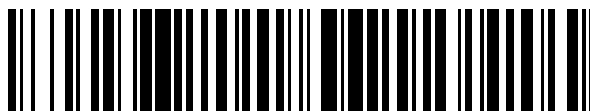


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 528 936**

51 Int. Cl.:

**C07D 307/60** (2006.01)

**C07D 307/64** (2006.01)

**C07D 407/12** (2006.01)

**A01N 43/08** (2006.01)

**A01N 47/18** (2006.01)

**A01N 47/20** (2006.01)

**A01P 13/02** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.03.2011 E 11765614 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.01.2015 EP 2562171**

54 Título: **Derivados de carbamatos estimuladores de la germinación y procedimientos para su preparación**

30 Prioridad:

**31.03.2010 JP 2010082370**

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

**13.02.2015**

73 Titular/es:

**NATIONAL UNIVERSITY CORPORATION KOBE UNIVERSITY (50.0%)**

**1-1 Rokkodai-cho Nada-ku**

**Kobe-shi, Hyogo 657-8501, JP y**

**SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LIMITED (50.0%)**

72 Inventor/es:

**SASAKI, MITSURU;**

**SUGIMOTO, YUKIHIRO;**

**TAKIKAWA, HIROSATO;**

**MIYAKE, HIDEYOSHI y**

**MATSUO, NORITADA**

74 Agente/Representante:

**UNGRÍA LÓPEZ, Javier**

ES 2 528 936 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

**Derivados de carbamatos estimuladores de la germinación y procedimientos para su preparación**5 **Campo técnico**

La presente solicitud se presenta reivindicando la prioridad de la Solicitud de Patente Japonesa Núm. 2010-082370.

10 La presente invención se refiere a un nuevo derivado de carbamato, a un procedimiento para la preparación del mismo, y a un agente para el control de una planta parásita de la raíz que comprende dicho compuesto como ingrediente activo.

**Técnica anterior**

15 *Striga* y *Orobancha* son plantas parásitas de la raíz, que crecen sobre cultivos agrícolas tales como cultivos de leguminosas y cereales como anfitrión. *Striga* se distribuye en regiones semiáridas de las regiones tropicales y subtropicales de África y el sur de Asia, y crece en los principales cultivos agrícolas tales como el sorgo y el maíz como anfitrión. *Orobancha* se encuentra ampliamente distribuida en las regiones mediterráneas y de Oriente Medio centrada en las zonas templadas y subárticas, y crece sobre cultivos de leguminosas y similares como anfitrión. Las plantas parásitas de la raíz parasitan las raíces de los cultivos agrícolas, y arrebatan nutrientes y agua de los cultivos agrícolas. Como resultado, el crecimiento de los cultivos agrícolas resulta inhibido. Por consiguiente, las plantas parásitas de la raíz causan grandes daños a la agricultura, y tal daño se ha extendido recientemente a Europa y Australia.

25 Con el fin de evitar que sean parásitas en las raíces de los cultivos agrícolas, se necesita destruir las semillas de las plantas parásitas de la raíz en el suelo del campo antes de la siembra de cultivos agrícolas en el campo.

30 Se sabe que las semillas de plantas parásitas de la raíz germinan en las proximidades de un anfitrión, y no sobreviven varios días después de la germinación de las semillas cuando pueden parasitar las raíces de un anfitrión. Por lo tanto, si la germinación de las semillas de plantas parásitas de la raíz puede ser inducida en terrenos agrícolas antes de la siembra de los cultivos agrícolas, es decir, en ausencia de los cultivos agrícolas, se pueden destruir las semillas germinadas de plantas parásitas de la raíz, y por lo tanto se puede controlar la inhibición del crecimiento de los cultivos agrícolas por las plantas parásitas de la raíz.

35 Hasta ahora, se ha informado sobre algunos compuestos capaces de inducir la germinación de semillas de plantas parásitas de la raíz (véanse las Bibliografías no de Patente 1 y 2).

**Lista de citas**40 **Bibliografía no de patente**

Bibliografía no de Patente 1: C.E. Cook, L.P. Whichard, B. Turner, M.E. Wall, G.H. Egley, Science, 1966, 154, 1189-1190

45 Bibliografía no de Patente 2: Y. Sugimoto, S.C.M. Wigchert, J.W.J.F. Thuring, B. Zwanenburg, Journal of Organic Chemistry, 1998, 63, 1259-1267

Bibliografía no de Patente 3: KONDO, Y. et al.: "Synthesis and seed germination stimulating activity of some imino analogs of strigolactones", BIOSCIENCE, BIOTECHNOLOGY, AND BIOCHEMISTRY, vol. 71, núm. 11, 2007, páginas 2781-2786

50

**Compendio de la invención****Problema técnico**

55 Un objeto de la presente invención es proporcionar un nuevo compuesto capaz de germinar semillas de plantas parásitas de la raíz.

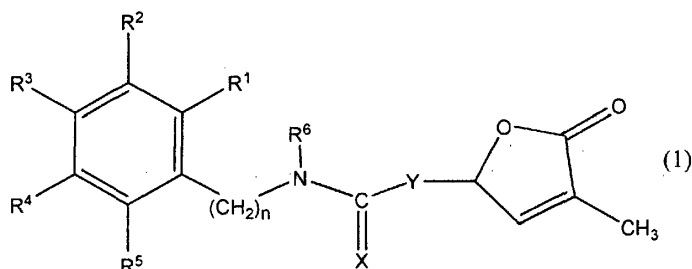
**Solución al Problema**

60 Los autores de la presente invención han estudiado intensamente con el objetivo de nuevos compuestos capaces de inducir la germinación de semillas de plantas parásitas de raíces y finalmente encontraron que los siguientes derivados de carbamato son eficaces para germinar semillas de plantas parásitas de raíz. De este modo, se ha completado la presente invención.

A saber, la presente invención se refiere a los siguientes:

A saber, la presente invención incluye los siguientes:

5 [1] Un compuesto representado por la fórmula (1):



10 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, o un grupo alcoxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,

15 R<sup>6</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,  
X e Y son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, y n representa un número entero de 0, 1 o 2 (en lo sucesivo referido como "el compuesto de la presente invención);

20 [2] El compuesto de acuerdo con el apartado [1] anterior, en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior;

[3] El compuesto de acuerdo con el apartado [1] anterior, en donde R<sup>1</sup> es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, R<sup>2</sup> es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, y R<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno;

25 [4] El compuesto de acuerdo con el apartado [2] anterior, en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo metilendioxi, y R<sup>6</sup> es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

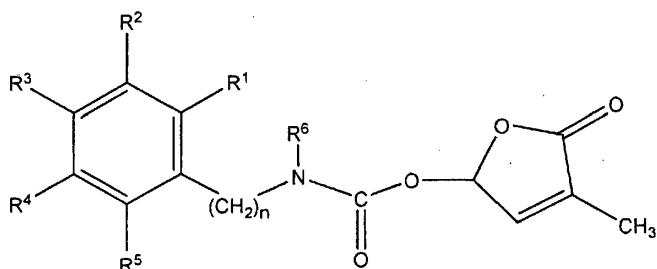
[5] El compuesto de acuerdo con el apartado [1] anterior, en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno;

30 [6] El compuesto de acuerdo con el apartado [5] anterior, en donde R<sup>6</sup> es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

[7] El compuesto de acuerdo con cualquiera de los apartados [1] - [6] anteriores, en donde X e Y son átomos de oxígeno;

35 [8] El compuesto de acuerdo con el apartado [1] anterior, que es bencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, metil(fenil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, o bencil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo;

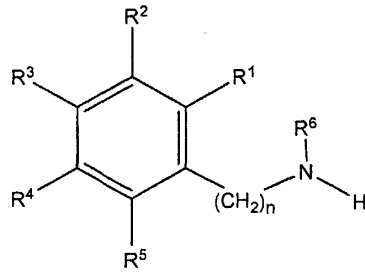
[9] Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



