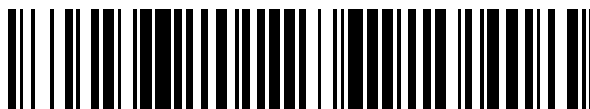


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 553 418**

51 Int. Cl.:

C07D 207/08	(2006.01) C07D 401/06	(2006.01)
C07D 207/48	(2006.01) C07D 405/06	(2006.01)
C07D 211/32	(2006.01) C07D 409/06	(2006.01)
C07D 211/94	(2006.01) C07D 413/06	(2006.01)
C07D 211/96	(2006.01) C07D 491/18	(2006.01)
C07D 307/12	(2006.01)	
C07D 309/04	(2006.01)	
C07D 307/26	(2006.01)	
C07D 309/12	(2006.01)	
C07D 335/02	(2006.01)	

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.07.2009 E 09772473 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.08.2015 EP 2313370**

54 Título: **5-Heterociclilalquil-3-hidroxi-2-fenilciclopent-2-enonas como herbicidas**

30 Prioridad:

03.07.2008 GB 0812310

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

09.12.2015

73 Titular/es:

**SYNGENTA LIMITED (100.0%)
European Regional Centre Priestley Road Surrey
Research Park Guildford
Surrey GU2 7YH , GB**

72 Inventor/es:

**JEANMART, STEPHANE, ANDRÉ, MARIE;
VINER, RUSSELL;
TAYLOR, JOHN, BENJAMIN;
WHITTINGHAM, WILLIAM, GUY;
WAILES, JEFFREY, STEVEN;
TARGETT, SARAH;
MATHEWS, CHRISTOPHER, JOHN;
GOVENKAR, MANGALA;
CORDINGLEY, MATTHEW, ROBERT;
RUSSELL, CLAIRE, JANET y
TYTE, MELLONEY**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

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).

ES 2 553 418 T3

DESCRIPCIÓN

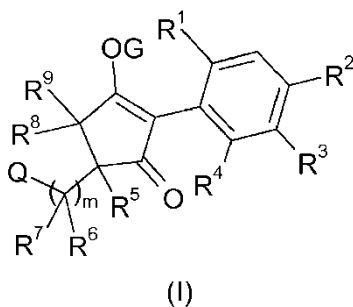
5-Heterociclilalquil-3-hidroxi-2-fenilciclopent-2-enonas como herbicidas

La presente invención se refiere a nuevas dionas cíclicas herbicidamente activas, y a sus derivados, a procedimientos para su preparación, a composiciones que comprenden esos compuestos, y a su uso para controlar las malas hierbas, especialmente en cultivos de plantas útiles, o para inhibir el crecimiento de plantas indeseadas.

Las dionas cíclicas que tienen acción herbicida se describen, por ejemplo, en los documentos WO96/25395, WO01/74770 y WO96/03366.

Se han encontrado ahora nuevos compuestos ciclopentanodiónicos, y sus derivados, que tienen propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento.

La presente invención se refiere en consecuencia a compuestos de fórmula (I)



en la que

R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, *iso*-propilo, halometilo, haloetilo, halógeno, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, halometoxi, haloetoxi, ciclopropilo o halociclopropilo,

R² y R³ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, haloalquino de C₂-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, haloalqueno C₃-C₆-oxi, alquino C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfonilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo,

R⁴ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, haloalqueno C₃-C₆-oxi, alquino C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfinilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfonilo o ciano,

R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, haloalqueno C₃-C₆-oxi, alquino C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfonilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, o bencilo o bencilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o cicloalquil C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃ en el que un grupo metilénico anular o de cadena está opcionalmente sustituido por un átomo de oxígeno o de azufre, o

R⁶ y R⁷ o R⁸ y R⁹, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo de 3 a 8 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno; en el que los sustituyentes opcionales en el anillo están presentes cuando el anillo formado por R⁶ y R⁷ o R⁸ y R⁹ es un grupo heterociclilo sustituido, en cuyo caso el uno o más sustituyentes se seleccionan independientemente de halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, nitro y ciano, o

