).

RMN H¹ (400 MHz CDCl₃ δ ppm) : 2,41 (3H, s), 3,31 (3H, s), 3,48 (3H, s), 3,73 (3H, s), 3,82 (2H, m), 4,26 (2H, m), 7,34 (1H, s), 7,36 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,94 (1H, d, J = 8,4 Hz).

(7) Se disolvió 4-(3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonyl)benzoil)-1-metil-1H-pirazol-5-ol (4,2 g) en acetona (50 mL), y se añadieron carbonato de potasio (5,5 g) y carbonato de 1-cloroetiletilo (9,1 g), seguido de reflujo con calentamiento durante 4 horas. A continuación, se añadió yoduro de sodio (10 g), seguido de reflujo adicional durante una hora. Después de dejar enfriar, la mezcla de reacción se disolvió en acetato de etilo (100 mL), y se añadió. Este sistema disolvente mixto se extrajo tres veces con acetato de etilo, y la capa orgánica se lavó con salmuera saturada y a continuación se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (disolvente de desarrollo: acetato de etilo:hexano = 1:1), y el disolvente se separó mediante destilación para obtener un sólido. Al sólido obtenido, se le añadió una mezcla disolvente (hexano:acetato de etilo = 7:3, 50 mL), y la mezcla se dejó estar a 5°C durante 12 horas. Los cristales obtenidos se recogieron mediante filtración para obtener el producto deseado (2,0 g) que tenía un punto de fusión de 120°C.

Ahora, se muestran ejemplos típicos de los compuestos representados por la anterior fórmula (I) en la Tabla 1, y sus datos del espectro de RMN H₁ se muestran en la Tabla 2. Estos compuestos se pueden preparar de acuerdo con el Ejemplo de Preparación anterior o los diversos procedimientos anteriores para la producción de los compuestos de la presente invención. En las Tablas 1 y 2, Núm. representa el número de compuesto. Adicionalmente, en la Tabla 1, Me representa un grupo metilo, Et un grupo etilo, n-Pr un grupo propilo normal, i-Pr un grupo isopropilo, n-Bu un grupo butilo normal y t-Bu un grupo butilo terciario. Adicionalmente, el lado izquierdo de -A- está unido al lado del pirazol, y el lado derecho de -A- está unido al lado del carbonato.