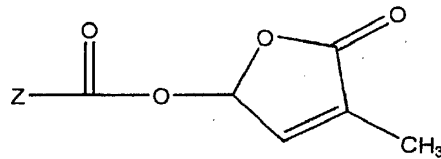
40 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, o un grupo alcoxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,

45 R<sup>6</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, y  
n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado

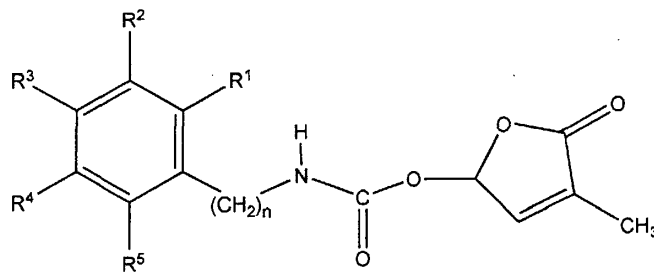
por la fórmula:



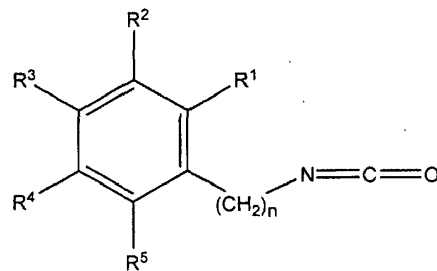
5 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula:



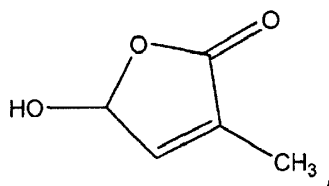
10 en donde Z representa un átomo de halógeno, en presencia de una base;  
[10] Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



15 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un  
átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, o un grupo alcoxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos entre sí para  
formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un  
anillo de benceno, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto  
con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, y  
20 n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado  
por la fórmula:

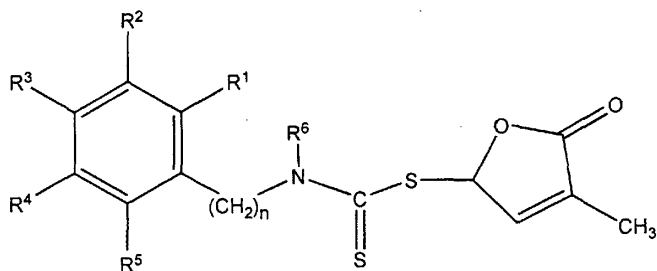


25 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y n se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula:

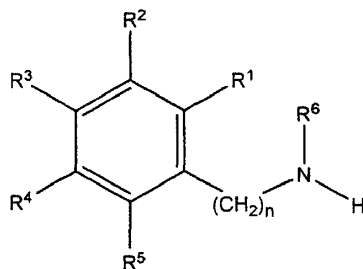


en presencia de una base;

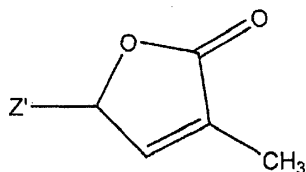
[11] Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



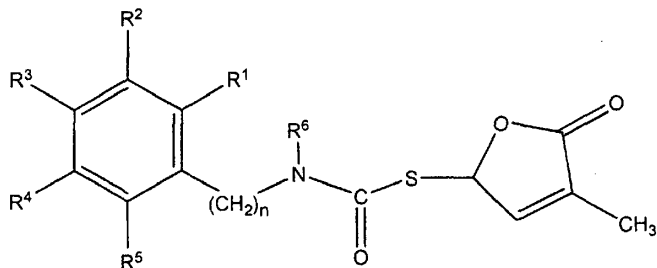
5 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, o un grupo alcoxi inferior, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,  
 10  $R^6$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, y  $n$  representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:



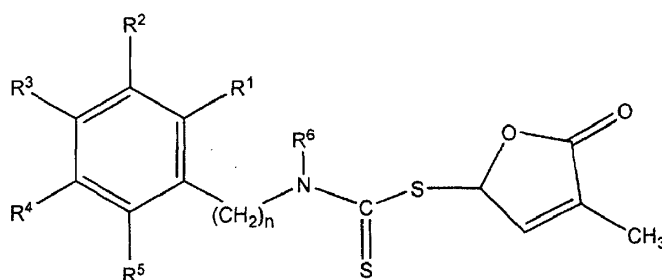
15 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes, con disulfuro de carbono en presencia de una base, y después haciendo reaccionar el compuesto resultante con un compuesto representado por la fórmula:



20 en donde  $Z'$  representa un átomo de cloro o un átomo de bromo;  
 [12] Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:

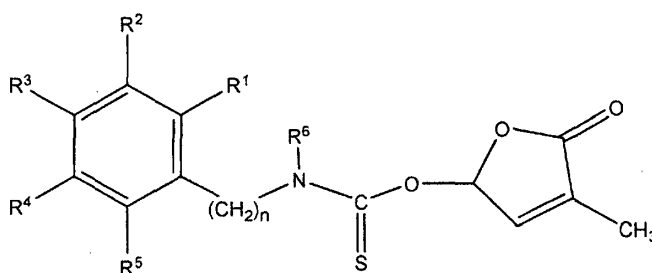


25 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, o un grupo alcoxi inferior, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,  
 30  $R^6$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, y  $n$  representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:



en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes, con un agente de oxidación;  
 [13] Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:

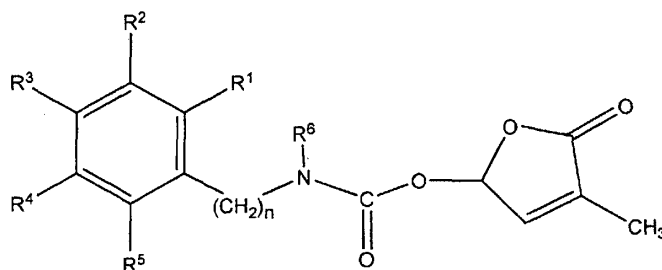
5



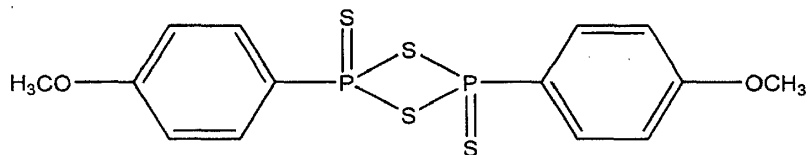
en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, o un grupo alcoxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, R<sup>6</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior, y n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:

10

15



en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula:



20

en un disolvente orgánico;

[14] Un agente para el control de una planta parásita de la raíz que comprende el compuesto de acuerdo con una cualquiera de los apartados [1] a [8] anteriores como ingrediente activo;

25

[15] Un método para controlar una planta parásita de la raíz, que comprende aplicar una cantidad eficaz del compuesto de acuerdo con una cualquiera de los apartados [1] a [8] anteriores para un terreno agrícola antes de sembrar un cultivo agrícola; y

[16] El uso del compuesto de acuerdo con una cualquiera de las anteriores [1] a [8] como un agente para el control de una planta parásita de la raíz.

30 **Efecto de la Invención**

El compuesto de la presente invención puede inducir la germinación de semillas de plantas parásitas de la raíz en la ausencia de un anfitrión. En la ausencia de un anfitrión, las plantas parásitas de la raíz después de la germinación son destruidas debido a la falta de nutrientes. Por lo tanto, el compuesto de la presente invención puede controlar plantas parásitas de raíz.

5

**Descripción de las realizaciones**

Los ejemplos del átomo de halógeno representado por R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> o R<sup>5</sup> incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, y un átomo de bromo.

10

Los ejemplos del grupo alquilo inferior representado por R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> o R<sup>5</sup> incluyen un grupo alquilo C1-C4, específicamente un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo y un grupo n-butilo, preferiblemente un grupo metilo.