R⁵ y R⁶ forman juntos un enlace,

Q es heterociclilo de C₃-C₈ saturado o mono-insaturado que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, N y S, no sustituido o sustituido con un resto de fórmula =O, =N-R¹⁰ o alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo de C₁-C₂, cicloalquilo de C₃-C₆, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, en el que R¹⁰ es alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₂-C₈-aminocarbonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo o haloalquil C₁-C₆-sulfonilo,

m es 1, 2 o 3,

en la que R⁶ o R⁷ pueden tener diferentes significados cuando m es 2 o 3, y

G es hidrógeno o un metal agrícolamente aceptable, sulfonio, amonio o grupo protector;

en la que, cuando G es un grupo protector, entonces G se selecciona de los grupos alquilo de C₁-C₈, haloalquilo de C₂-C₈, fenil-alquilo de C₁-C₈ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₈ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquienilo de C₃-C₈, haloalquienilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g y CH₂-X^f-R^h, en los que:

X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son independientemente entre sí oxígeno o azufre;

R^a es H, alquilo de C₁-C₁₈, alquienilo de C₂-C₁₈, alquinilo de C₂-C₁₈, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquienil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo de C₁-C₅, N-alquil C₁-C₅-carbonil-N-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquienilo de C₂-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro;

R^b es alquilo de C₁-C₁₈, alquienilo de C₃-C₁₈, alquinilo de C₃-C₁₈, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquienil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo de C₁-C₅, N-alquil C₁-C₅-carbonil-N-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-silil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquienilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

R^c y R^d son, cada uno independientemente entre sí hidrógeno, alquilo de C₁-C₁₀, alquienilo de C₃-C₁₀, alquinilo de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₂-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquienil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-

C₇-amino, dicicloalquil C₃-C₇-amino, cicloalcoxi de C₃-C₇, haloalcoxi de C₁-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino o dialquil C₂-C₈-amino; o benciloxi o fenoxi, en los que los grupos bencilo y fenilo pueden estar sustituidos a su vez con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro; y

R^h es alquilo de C₁-C₁₀, alquenilo de C₃-C₁₀, alquinilo de C₃-C₁₀, haloalquilo de C₁-C₁₀, cianoalquilo de C₁-C₁₀, nitroalquilo de C₁-C₁₀, aminoalquilo de C₂-C₁₀, alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-amino-alquilo de C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₇-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-alquilo de C₁-C₅, alquenil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquinil C₃-C₅-oxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-tio-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfinil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-sulfonil-alquilo de C₁-C₅, alquiliden C₂-C₈-aminoxi-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅-carbonil-alquilo de C₁-C₅, aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, dialquil C₂-C₈-aminocarbonil-alquilo de C₁-C₅, alquil C₁-C₅-carbonilamino-alquilo de C₁-C₅, *N*-alquil C₁-C₅-carbonil-*N*-alquil C₁-C₅-amino-alquilo de C₁-C₅, trialquil C₃-C₆-siliil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxi-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalqueno de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro;

y en los que:

el termino "heteroarilo" significa un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o en dos anillos condensados.

En las definiciones de los sustituyentes de los compuestos de la fórmula I, cada resto alquilo, ya sea solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi, alquiltio, alquilcarbonilo y dialquilaminocarbonilo) es una cadena lineal o ramificada, y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo o neopentilo. Los grupos alquilo son adecuadamente grupos alquilo de C₁-C₆, pero son preferiblemente grupos alquilo de C₁-C₄, y, más preferiblemente, grupos alquilo de C₁-C₂.

Los restos alquenilo y alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alquenilo, cuando sea apropiado, pueden tener la configuración (*E*) o (*Z*). Los ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los restos alquenilo y alquinilo pueden contener uno o más dobles y/o triples enlaces en cualquier combinación. Se entiende que alenilo y alquilnilalquenilo se incluyen en estos términos.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más de los mismos o diferentes átomos de halógeno, y son, por ejemplo, CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, FCH₂, ClCH₂, BrCH₂, CH₃CHF, (CH₃)₂CF, CF₃CH₂ o CHF₂CH₂.

El término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o en dos o más anillos condensados. Preferiblemente, los anillos individuales contendrán hasta tres, y los sistemas bicíclicos hasta cuatro, heteroátomos, que se escogerán preferiblemente de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo y indolizínilo.

Ejemplos preferidos de radicales heteroaromáticos incluyen piridilo, pirimidinilo, triazinilo, tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo y tiazolilo.