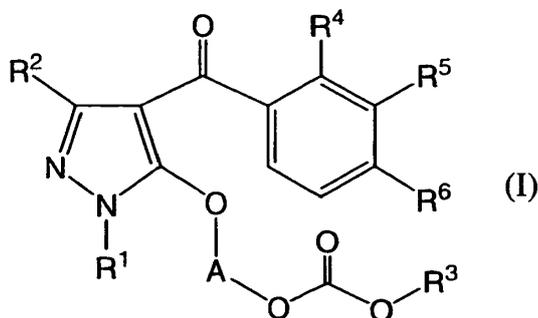


Tabla 1

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
1	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
2	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
3	Et	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
4	Me	H	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
5	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
6	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
7	Me	H	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
8	Me	H	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
9	n-Bu	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
10	t-Bu	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
11	Me	Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
12	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me)(Et)-
13	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Et)-
14	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(i-Pr)-
15	Me	H	Et	Me	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
16	Et	H	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
17	Me	H	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
18	i-Pr	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
19	Me	H	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
20	Me	H	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
21	Me	H	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
22	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
23	Et	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
24	Me	H	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
25	i-Pr	Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
26	Me	H	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
27	Me	H	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
28	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
29	Et	H	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
30	t-Bu	H	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
31	Me	Me	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
32	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
33	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
34	Et	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
35	Me	H	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
36	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-C(Me) ₂ -
37	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	-CH(Me)-
38	Me	H	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
39	Me	H	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
40	n-Bu	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
41	t-Bu	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
42	Me	Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
43	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-C(Me)(Et)-
44	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Et)-
45	Me	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(i-Pr)-
46	Me	H	Et	Me	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	-CH (Me) -
47	Et	H	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Et	-CH (Me) -
48	Me	H	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
49	i-Pr	Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
50	Me	H	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
51	Me	H	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
52	Me	H	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
53	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-C(Me) ₂ -
54	Et	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-C(Me) ₂ -
55	Me	H	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-C(Me) ₂ -
56	Me	H	Me	Br	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
57	Me	H	Et	Br	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
58	Et	H	Et	Br	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
59	Me	H	i-Pr	Br	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
60	Me	H	Et	Br	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-C(Me) ₂ -
61	Me	H	Et	Br	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
62	Me	H	Et	Br	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
63	n-Bu	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
64	t-Bu	H	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Et	-CH(Me)-
65	Me	Me	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
66	Me	Et	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
67	Me	Et	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
68	Me	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
69	Me	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
70	Me	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
71	Et	Et	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
72	Et	Et	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
73	Et	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
74	Et	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
75	Et	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
76	i-Pr	Et	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
77	i-Pr	Et	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
78	i-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
79	i-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
80	i-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
81	n-Pr	Et	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
82	n-Pr	Et	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
83	n-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
84	n-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
85	n-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
86	n-Bu	Et	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
87	n-Bu	Et	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
88	n-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
89	n-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
90	n-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
91	t-Bu	Et	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
92	t-Bu	Et	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
93	t-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
94	t-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
95	t-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
96	Me	Et	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
97	Me	Et	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
98	Me	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
99	Me	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
100	Me	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
101	Et	Et	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
102	Et	Et	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
103	Et	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
104	Et	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
105	Et	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
106	i-Pr	Et	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
107	i-Pr	Et	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
108	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
109	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
110	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
111	n-Pr	Et	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
112	n-Pr	Et	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
113	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
114	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
115	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
116	n-Bu	Et	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
117	n-Bu	Et	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
118	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
119	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
120	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
121	t-Bu	Et	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
122	t-Bu	Et	Et	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
123	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
124	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
125	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
126	Me	Et	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
127	Me	Et	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
128	Me	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
129	Me	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
130	Me	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
131	Et	Et	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me) -
132	Et	Et	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
133	Et	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
134	Et	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
135	Et	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
136	i-Pr	Et	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
137	i-Pr	Et	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
138	i-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
139	i-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
140	i-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
141	n-Pr	Et	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
142	n-Pr	Et	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
143	n-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
144	n-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
145	n-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
146	n-Bu	Et	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
147	n-Bu	Et	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
148	n-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
149	n-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
150	n-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
151	t-Bu	Et	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
152	t-Bu	Et	Et	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
153	t-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
154	t-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me) -
155	t-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
156	Me	Et	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
157	Me	Et	Et	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
158	Me	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
159	Me	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
160	Me	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
161	Et	Et	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
162	Et	Et	Et	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
163	Et	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
164	Et	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
165	Et	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
166	i-Pr	Et	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
167	i-Pr	Et	Et	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
168	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
169	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
170	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
171	n-Pr	Et	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
172	n-Pr	Et	Et	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
173	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
174	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
175	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
176	n-Bu	Et	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
177	n-Bu	Et	Et	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH (Me) -
178	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
179	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
180	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
181	t-Bu	Et	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
182	t-Bu	Et	Et	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
183	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
184	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
185	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	-CH(Me)-
186	Me	Et	Me	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
187	Me	Et	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
188	Me	Et	i-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
189	Me	Et	n-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
190	Me	Et	n-Bu	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
191	Et	Et	Me	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
192	Et	Et	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
193	Et	Et	i-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
194	Et	Et	n-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
195	Et	Et	n-Bu	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
196	i-Pr	Et	Me	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
197	i-Pr	Et	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
198	i-Pr	Et	i-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
199	i-Pr	Et	n-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
200	i-Pr	Et	n-Bu	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
201	n-Pr	Et	Me	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
202	n-Pr	Et	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
203	n-Pr	Et	i-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
204	n-Pr	Et	n-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
205	n-Pr	Et	n-Bu	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
206	n-Bu	Et	Me	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
207	n-Bu	Et	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
208	n-Bu	Et	i-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
209	n-Bu	Et	n-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
210	n-Bu	Et	n-Bu	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
211	t-Bu	Et	Me	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
212	t-Bu	Et	Et	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
213	t-Bu	Et	i-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
214	t-Bu	Et	n-Pr	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
215	t-Bu	Et	n-Bu	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
216	Me	Et	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
217	Me	Et	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
218	Me	Et	i-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
219	Me	Et	n-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
220	Me	Et	n-Bu	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
221	Et	Et	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
222	Et	Et	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
223	Et	Et	i-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
224	Et	Et	n-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
225	Et	Et	n-Bu	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
226	i-Pr	Et	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
227	i-Pr	Et	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
228	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
229	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
230	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
231	n-Pr	Et	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
232	n-Pr	Et	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
233	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
234	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
235	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
236	n-Bu	Et	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
237	n-Bu	Et	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
238	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
239	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
240	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
241	t-Bu	Et	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
242	t-Bu	Et	Et	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
243	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
244	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
245	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
246	Me	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
247	Me	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
248	Me	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
249	Me	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
250	Me	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
251	Et	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
252	Et	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
253	Et	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
254	Et	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
255	Et	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
256	i-Pr	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
257	i-Pr	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
258	i-Pr	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
259	i-Pr	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
260	i-Pr	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
261	n-Pr	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
262	n-Pr	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
263	n-Pr	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
264	n-Pr	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
265	n-Pr	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
266	n-Bu	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
267	n-Bu	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
268	n-Bu	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
269	n-Bu	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
270	n-Bu	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
271	t-Bu	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
272	t-Bu	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
273	t-Bu	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
274	t-Bu	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
275	t-Bu	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
276	Me	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
277	Me	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
278	Me	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
279	Me	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
280	Me	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me)-
281	Et	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
282	Et	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
283	Et	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
284	Et	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -

ES 2 401 924 T3

Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	-A-
285	Et	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
286	i-Pr	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
287	i-Pr	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
288	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
289	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
290	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
291	n-Pr	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH (Me) -
292	n-Pr	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
293	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
294	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
295	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
296	n-Bu	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
297	n-Bu	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
298	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
299	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
300	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
301	t-Bu	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
302	t-Bu	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me) -
303	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
304	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
305	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO ₂ Me	-CH(Me)-
306	Me	H	Et	Me	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH(Me)-
307	Et	H	Et	Me	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH(Me)-
308	n-Pr	H	Et	Me	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH (Me) -
309	i-Pr	H	Et	Me	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH(Me)-
310	Me	H	Et	Cl	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH(Me)-
311	Et	H	Et	Cl	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH (Me) -
312	n-Pr	H	Et	Cl	CH ₂ OCH (Me) ₂	SO ₂ Me	-CH (Me) -
313	i-Pr	H	Et	Cl	CH ₂ OCH(Me) ₂	SO ₂ Me	-CH(Me) -

Tabla 2

Núm.	RMN H ¹ δ ppm (disolvente: CDCl ₃ , aparato de medición: JEOL-GSX (400 MHz))
1	1,78 (3H, d, J = 5,6 Hz), 2,36 (3H, s), 3,10 (3H, s), 3,48 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,74 (3H, s), 3,82 (2H, m), 4,26 (2H, m), 6,73 (1H, m), 7,27 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,30 (1H, s), 7,90 (1H, d, J = 8,4 Hz).
2	1,26 (3H, t, J = 7,1 Hz), 1,78 (3H, d, J = 5,0 Hz), 2,36 (3H, s), 3,31 (3H, s), 3,47 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,81 (2H, m), 4,14 (2H, c, J = 7,1 Hz), 4,25 (2H, m), 6,72 (1H, c, J = 5,0 Hz), 7,27 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,30 (1H, s), 7,90 (1H, d, J = 8,0 Hz).
3	1,19 (3H, t, J = 7,0 Hz), 1,36 (3H, t, J = 7,2 Hz), 1,72 (3H, d, J = 5,2 Hz), 2,31 (3H, s), 3,25 (3H, s), 3,41 (3H, s), 3,75 (2H, m), 4,00 (2H, m), 4,06 (2H, c, J = 7,2 Hz), 6,73 (1H, c, J = 5,2 Hz), 7,20 (1H, s), 7,21 (1H, d, J = 8,2 Hz), 7,83 (1H, d, J = 8,2 Hz)
4	1,22 (3H, d, J = 6,0 Hz), 1,26 (3H, d, J = 6,4 Hz), 1,77 (3H, d, J = 5,3 Hz), 2,36 (3H, s), 3,31 (3H, s), 3,48 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,82 (2H, m), 4,25 (2H, m), 4,79 (1H, m), 6,71 (1H, c, J = 5,3 Hz), 7,27 (1H,