15

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior representado por R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> o R<sup>5</sup> incluyen un grupo alcoxi C1-C4, específicamente un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, y un grupo n-butoxi.

Cuando R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, los ejemplos del grupo alquilendioxi inferior incluyen un grupo alquilendioxi C1-C2.

20

Cuando R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi inferior, los ejemplos del grupo alquilendioxi inferior incluyen un grupo alquilendioxi C1-C2.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior representado por R<sup>6</sup> incluyen un grupo alquilo C1-C4, específicamente un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, y un grupo n-butilo, preferiblemente un grupo metilo.

25

El compuesto de la presente invención incluye sustancias ópticamente activas debido a un carbono asimétrico en la posición 5 de la butenolida.

30

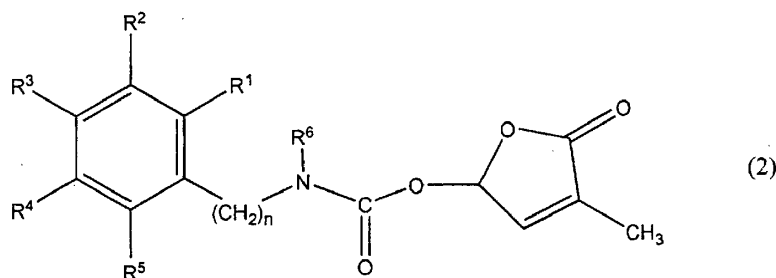
En el contexto de la invención, los ejemplos del átomo de halógeno representado por Z incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro y un átomo de bromo.

El compuesto de la presente invención puede producirse por medio de los siguientes métodos de producción.

35

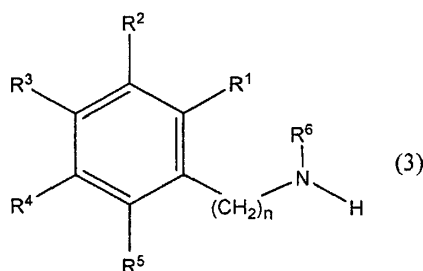
**Método de producción 1**

Entre los compuestos de la presente invención, un compuesto representado por la fórmula (2):



40

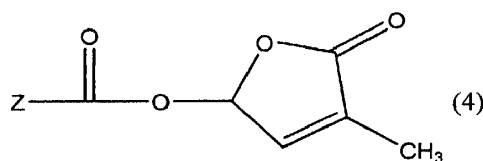
en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes (el compuesto (2)), puede ser producido haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (3):



45

en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes (compuesto (3)), con un compuesto representado por la

fórmula (4):



5 en donde Z representa un átomo de halógeno (compuesto (4)), en presencia de una base.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio y carbonato de potasio, y bases orgánicas tales como trietilamina, N,N-dietilnilina y piridina.

10 La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente orgánico. Los ejemplos del disolvente orgánico incluyen compuestos aromáticos tales como benceno y tolueno, compuestos éter tales como éter dietílico y tetrahidrofurano y compuestos de cloro tales como diclorometano y cloroformo.

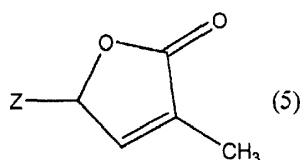
15 La temperatura de reacción y el tiempo de reacción varían dependiendo del tipo de la base o del disolvente orgánico que se vayan a utilizar. La temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente -70 a 100°C, preferiblemente de 0 a 50°C, y el tiempo de reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 48 horas, preferiblemente alrededor de 5 a 24 horas.

20 La cantidad del compuesto (4) que se va a utilizar en la reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 5 cantidades equivalentes, preferiblemente de 1 a 2 cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (3).

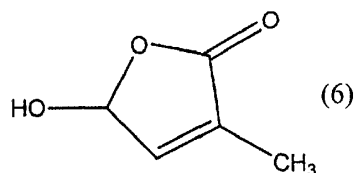
25 La cantidad de la base a utilizar en la reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 5 cantidades equivalentes, preferiblemente de aproximadamente 1 a 2 cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (3).

Después de la finalización de la reacción, se lleva a cabo un post-tratamiento, generalmente, para obtener el compuesto objetivo (2).

30 El compuesto (3) que es un material de partida para el método de producción 1 puede estar disponible comercialmente o ser sintetizado mediante la reducción de la correspondiente amida de una manera general. El compuesto (4) puede ser producido hidrolizando un compuesto representado por la fórmula (5):



35 en donde Z representa un átomo de halógeno (compuesto (5)), que es producido por un método descrito en, por ejemplo, E.M. Mungnus, B. J. Zwanenburg, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 1992, 49, 1066-1070 para obtener un compuesto representado por la fórmula (6):

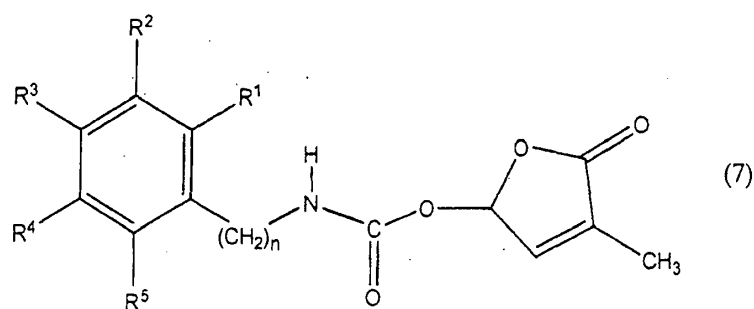


40 (compuesto (6)), y después haciendo reaccionar el compuesto (6) con fosgeno.

Método de producción 2

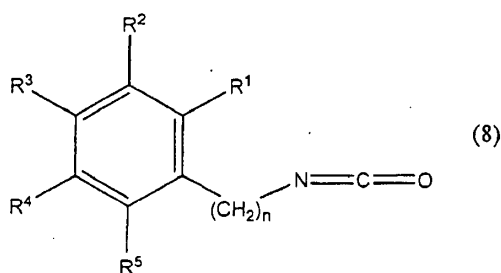
45 Entre los compuestos de la presente invención, un compuesto representado por la fórmula (7):





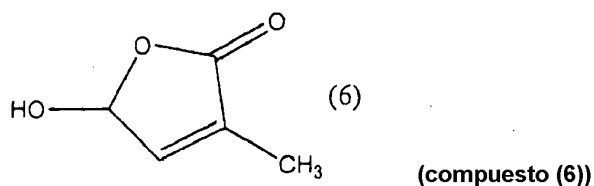
en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y  $n$  se definen como antes (compuesto (7)), puede ser producido haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (8):

5



en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y  $n$  se definen como antes (compuesto (8)), con 3-metil-5-hidroxi-butenolida, es decir, un compuesto representado por la fórmula (6):

10



en presencia de una base.

15 Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, N,N-dietilanilina y piridina.

20 La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente orgánico. Los ejemplos del disolvente orgánico incluyen compuestos aromáticos tales como benceno y tolueno; compuestos etéricos tales como éter dietílico, éter diisopropílico y tetrahidrofurano, y compuestos de cloro tales como diclorometano y cloroformo.

25 La temperatura de reacción y el tiempo de reacción varían dependiendo del tipo de la base o del disolvente orgánico que se vayan a utilizar. La temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente  $-70$  a  $50^\circ\text{C}$ , preferiblemente de  $0$  a  $30^\circ\text{C}$ , y la temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente  $1$  a  $48$  horas, preferiblemente de aproximadamente  $5$  a  $24$  horas.

30 La cantidad del compuesto (6) que se va a utilizar en la reacción es generalmente de aproximadamente  $1$  a  $5$  cantidades equivalentes, preferiblemente de  $1$  a  $2$  cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (8).