Núm.	RMN H ¹ δ ppm (disolvente: CDCl ₃ , aparato de medición: JEOL-GSX (400 MHz))
	d, J = 8,4 Hz), 7,30 (1H, s), 7,90 (1H, d, J = 8,4 Hz).
7	1,23 (3H, t, J = 7,0 Hz), 1,76 (3H, d, J = 5,2 Hz), 2,41 (3H, s), 3,20 (3H, s), 3,48 (3H, s), 4,11 (2H, c, J = 7,0 Hz), 4,94 (2H, s), 6,72 (1H, c, J = 5,2 Hz), 7,23 (1H, s), 7,42 (1H, d, J = 7,6 Hz), 8,03 (1H, d, J = 7,6 Hz).
11	1,25 (3H, t, J = 6,8 Hz), 1,45 (3H, d, J = 5,6 Hz), 1,97 (3H, s), 2,35 (3H, s), 3,30 (3H, s), 3,48 (3H, s), 3,65 (3H, s), 3,82 (2H, t, J = 4,4 Hz), 4,13 (2H, c, J = 6,8 Hz), 4,25 (2H, t, J = 4,4 Hz), 6,23 (1H, c, J = 5,6 Hz), 7,23 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,91 (1H, d, J = 8,4 Hz)
15	1,19 (3H, t, J = 6,8 Hz), 1,71 (3H, d, J = 5,6 Hz), 2,38 (3H, s), 3,12 (3H, s), 3,64 (3H, s), 3,96 (2H, c, J = 8,0 Hz), 4,06 (2H, c, J = 6,8 Hz), 5,17 (2H, s), 6,68 (1H, c, J = 5,6 Hz), 7,21 (1H, s), 7,42 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,00 (1H, d, J = 8,0 Hz)
18	1,24 (3H, t, J = 7,0 Hz), 1,42 (6H, m), 1,77 (3H, d, J = 5,6 Hz), 2,35 (3H, s), 3,30 (3H, s), 3,46 (3H, s), 3,80 (2H, m), 4,10 (2H, c, J = 7,0 Hz), 4,23 (2H, m), 4,66 (1H, m), 6,76 (1H, c, J = 5,6 Hz), 7,25 (1H, s), 7,28 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,87 (1H, d, J = 8,0 Hz).
19	0,86 (3H, t, J = 7,2 Hz), 1,58 (2H, m), 1,71 (3H, d, J = 5,2 Hz), 2,30 (3H, s), 3,25 (3H, s), 3,42 (3H, s), 3,65 (3H, s), 3,76 (2H, m), 3,97 (2H, t, J = 6,8 Hz), 4,19 (2H, m), 6,67 (1H, c, J = 5,2 Hz), 7,20 (1H, s), 7,22 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,84 (1H, d, J = 7,6 Hz).
20	0,89 (3H, t, J = 7,2 Hz), 1,32 (2H, m), 1,57 (2H, m), 1,75 (3H, d, J = 5,2 Hz), 2,34 (3H, s), 3,29 (3H, s), 3,45 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,79 (2H, m), 4,05 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4,23 (2H, m), 6,70 (1H, c, J = 5,2 Hz), 7,25 (1H, J = 8,0 Hz), 7,27 (1H, s), 7,87 (1H, d, J = 8,0 Hz).
21	1,24 (3H, t, J = 7,6 Hz), 1,76 (3H, d, J = 5,2 Hz), 2,32 (3H, s), 3,12 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,98 (3H, s), 4,11 (2H, c, J = 7,6 Hz), 6,72 (1H, m), 7,27 (1H, s), 7,52 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,94 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ahora, se describirán los Ejemplos de Ensayo.

5 Ejemplo de Ensayo 1

Se colocó suelo de tierras altas en una maceta de 1/170.000 hectáreas, y se sembraron semillas de varias plantas. Cuando las respectivas plantas alcanzaron un estado foliar predeterminado ((1) cerreig (Echinochloa crus-galli L.): estado de 1,0 a 3,3 hojas, (2) garranchuelo (Digitaria sanguinalis L.): estado de 1,2 a 3,0 hojas, (3) almorejo verde (Setaria viridis L.): estado de 1,5 a 3,3 hojas, (4) bledo (Amaranthus retroflexus L.): estado de 0,1 a 2,0 hojas, (5) sida espinosa (Sida spinosa L.): estado de cotiledón a estado de 2,0 hojas, (6) abutilón (Abutilon theophrasti MEDIC.): estado de 0,1 a 2,0 hojas, (7) arroz (Oryza sativa L.): estado de 1,3 a 3,0 hojas, (8) maíz (Zea mays L.): estado de 2,5 a 3,4 hojas, y (9) soja (Glycine max Merr.): estado de hoja primaria a estado de 0,3 hojas), se pesaron polvos mojables o concentrados emulsionables de los compuestos de la presente invención preparados de acuerdo con un método de preparación convencional, de manera que los ingredientes activos tuvieran las cantidades prescritas, y se diluyeron con agua en una cantidad correspondiente a 500 litros por hectárea (conteniendo 0,1% en volumen de un esparcidor agrícola ("KUSARINOH", fabricado por NIHON NOHYAKU CO., LTD.)). Las disoluciones para pulverización preparadas de este modo se aplicaron para el tratamiento foliar por medio de un pulverizador pequeño.

El día 21^a después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento de las plantas respectivas, y se evaluó el efecto herbicida por medio de la inhibición de la tasa de crecimiento (%) de 0 (equivalente a la zona no tratada) a 100% (destrucción completa). Los resultados se muestran en la Tabla 3.

Tabla 3

Núm. de Compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%)									Fecha de observación
		Cerreig	Garranchuelo	Almorejo verde	Bledo	Sida espinosa	Abutilón	Arroz	Maíz	Soja	
1	7	100	90	100	100	60	100	80	0	95	21
2	7	100	95	95	100	40	95	80	0	80	21
	63	100	100	100	100	85	100	70	0	98	21
3	7	95	95	100	90	10	90	80	0	70	21
4	7	100	90	100	90	40	98	30	0	90	21
7	7	95	90	90	85	80	98	70	0	95	21
11	7	95	90	90	80	10	60	80	0	70	21
15	7	90	90	75	90	0	98	40	10	75	21
18	7	70	95	90	95	30	95	70	0	80	21
19	7	95	95	100	95	30	95	80	0	80	21
20	7	100	100	100	100	40	100	50	0	80	21
21	7	90	90	80	90	-	85	80	0	95	21

Ejemplo de Ensayo 2

- 5 Se colocó suelo de tierras altas en una maceta de 1/170.000 hectáreas, y se sembraron semillas de varias plantas (cerreig (*Echinochloa crus-galli* L.), garranchuelo (*Digitaria sanguinalis* L.), almorejo verde (*Setaria viridis* L.), bledo (*Amaranthus retroflexus* L.), sida espinosa (*Sida spinosa* L.): (6) abutilón (*Abutilon theophrasti* MEDIC.), arroz (*Oryza sativa* L.), maíz (*Zea mays* L.), y soja (*Glycine max* Merr.)). El día después de la siembra, se pesaron polvos mojables o concentrados emulsionables de los compuestos de la presente invención preparados de acuerdo con un método de preparación convencional, de manera que los ingredientes activos tuvieran las cantidades prescritas, y se diluyeron con agua en una cantidad correspondiente a 500 litros por hectárea seguido de aplicación al suelo con un pulverizador pequeño.
- 10
- 15 El día 19^º y 22^º después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento de las plantas respectivas, y se evaluó el efecto herbicida por medio de la inhibición de la tasa de crecimiento (%) de 0 (equivalente a la zona no tratada) a 100% (destrucción completa). Los resultados se muestran en la Tabla 4.

Tabla 4

20

Núm. de Compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%)									Fecha de observación
		Cerreig	Garranchuelo	Almorejo verde	Bledo	Sida espinosa	Abutilón	Arroz	Maíz	Soja	
1	250	100	100	90	100	90	100	100	0	0	19
2	250	100	100	100	100	70	60	98	0	0	21
3	250	100	100	100	100	50	80	100	0	20	19
4	250	100	100	95	95	90	70	90	0	0	20
7	250	100	90	40	80	80	70	90	0	0	21
11	250	100	100	100	100	40	70	100	0	20	19
15	250	100	100	100	100	70	100	100	0	0	19
18	250	100	100	100	100	70	100	100	0	-	22
19	250	100	100	100	100	60	98	100	0	40	19
20	250	100	100	100	100	70	100	100	0	30	19
21	250	100	100	100	100	60	90	100	0	50	19

Ejemplo de Ensayo 3

- Se colocó suelo de tierras altas en una maceta de 1/1.000.000 hectáreas, y se sembraron semillas de varias plantas. Cuando las respectivas plantas alcanzaron un estado foliar predeterminado ((1) abutilón (Abutilon theophrasti MEDIC.): estado de 3,3 a 4,3 hojas, (2) hierba de guinea (Panicum maximum L.): estado de 3,5 a 4,3 hojas, (3) almorejo verde (Setaria viridis L.): estado de 4,0 a 4,5 hojas, y (4) maíz (Zea mays L.): estado de 4,0 a 4,3 hojas, se pesaron un polvo mojable del Compuesto Núm. 2 de la presente invención, un concentrado emulsionable del siguiente Compuesto de Referencia 1 y un polvo mojable del siguiente Compuesto de Referencia 2, preparados de acuerdo con un método de preparación convencional, de manera que los ingredientes activos tuvieran las cantidades prescritas, y se diluyeron con agua en una cantidad correspondiente a 300 litros por hectárea (conteniendo 0,5% en volumen de un esparcidor agrícola (concentrado MSO, fabricado por Cognis Corporation). Las disoluciones para pulverización preparadas de este modo se aplicaron para el tratamiento foliar por medio de un pulverizador pequeño.
- El día 17^º y 22^º después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento de las plantas respectivas, y se evaluó el efecto herbicida por medio de la inhibición de la tasa de crecimiento (%) de 0 (equivalente a la zona no tratada) a 100% (destrucción completa). Los resultados se muestran en las Tablas 5 a 8.