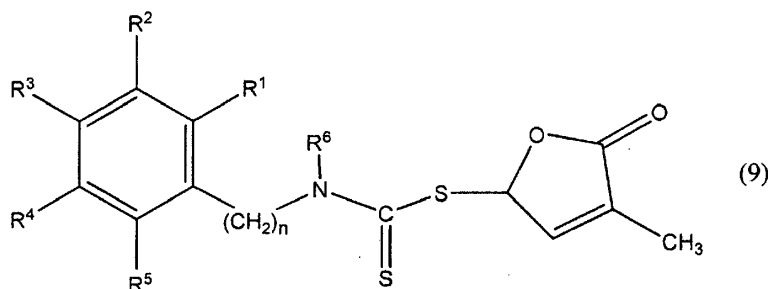
La cantidad de la base que se va a utilizar en la reacción es generalmente de aproximadamente  $0,01$  a  $0,5$  cantidades equivalentes, preferiblemente de aproximadamente  $0,05$  a  $0,2$  cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (8).

35 Después de la finalización de la reacción, se lleva a cabo generalmente un post-tratamiento para obtener el compuesto objetivo (7).

40 El compuesto (8) que es una sustancia de partida para el método de producción 2 puede ser asequible comercialmente o sintetizado mediante la conversión de la amina correspondiente en el isocianato con fosgeno de una manera general.

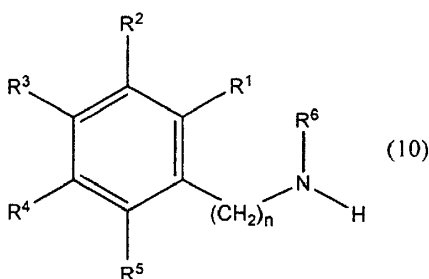
## Método de producción 3

Entre los compuestos de la presente invención, un compuesto representado por la fórmula (9):



5

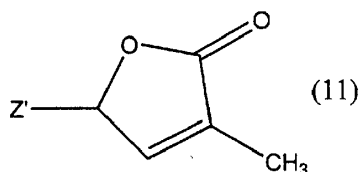
en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes (el compuesto (9)), puede ser producido haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (10):



10

en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes (compuesto (10)), con disulfuro de carbono en presencia de una base (primera reacción), y después haciendo reaccionar el producto resultante con un compuesto de fórmula (11):

15



en donde  $Z'$  representa un átomo de cloro o un átomo de bromo (compuesto (11)) (segunda reacción).

20 Los ejemplos de la base que se van a utilizar en la primera reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y carbonato de potasio, preferiblemente hidróxido de potasio.

25 La primera reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente tal como agua o un disolvente orgánico. El disolvente orgánico que se va a utilizar en la primera reacción incluye compuestos alcohólicos, tales como metanol y etanol. Es particularmente preferida una mezcla disolvente de agua y un compuesto alcohólico.

30 La temperatura de reacción y el tiempo de reacción varían dependiendo del tipo de la base o del disolvente que se vayan a utilizar. La temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente  $-20$  a  $30^\circ\text{C}$ , preferiblemente de  $0$  a  $20^\circ\text{C}$ , y el tiempo de reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 48 horas, preferiblemente de aproximadamente 5 a 24 horas.

35 La cantidad de disulfuro de carbono y de base que se va a utilizar en la primera reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 5 cantidades equivalentes, preferiblemente de aproximadamente 1 a 2 cantidades equivalentes, respectivamente, con respecto a la cantidad del compuesto (10). Un ditiocarbamato obtenido en la primera reacción no se separa y se hace reaccionar directamente con el compuesto (11) en el mismo reactor (la segunda reacción).

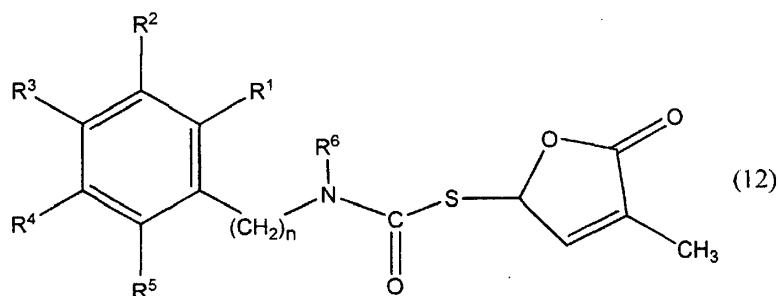
40 En la segunda reacción, la cantidad del compuesto (11) es generalmente de aproximadamente 1 a 5 cantidades equivalentes, preferiblemente de aproximadamente 1 a 2 cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (10).

La temperatura de reacción y el tiempo de reacción en la segunda reacción varían dependiendo del tipo de la base o del disolvente que se vayan a utilizar en la primera reacción. La temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente -10 a 30°C, preferiblemente de 0 a 20°C, y el tiempo de reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 48 horas, preferiblemente de aproximadamente 5 a 24 horas.

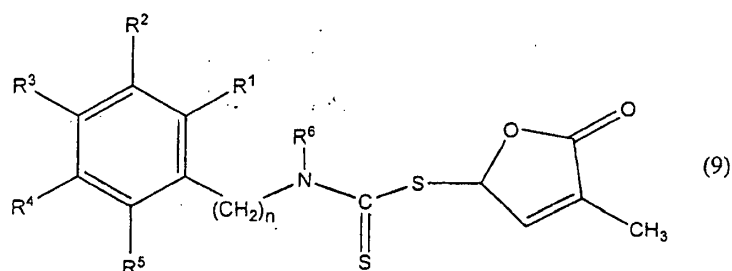
5 Después de la finalización de la reacción, se lleva a cabo generalmente un post-tratamiento para obtener el compuesto objetivo (9).

Método de producción 4

10 Entre los compuestos de la presente invención, un compuesto representado por la fórmula (12):



15 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes (compuesto (12)), se puede producir por tratamiento de un compuesto representado por la fórmula (9):



20 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes (compuesto (9)), con un agente de oxidación.

Los ejemplos del agente de oxidación que se va a utilizar en la reacción incluyen perácidos orgánicos tales como ácido peracético y ácido meta-cloroperbenzoico.

25 La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente orgánico. Los ejemplos del disolvente orgánico incluyen compuestos de cloro tales como diclorometano y cloroformo.

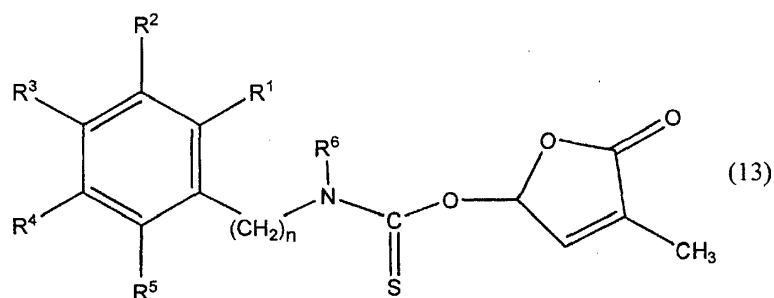
30 La temperatura de reacción y el tiempo de reacción varían dependiendo de la clase del agente de oxidación o del disolvente orgánico que se vayan a utilizar. La temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente -70 a 50°C, preferiblemente de 0 a 30°C, y el tiempo de reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 48 horas, preferiblemente de aproximadamente 5 a 24 horas.

35 La cantidad del agente de oxidación que se va a utilizar en la reacción es generalmente de aproximadamente 1 a 5 cantidades equivalentes, preferiblemente de 1 a 2 cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (9).

Después de la finalización de la reacción, se lleva a cabo generalmente un post-tratamiento para obtener el compuesto objetivo (12).