Tabla 5

Núm. de compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%) (día 22 ^º después de la aplicación)
		Abutilón
2	15	94
Compuesto de Referencia 1	15	20
Compuesto de Referencia 2	15	40

20

Tabla 6

Núm. de compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%) (día 18 ^º después de la aplicación)
		Hierba de guinea
2	3,5	90
Compuesto de Referencia 1	3,5	0
Compuesto de Referencia 2	3,5	0

Tabla 7

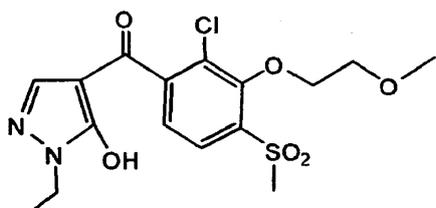
Núm. de compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%) (día 17 ^º después de la aplicación)
		Almorejo verde
2	3,5	93
	7	98
Compuesto de Referencia 1	3,5	35
	7	55
Compuesto de Referencia 2	3,5	30
	7	45

25

Tabla 8

Núm. de compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%) (día 21 ^º después de la aplicación)
-------------------	---------------------------------------	---------------------------------------------------------------------------------------

		Maíz
2	120	4
Compuesto de Referencia 2	120	28

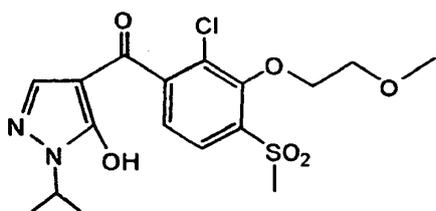
Compuesto de Referencia 1:

5

(Núm. de compuesto 1 descrito en la página 18 del documento EP 0352543A1)

Compuesto de Referencia 2:

10



15

(Núm. de compuesto 20 descrito en la página 21 del documento EP 0352543A1)

Ejemplo de Ensayo 4

Se colocó suelo de arrozal en una maceta de 1/1.000.000 hectáreas, se sembraron semillas de cerreig (*Echinochloa oryzicola* vasing.) y junco Japonés (*Scirpus juncoides*) y se cubrieron ligeramente con suelo. A continuación, la maceta se dejó estar en un invernadero en un estado irrigado a una profundidad de agua de 0,5 a 1 cm, y el día siguiente o dos días después, se plantaron tubérculos de punta de flecha enana (*Sagittaria pygmaea*). Después, se mantuvo la profundidad del agua irrigada para que fuera de 3 a 4 cm, y cuando el cerreig y el junco Japonés alcanzaron el estado de 0,5 hojas, y la punta de flecha enana alcanzó el estado de hoja primaria, se aplicó gota a gota uniformemente mediante una pipeta una disolución diluida con agua de un polvo mojable o concentrado emulsionable del compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con un método de preparación convencional, de manera que la cantidad de los ingredientes activos fuera la cantidad prescrita. Adicionalmente, se colocó suelo de arrozal en una maceta de 1/1.000.000, seguido de encharcamiento del suelo hasta una profundidad de agua irrigada de 3 a 4 cm. El día siguiente, se trasplantó arroz (*Oryza sativa* L.) (var.: Nihonbare) en el estado de dos hojas a una profundidad de trasplante de 3 cm. El 4^º día después del trasplante, se aplicó el compuesto de la presente invención de la misma manera que se ha descrito anteriormente.

El día 14^º después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento del cerreig, el junco Japonés y la punta de flecha enana, y el día 21^º después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento del arroz, y se evaluó el efecto herbicida por medio de una tasa de inhibición de crecimiento (%) de 0 (equivalente a la zona no tratada) a 100% (destrucción completa). Los resultados se muestran en la Tabla 9.

35

Tabla 9

Núm. de Compuesto	Cantidad de ingrediente activo (g/ha)	Tasa de inhibición del crecimiento (%)			
		Cerreig	Junco Japonés	Punta de flecha enana	Arroz
1	63	100	70	98	30
2	63	100	60	95	50
3	63	100	95	90	40
4	63	100	95	90	50
7	63	100	70	60	70
11	63	98	100	60	60
15	63	100	60	-	10
18	63	100	90	90	0
19	63	100	95	95	20
20	63	100	80	-	50
21	63	100	70	70	10

Ahora, se describirán los Ejemplos de formulación de la presente invención.

5 Ejemplo de formulación 1

- (1) El compuesto de la presente invención 75 partes en peso
 (2) Geroon T-77 (nombre de fábrica, fabricado por Rhone-Poulenc) 14,5 partes en peso
 (3) NaCl 10 partes en peso
 (4) Dextrina 0,5 partes en peso Los componentes anteriores se colocan en una granuladora de alta velocidad, se mezclan con 20 % en peso de agua, se granulan, y se secan para obtener gránulos dispersables en agua.