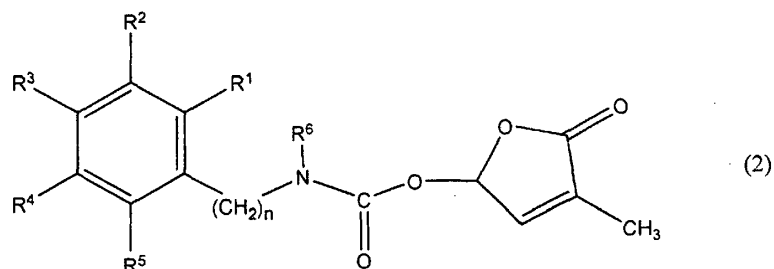
40 Método de producción 5

Entre los compuestos de la presente invención, un compuesto representado por la fórmula (13):



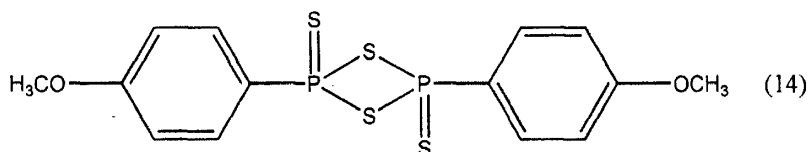
en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes (compuesto (13)), puede ser producido por reacción de un compuesto representado por la fórmula (2):

5



en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes (compuesto (2)), con un compuesto representado por la fórmula (14):

10



(Compuesto (14), reactivo de Lawesson: 2,4-disulfuro de 2,4-bis-(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano) en un disolvente orgánico.

15

Los ejemplos del disolvente orgánico que se va a utilizar en la reacción incluyen compuestos aromáticos tales como tolueno y xileno.

20

La temperatura de reacción y el tiempo de reacción varían dependiendo del tipo de disolvente orgánico que se vaya a utilizar. La temperatura de reacción es generalmente de aproximadamente 50°C a la temperatura de reflujo, preferiblemente de 100 a 120°C, y el tiempo de reacción es generalmente de aproximadamente 10 minutos a 2 horas, preferiblemente aproximadamente 30 minutos a 1 hora.

25

La cantidad de carga del compuesto (14) (es decir, el reactivo de Lawesson) que se va a utilizar en la reacción es generalmente de aproximadamente 0,5 a 2 cantidades equivalentes, preferiblemente de aproximadamente 1 a 1,5 cantidades equivalentes, con respecto a la cantidad del compuesto (2).

30

Después de la finalización de la reacción, se lleva a cabo generalmente un post-tratamiento para obtener el compuesto objetivo (13).

35

Los ejemplos del compuesto de la presente invención incluye el siguiente compuesto:

- fenilcarbamato de 9-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 2-fluorofenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- o-tolilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 2-etilfenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 2-isopropilfenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 2-terc-butilfenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 2-metoxifenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 2,3-dimetilfenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 4-metoxi-3-metilfenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo
- 3-cloro-4-metoxifenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo

40

3,5-dicloro-4-methoxifenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 benzo[d][1,3] dioxol-5-ilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 benzo[d][1,3] dioxol-4-ilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 naftalen-1-ilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 5 naftalen-2-ilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 metil(fenil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 etil(fenil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-clorofenil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 metil(o-tolil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 10 2-metoxifenil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 bencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-clorobencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-metilbencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-metoxibencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 15 2-metoxifenil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-metoxibencil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-metoxifenil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 metil(fenil)tiolcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 metil(fenil)ditiocarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 20 2-(2,3-dimetilfenil)etilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-(3,4-dimetilfenil)etilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 2-(3,4-metilendioxifenil)etilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 fenetilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo  
 bencil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo.

25 Entre los compuestos de la presente invención, los preferidos son bencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, fenetilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, metil(fenil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, y bencil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo.

30 El compuesto de la presente invención generalmente se diluye con una mezcla disolvente de agua y un disolvente orgánico tal como alcoholes (p. ej., metanol y etanol) y cetonas (p. ej., acetona y metil-etil-cetona), y se aplica a semillas de plantas parásitas de la raíz, o terrenos agrícolas que contienen semillas de plantas parásitas de la raíz, antes de la siembra de cultivos agrícolas.

35 Mediante la aplicación del compuesto de la presente invención, es posible germinar semillas de plantas parásitas de la raíz en ausencia de fuentes de nutrientes y por lo tanto destruir las plantas parásitas de la raíz, es decir, controlar las plantas parásitas de la raíz. Por lo tanto, es posible controlar la inhibición del crecimiento de los cultivos agrícolas por las plantas parasíticas de la raíz.

40 Los ejemplos de los terrenos agrícolas incluyen aquellos en los que se producen plantas leguminosas, sorgo, o cereales.

Los ejemplos de las plantas parásitas de la raíz que se van a controlar por medio del compuesto de la presente invención incluyen aquellas que pertenecen al género *Striga*, el género *Orobanch*e, y el género *Alectra*.

## 45 Ejemplos

De aquí en adelante, la presente invención se describe específicamente por medio de ejemplos de producción y ejemplos de ensayo a los que no está limitada la presente invención.

### 50 Ejemplo de Producción 1

Síntesis de fenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 1)

55 En éter diisopropílico (10 ml), se agitó 3-metil-5-hidroxi-butenolida (0,800 g, 7,01 mmoles), y a esto se le añadió con agitación trietilamina (5 a 6 gotas), seguido de isocianato de fenilo (0,700 g, 5,85 mmoles). A continuación, la mezcla se agitó durante la noche. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se sofocó con ácido clorhídrico 1 M, se extrajo con éter dietílico, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,05 g).

Sólido cristalino, p. f. 112-115°C

60 RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ ):  $\delta$  = 2,00-2,01 (m, 3H), 6,92-6,96 (s, 1H), 7,25-7,36 (m, 6H)

### Ejemplo de Producción 2

## Síntesis de bencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 2)

En éter diisopropílico (10 ml) se disolvió 3-metil-5-hidroxi-butenolida (1,14 g, 10,0 mmoles), y a esto se añadieron trietilamina (3 gotas) e isocianato de bencilo (1,33 g, 10,0 mmoles). Después, la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con una solución saturada de cloruro de amonio, se extrajo con acetato de etilo, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,98 g).

Sólido cristalino, p. f. 72-75°C

RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1,93\text{-}1,97$  (m, 3H), 4,40-4,42 (m, 2H), 5,23 (s, 1H), 6,86-6,90 (m, 1H), 7,26-7,38 (m, 6H)

## Ejemplo de Producción 3

## Síntesis de fenetilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 3)

En éter diisopropílico (5 ml) se disolvió 3-metil-5-hidroxi-butenolida (0,44 g, 3,83 mmoles), y a esto se añadieron trietilamina (3 gotas) y fenetilisocianato (0,56 g, 3,83 mmoles). Después, la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con una solución saturada de cloruro de amonio, se extrajo con acetato de etilo, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,34 g).

Sólido cristalino, p. f. 64-66°C

RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1,92$  (s, 3H), 2,82-2,87 (m, 2H), 3,42-3,56 (m, 2H), 4,85 (s, 1H), 6,83-6,87 (m, 1H), 7,18-7,34 (m, 6H)

## Ejemplo de Producción 4

## Síntesis de metil(fenil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 4)

En diclorometano seco (5 ml), se agitó 3-metil-5-hidroxi-butenolida (0,52 g, 4,53 mmoles), y a esto se le añadió N,N-dietilanilina (0,68 g, 4,53 mmoles). Después, la mezcla se agitó durante 10 minutos. A esto se le añadió trifosgeno (0,450 g, 1,51 mmoles), y la mezcla se agitó durante 2 horas. A esta solución de reacción se le añadió N-metil-anilina (0,430 g, 4,05 mmoles), y después la mezcla se hizo reaccionar con agitación durante la noche. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con ácido clorhídrico 1 M, se lavó con agua, se extrajo con éter de dimetilo, y después se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,23 g).

Sólido cristalino, p. f. 69-71°C

RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1,93$  (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 6,92 (s, 1H), 7,22-7,38 (m, 6H)

## Ejemplo de Producción 5

## Síntesis de bencil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 5)

Bajo una atmósfera de argón, se disolvió 3-metil-5-hidroxi-butenolida (0,52 g, 4,53 mmoles) en diclorometano (5 ml), y a esto se le añadió N,N-dietilanilina (0,73 ml, 4,53 mmoles), seguido de trifosgeno (0,45 g, 1,51 mmoles). Después, la mezcla se hizo reaccionar durante 2,5 horas. A la solución de reacción se le añadió N-bencilmetilamina (0,58 ml, 4,53 mmoles), y la mezcla se agitó durante 2 días. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con ácido clorhídrico 1 M, se extrajo con acetato de etilo, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,29 g).

Sustancia oleosa

RMN  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1,95\text{-}1,99$  (m, 3H), 2,83 (s, 3H), 4,39-4,56 (m, 2H), 6,88-6,96 (m, 1H), 7,17-7,45 (m, 6H)

## Ejemplo de Producción 6

## Síntesis de 2-fenetil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 6)

Bajo una atmósfera de argón, se disolvió 3-metil-5-hidroxi-butenolida (0,52 g, 4,53 mmoles) en diclorometano (5 ml), y a esto se le añadió N,N-dietilanilina (0,73 ml, 4,53 mmoles), seguido de trifosgeno (0,45 g, 1,51 mmoles). Después, la mezcla se hizo reaccionar durante 2,5 horas. A la solución de reacción se le añadió N-(2-fenetil)metilamina (0,62 ml, 4,53 mmoles), y después la mezcla se agitó durante 2 días. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con ácido clorhídrico 1 M, se extrajo con acetato de etilo, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y se purificó mediante una

cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,20 g).

Sustancia oleosa

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ ):  $\Delta$  = 1,95-1,99 (m, 3H), 2,90-3,00 (m, 2H), 3,03 (s, 3H), 3,60-3,75 (m, 2H), 7,17-7,45 (m, 6H), 7,52 (s, 1H)

5

Ejemplo de Producción 7

Síntesis de metil(fenil)ditiocarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 7)

10 A una solución acuosa de hidróxido de potasio al 20% (1,50 g) se le añadió de N-metilanilina (0,480 g, 4,53 mmoles), y la mezcla se agitó. A esto se le añadió gota a gota disulfuro de carbono (0,340 g, 4,53 mmoles), y la mezcla se agitó con enfriamiento con hielo durante 2,5 horas. A esto se le añadió una solución de 5-bromo-3-metilbutenolida (0,790 g, 4,53 mmoles) en tolueno, y después la mezcla se hizo reaccionar con agitación durante la noche. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con una solución acuosa saturada de cloruro de amonio, se extrajo con acetato de etilo, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y después se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,69 g).

15

Sólido cristalino, p. f. 108-110°C

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ ):  $\delta$  = 1,88-1,89 (m, 3H), 3,79 (s, 3H), 7.3 a 7.4 (m, 1H), 7,09-7,50 (m, 6H)

20

Ejemplo de Producción 8

Síntesis de metil(fenil)tiolcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 8)

25 En cloruro de metileno (3 ml), se agitó metil(fenil)ditiocarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (0,360 g, 1,29 mmoles). Se añadió ácido meta-cloroperbenzoico (0,222 g, 1,28 mmoles), y la mezcla se agitó mientras se enfriaba con hielo para que reaccionara durante 2,5 horas. Después de la finalización de la reacción, la solución de reacción se inactivó con una solución acuosa de tiosulfato de sodio, se extrajo con cloruro de metileno, y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, y después se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,03 g).

30

Sólido cristalino, p. f. 110°C

RMN  $H^1$  ( $CDCl_3$ ):  $\delta$  = 1,88-1,89 (m, 3H), 3,37-3,39 (m, 3H), 6,67-6,69 (m, 1H), 6,94-6,95 (m, 1H), 7,26-7,46 (m, 5H)

35

Ejemplo de Producción 9

Síntesis de 2-(2,3-dimetilfenil)etilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 9)

40 Bajo una atmósfera de argón, se disolvió 5-hidroxi-3-metilbutenolida (0,29 g, 2,55 mmoles) en diclorometano (3,5 ml), y a esto se le añadió N,N-dietilanilina (0,55 ml, 3,4 mmoles), seguido de trifosgeno (0,30 g, 1,0 mmoles). Después, la mezcla se hizo reaccionar durante 2 horas. A la mezcla de reacción se le añadió 2-(2,3-dimetilfenil)etilamina (0,38 g, 2,55 mmoles), y después la mezcla se agitó durante la noche. La solución de reacción se inactivó con ácido clorhídrico 1 M, y después se extrajo con diclorometano. La capa orgánica resultante se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre carbonato potásico, se concentró y después se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,10 g, rendimiento 14%).

45

Sólido de color blanco, p. f. 100-102°C

RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  1,96-1,97 (s ancho, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,89 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 3,37-3,49 (m, 2H), 4,86 (s ancho, 1H), 6,83-7,06 (m, 5H)

50

Ejemplo de Producción 10

Síntesis de 2-(3,4-dimetilfenil)etilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 10)

55 Bajo una atmósfera de argón, se disolvió 5-hidroxi-3-metilbutenolida (0,06 g, 0,53 mmoles) en diclorometano (1 ml), y a esto se le añadió N,N-dietilanilina (0,10 ml, 0,62 mmoles), seguido de trifosgeno (0,05 g, 1,8 mmoles). Después, la mezcla se hizo reaccionar durante 2 horas. A la mezcla de reacción se le añadió 2-(3,4-dimetilfenil)etilamina (0,08 g, 0,53 mmoles), y después la mezcla se agitó durante la noche. La solución de reacción se inactivó con ácido clorhídrico 1 M, y después se extrajo con diclorometano. La capa orgánica resultante se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se concentró y después se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,011 g, rendimiento del 7%).

60

Sólido de color blanco, m. p. 103-105°C

RMN  $H^1$  (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  1,96 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,77 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 3,43-3,51 (m, 2H), 4,82 (s ancho, 1H), 6,84-7,08 (m, 5H)

Ejemplo de Producción 11

Síntesis de 2-(3,4-metilendioxfenil)etilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo (Compuesto Núm. 11)

Bajo una atmósfera de argón, se disolvió 5-hidroxi-3-metilbutenolida (0,10 g, 0,876 mmoles) en éter diisopropílico (5 m), y a esto se le añadió trietilamina (0,13 ml, 0,94 mmoles), seguido de 2-(3,4-metilendioxfenil)etilisocianato (0,167 g, 0,876 mmoles). A continuación, la mezcla se agitó durante la noche. La solución de reacción se inactivó con ácido clorhídrico 1 M, y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se concentró y después se purificó mediante una cromatografía en columna para proporcionar el compuesto objetivo (0,182 g, rendimiento 68%).