15 Ejemplo de formulación 2

- (1) Caolín 78 partes en peso
 (2) Laveline FAN (nombre de fábrica, fabricado por DAI-ICHI KOGYO SEIYAKU CO., LTD.) 2 partes en peso
 (3) Sorpol 5039 (nombre de fábrica, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 5 partes en peso
 (4) Carplex (nombre de fábrica, fabricado por DSL. Japan Co., Ltd.) 15 partes en peso

La mezcla de los anteriores componentes (1) a (4) y el compuesto de la presente invención se mezclan a una razón en peso de 9:1 para obtener un polvo mojado.

25 Ejemplo de formulación 3

- (1) Hi-Filler No. 10 (nombre de fábrica, fabricado por Matsumura Sangyo Co., Ltd.) 33 partes en peso
 (2) Sorpol 5050 (nombre de fábrica, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 3 partes en peso
 (3) Sorpol 5073 (nombre de fábrica, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 4 partes en peso
 (4) El compuesto de la presente invención 60 partes en peso

Los anteriores compuestos (1) a (4) se mezclan para obtener un polvo mojado.

35 Ejemplo de formulación 4

- (1) El compuesto de la presente invención 4 partes en peso
 (2) Bentonita 30 partes en peso
 (3) Carbonato de calcio 61,5 partes en peso
 (4) Toxanon GR-31A (nombre de fábrica, fabricado por Sanyo Chemical Industries Co., Ltd.) 3 partes en peso
 (5) Lignosulfonato de calcio 1,5 partes en peso

El componente (1) pulverizado y los componentes (2) y (3) se mezclan preliminarmente, y a continuación se mezclan con estos los componentes (4) y (5) y agua. La mezcla se extrude y se granula, seguido de secado y tamizado para obtener gránulos.

5 **Ejemplo de formulación 5**

- (1) El compuesto de la presente invención 30 partes en peso
- (2) Zieclite (nombre de fábrica, fabricado por Zieclite Co., Ltd.) 60 partes en peso
- (3) New Kalgen WG-1 (nombre de fábrica, fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) 5 partes en peso
- (4) New Kalgen FS-7 (nombre de fábrica, fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) 5 partes en peso

Los componentes (1), (2) y (3) se mezclan y se hacen pasar a través de un pulverizador, y a continuación se añade a esto el componente (4). La mezcla se amasa y a continuación se extrude y se granula, seguido de secado y tamizado para obtener gránulos dispersables en agua.

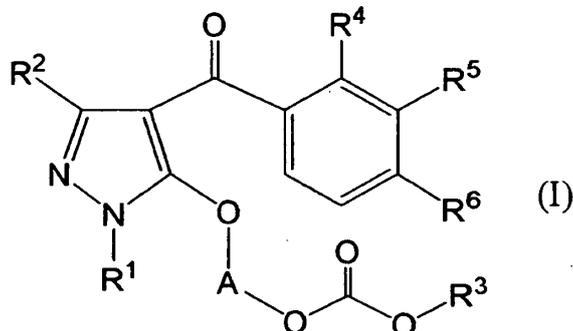
15 **Ejemplo de formulación 6**

- (1) El compuesto de la presente invención 28 partes en peso
- (2) Soprophor FL (nombre de fábrica, fabricado por Rhone-Poulenc) 2 partes en peso
- (3) Sorpol 335 (nombre de fábrica, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 1 parte en peso
- (4) IP solvent 1620 (nombre de fábrica, fabricado por Idemitsu Petrochemical Co., Ltd.) 32 partes en peso
- (5) Etilenglicol 6 partes en peso
- (6) Agua 31 partes en peso

Los componentes anteriores (1) a (6) se mezclan y se pulverizan mediante una máquina de trituración en mojado (Dyno-mill) para obtener un concentrado en suspensión con una base acuosa.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de benzoilpirazol representado por la fórmula (I) o su sal:

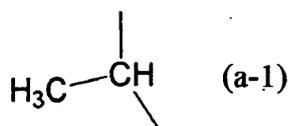


5 en donde R¹ es alquilo, R² es un átomo de hidrógeno o alquilo, R³ es alquilo, R⁴ es alquilo o halógeno, R⁵ es alquilo sustituido con un Y¹, haloalcoxi, alcoxi sustituido con un Y², o alcocarbonilo, R⁶ es alquilsulfonilo, A es alquileno sustituido al menos con un alquilo, Y¹ es alcoxi o haloalcoxi, e Y² es alcoxi.