Sólido de color blanco, p. f. 127-129°C

RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 5 1,97 (s, 3H), 2,76 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 3,40-3,48 (m, 2H), 4,82 (s, 1H), 5,94 (s, 2H), 6,81-6,87 (m, 5H)

Ejemplo de ensayo 1

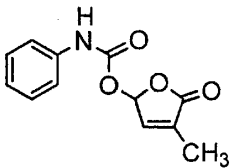
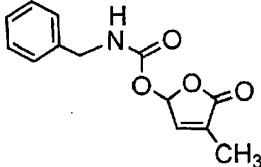
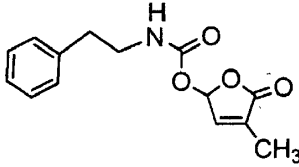
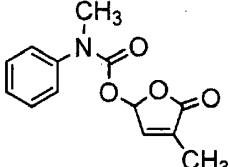
Ensayo de actividad de estimulación de la germinación en *Striga*

En primer lugar, se pesaron 10  $\mu\text{moles}$  de cada compuesto de ensayo y se disolvieron en 2 ml de acetona. Cada solución se diluyó con agua destilada para obtener una solución 10  $\mu\text{M}$ . A continuación, una parte inferior de una placa Petri se cubrió con un papel de filtro, y se colocaron en el papel de filtro semillas acondicionadas de *Striga* (*Striga hermonthica*), y a continuación se aplicaron a las semillas 20  $\mu\text{l}$  de cada solución diluida del compuesto de ensayo. Para el mantenimiento de la humedad, se preparó un papel de filtro húmedo con la condición de que las gotitas de agua no gotearan del papel de filtro, y se dobló en cuatro, y a continuación se colocó en el centro de la placa Petri. La placa Petri se selló con Parafilm<sup>®</sup>, y a continuación se cubrió con papel de aluminio, y después se incubó a 30°C. Veinticuatro (24) horas más tarde, se contó el número de semillas germinadas, y a continuación se calculó la tasa de germinación (%) mediante la siguiente fórmula:

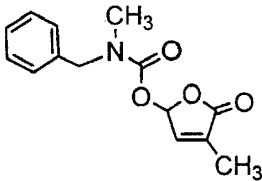
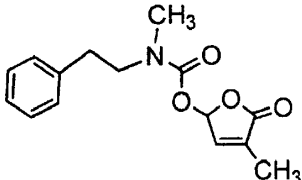
Tasa de germinación (%) = (número de semillas germinadas/número total de semillas) x 100

Los compuestos de ensayo y las tasas de germinación se muestran en las Tablas 1 y 2. Cuando no se utilizó ningún compuesto de ensayo en este ensayo, la tasa de germinación fue de 0%.

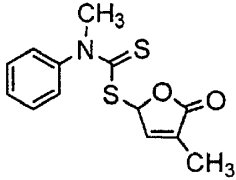
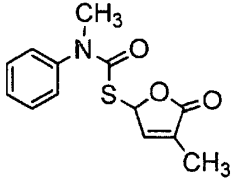
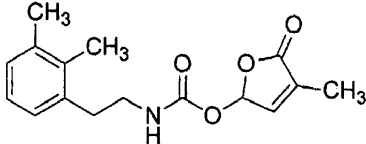
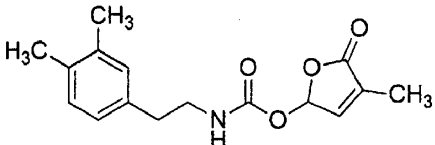
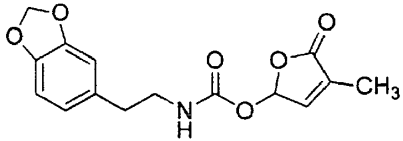
[Tabla 1]

Compuesto Núm.	Estructura	Tasa de germinación (%)
1		2,6
2		38,1
3		54,0
4		53,5



Compuesto Núm.	Estructura	Tasa de germinación (%)
5		48,4
6		28,0

[Tabla 2]

Compuesto Núm.	Estructura	Tasa de germinación (%)
7		32,6
8		12,0
9		32,0
10		43,0
11		37,0

## Ejemplo de ensayo 2

5

Ensayo de la actividad de estimulación de la germinación en *Orobanche*

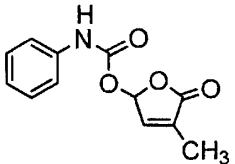
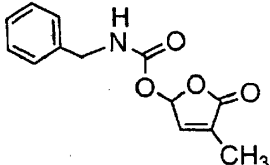
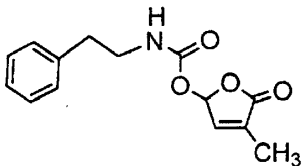
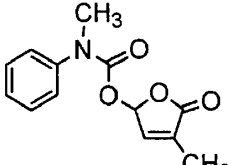
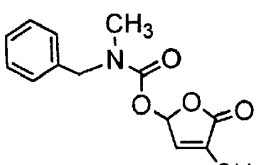
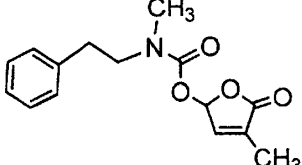
En primer lugar, se pesaron 10  $\mu$ moles de cada compuesto de ensayo y se disolvieron en 2 ml de acetona. Cada solución se diluyó con agua destilada para obtener una solución 10  $\mu$ M. A continuación, la parte inferior de una placa

5 Petri se cubrió con un papel de filtro, y se colocaron en el papel de filtro semillas acondicionadas de *Orobancha* (*Orobancha menor*), y a continuación se aplicaron a las semillas 20  $\mu$ l de cada solución diluida del compuesto de ensayo. Para el mantenimiento de la humedad, se preparó un papel de filtro húmedo con tal que las gotitas de agua no gotearan del papel de filtro, y se dobló en cuatro, y a continuación se colocó en el centro de la placa Petri. La placa Petri se selló con Parafilm<sup>®</sup>, y después se cubrió con papel de aluminio, y a continuación se incubó a 30°C. Cuatro (4) días después, se contó el número de semillas germinadas, y a continuación se calculó la tasa de germinación (%) mediante la siguiente fórmula:

10 Tasa de germinación (%) = (número de semillas germinadas/número total de semillas) x 100

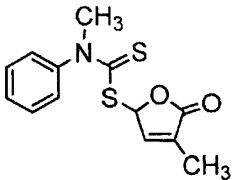
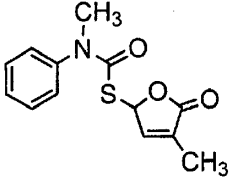
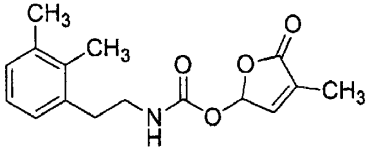
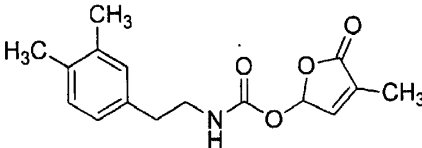
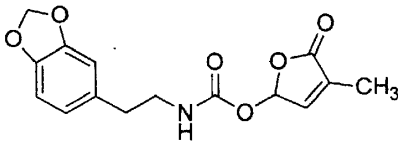
Los compuestos de ensayo y las tasas de germinación se muestran en las Tablas 3 y 4. Cuando no se utilizó ningún compuesto de ensayo en este ensayo, la tasa de germinación fue de 0%.

[Tabla 3]

Compuesto Núm.	Estructura	Tasa de germinación (%)
1		38,8
2		61,1
3		66,9
4		66,3
5		75,2
6		30,4

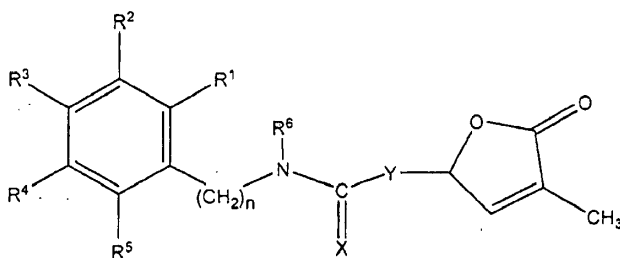
15

[Tabla 4]

Compuesto Núm.	Estructura	Tasa de germinación (%)
7		15,3
8		5,4
9		54,0
10		48,0
11		47,0

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula:



5 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, o un grupo alcoxi C1-C4, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,  
 10  $R^6$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4,  
 X e Y son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, y  
 n representa un número entero de 0, 1 o 2.

15 2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2.

20 3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde  $R^1$  es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4,  $R^2$  es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4,  $R^3$  es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2,  $R^4$  es un átomo de hidrógeno, y  $R^5$  es un átomo de hidrógeno.

25 4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo metilendioxi, y  $R^6$  es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

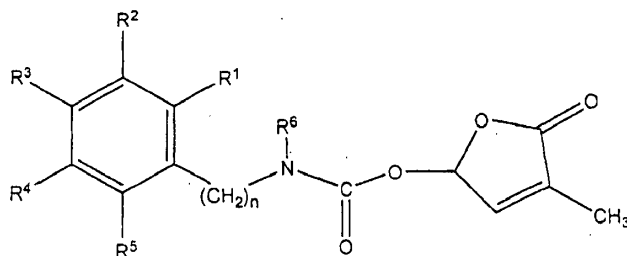
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  es un átomo de hidrógeno.

30 6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, en donde  $R^6$  es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

7. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde X e Y son átomos de oxígeno.

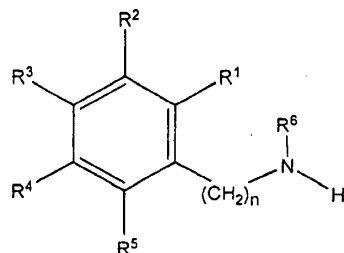
35 8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que es bencilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, fenilcarbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, metil(fenil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo, o bencil(metil)carbamato de 4-metil-5-oxo-2,5-dihidrofuran-2-ilo.

9. Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:

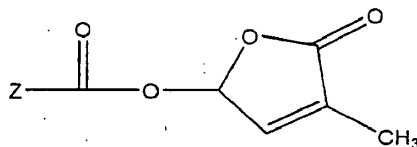


40 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, o un grupo alcoxi C1-C4, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,  
 45

R<sup>6</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4, y n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:



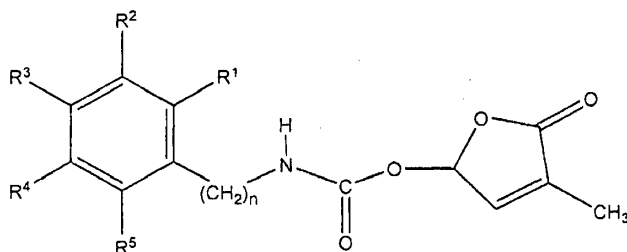
5 en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula:



en donde Z representa un átomo de halógeno, en presencia de una base.

10

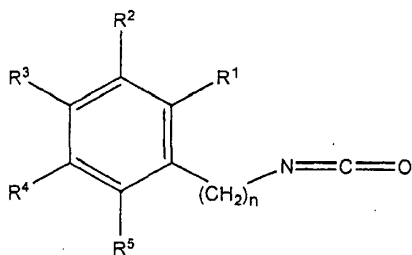
10. Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



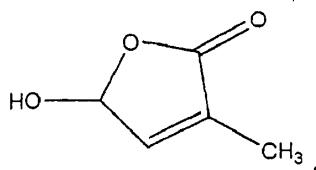
15

en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, o un grupo alcoxi C1-C4, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, y n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:

20



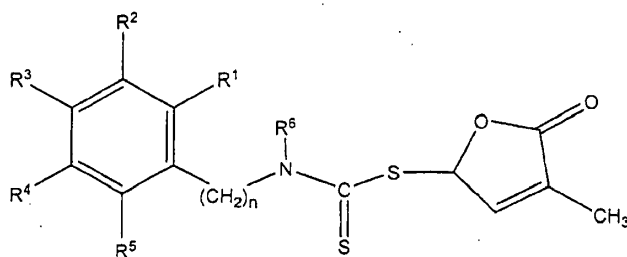
en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y n se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula:



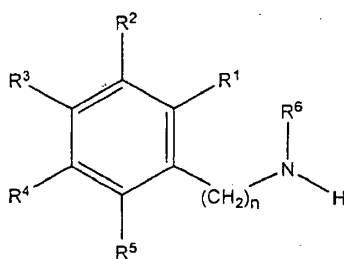
25

en presencia de una base.

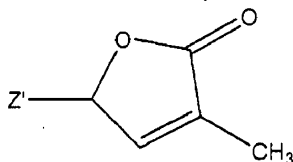
11. Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



5 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, o un grupo alcoxi C1-C4, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,  $R^6$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4, y n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:

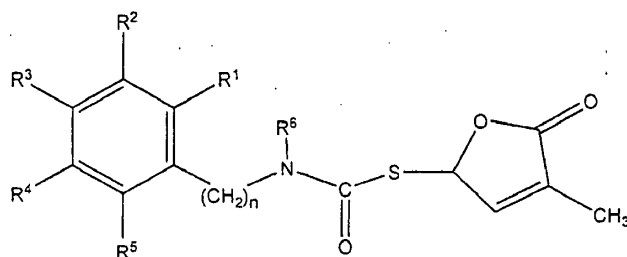


10 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n se definen como antes, con disulfuro de carbono en presencia de una base, y después hacer reaccionar el compuesto resultante con un compuesto representado por la fórmula:



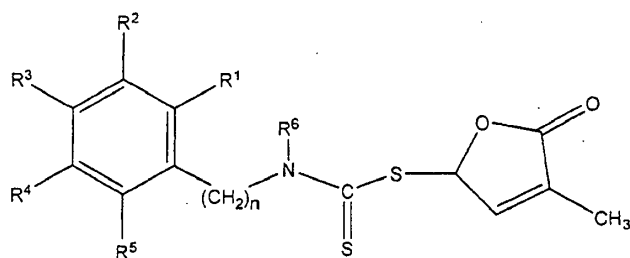
15 en donde  $Z'$  representa un átomo de cloro o un átomo de bromo.

12. Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



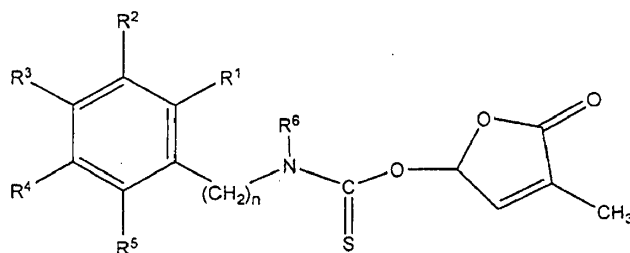
20 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, o un grupo alcoxi C1-C4, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,  $R^6$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4, y n representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:

25



en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes, con un agente de oxidación.

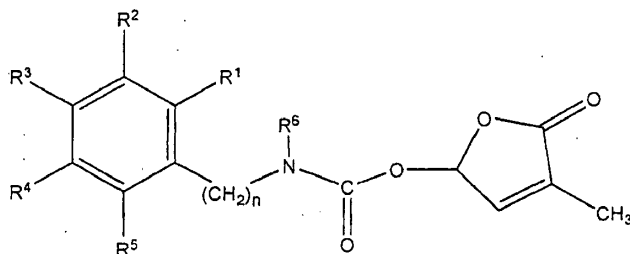
- 5 13. Un procedimiento para producir un compuesto representado por la fórmula:



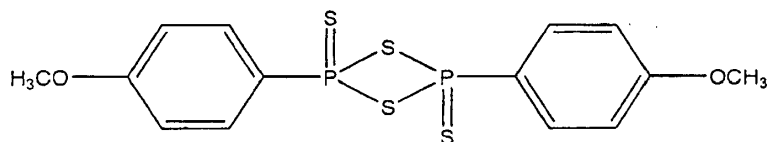
en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, o un grupo alcoxi C1-C4, o  $R^1$  y  $R^2$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno, o  $R^2$  y  $R^3$  están unidos entre sí para formar un grupo alquilendioxi C1-C2, o  $R^2$  y  $R^3$  junto con los átomos de carbono adyacentes forman un anillo de benceno,

$R^6$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C4, y

$n$  representa un número entero de 0, 1 o 2, que comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula:



en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula:



en un disolvente orgánico.

14. Un agente para el control de una planta parásita de la raíz que comprende el compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 como ingrediente activo.

15. Un método para controlar una planta parásita de la raíz, que comprende aplicar una cantidad eficaz del compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 a un terreno agrícola antes de la siembra de un cultivo agrícola.

16. Uso del compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 como un agente para el control de una planta parásita de la raíz.