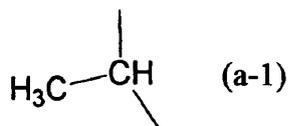
10 2. El compuesto de benzoilpirazol o su sal de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R¹ es alquilo, R² es un átomo de hidrógeno o alquilo, R³ es alquilo, R⁴ es alquilo, R⁵ es alquilo sustituido con un Y¹, alcoxi sustituido con un Y², o alcocarbonilo, R⁶ es alquilsulfonilo, A es alquileno sustituido con un alquilo, Y¹ es alcoxi o haloalcoxi, e Y² es alcoxi.

15 3. El compuesto de benzoilpirazol o su sal de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde R² es un átomo de hidrógeno, y R⁵ es alcoxi sustituido con un alcoxi.

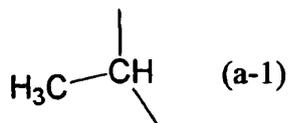
20 4. El compuesto de benzoilpirazol o su sal de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es metilo, R⁴ es metilo, R⁵ es 2-metoxietoxi, R⁶ es metilsulfonilo, y A está representado por la fórmula (a-1) :



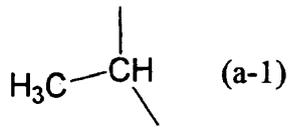
25 5. El compuesto de benzoilpirazol o su sal de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es etilo, R⁴ es metilo, R⁵ es 2-metoxietoxi, R⁶ es metilsulfonilo, y A está representado por la fórmula (a-1) :



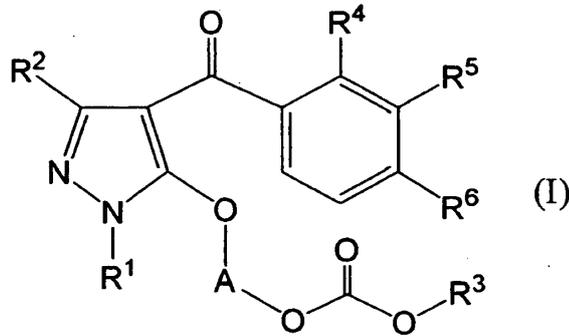
30 6. El compuesto de benzoilpirazol o su sal de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es isopropilo, R⁴ es metilo, R⁵ es 2-metoxietoxi, R⁶ es metilsulfonilo, y A está representado por la fórmula (a-1) :



35 7. El compuesto de benzoilpirazol o su sal de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde R¹ es metilo, R² es un átomo de hidrógeno, R³ es etilo, R⁴ es metilo, R⁵ es metoximetilo, R⁶ es metilsulfonilo, y A está representado por la fórmula (a-1) :



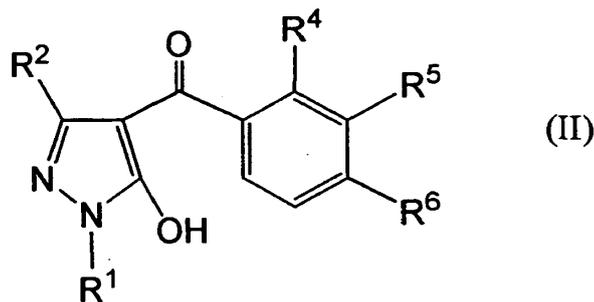
8. Un procedimiento para producir un compuesto de benzoilpirazol representado por la fórmula (I) o su sal:



5

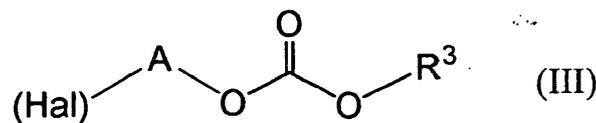
en donde R¹ es alquilo, R² es un átomo de hidrógeno o alquilo, R³ es alquilo, R⁴ es alquilo o halógeno, R⁵ es alquilo sustituido con un Y¹, haloalcoxi, alcoxi sustituido con un Y², o alcóxycarbonilo, R⁶ es alquilsulfonilo, A es alquileno sustituido al menos con un alquilo, Y¹ es alcoxi o haloalcoxi, e Y² es alcoxi, que comprende hacer reaccionar un

10



en donde R¹, R², R⁴, R⁵ y R⁶ se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula (III):

15



en donde Hal es halógeno, y R³ y A se definen como antes.

9. Un herbicida que contiene el compuesto de benzoilpirazol o su sal como se ha definido en la Reivindicación 1 como ingrediente activo.

20

10. Un método para controlar plantas no deseadas o inhibir su crecimiento, que comprende aplicar una cantidad eficaz como herbicida del compuesto de benzoilpirazol o su sal como se ha definido en la Reivindicación 1 a las plantas no deseadas o al lugar en el que crecen.

25