Otro grupo de heteroarilos preferidos comprende furilo, tienilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, quinazolinilo o quinoxalinilo.

El término "heterocíclico" se refiere preferiblemente a sistemas anulares no aromáticos, preferiblemente monocíclicos o bicíclicos, que contienen hasta 8 átomos, que incluyen al menos un (preferiblemente uno o dos) heteroátomo seleccionado de O, S y N. Ejemplos de tales anillos incluyen 1,3-ditiano, 1,3-dioxano, 1,4-dioxano, morfolina,

tiomorfolina, piperazina, tetrahidropirano, piperidina, tiano, 1,3-dioxolano, tetrahidrofurano, tetrahidrotiofeno, pirrolidina, imidazolina, azetidina, oxetano, tietano, aziridina, epóxido y tiirano.

Los ejemplos preferidos de radicales heterocíclicos incluyen 1,3-dioxano, morfolina, tiomorfolina, tetrahidropirano, 1,3-dioxolano, tetrahidrofurano y tetrahidrotiofeno.

- 5 Cicloalquilo incluye preferiblemente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Para grupos heterocíclicos sustituidos, excepto que se señale de otro modo, se prefiere que uno o más sustituyentes se seleccionen independientemente de halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, nitro y ciano. Se entenderá que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos en los que los grupos dialquilo junto con el átomo de N al que están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo de C₁-C₆ seleccionados independientemente. Cuando los anillos heterocíclicos se forman uniendo dos grupos sobre un átomo de N, los anillos resultantes son adecuadamente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina, cada uno de los cuales puede estar sustituido con uno o dos grupos alquilo de C₁-C₆ seleccionados independientemente.

- 15 La invención también se refiere a las sales que los compuestos de fórmula I son capaces de formar con aminas, bases de metales alcalinos y de metales alcalino-térreos, o bases de amonio cuaternario. Entre los hidróxidos de metales alcalinos y de metales alcalino-térreos como formadores de sales, se debería hacer mención especial a los hidróxidos de litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero especialmente los hidróxidos de sodio y potasio. Los compuestos de fórmula I según la invención también incluyen hidratos, que se pueden formar durante la formación de las sales.

Ejemplos de aminas adecuadas para la formación de sales de amonio incluyen amoniaco así como alquil C₁-C₁₈-aminas, hidroxialquil C₁-C₄-aminas y alcoxi C₂-C₄-alquilaminas primarias, secundarias y terciarias, por ejemplo metilamina, etilamina, *n*-propilamina, isopropilamina, los cuatro isómeros de butilamina, *n*-amilamina, isoamilamina, hexilamina, heptilamina, octilamina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metiletilamina, metilisopropilamina, metilhexilamina, metilnonilamina, metilpentadecilamina, metiloctadecilamina, etilbutilamina, etilheptilamina, etiloctilamina, hexilheptilamina, hexiloctilamina, dimetilamina, dietilamina, di-*n*-propilamina, diisopropilamina, di-*n*-butilamina, di-*n*-amilamina, diisoamilamina, dihexilamina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, *n*-propanolamina, isopropanolamina, *N,N*-dietanolamina, *N*-etilpropanolamina, *N*-butiletanolamina, alilamina, *n*-but-2-enilamina, *n*-pent-2-enilamina, 2,3-dimetilbut-2-enilamina, dibut-2-enilamina, *n*-hex-2-enilamina, propilendiamina, trimetilamina, trietilamina, tri-*n*-propilamina, triisopropilamina, tri-*n*-butilamina, triisobutilamina, tri-sec-butilamina, tri-*n*-amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas, por ejemplo piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias, por ejemplo anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, *o*-, *m*- y *p*-toluidinas, fenilendiaminas, bencidinas, naftilaminas y *o*-, *m*- y *p*-cloroanilinas; pero especialmente trietilamina, isopropilamina y diisopropilamina.

Las base de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales corresponde, por ejemplo, a la fórmula [N(R_a R_b R_c R_d)]OH en la que R_a, R_b, R_c y R_d son, cada uno independientemente entre sí, alquilo de C₁-C₄. Otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones se pueden obtener, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio aniónico.

- 40 Los metales agrícolaemente aceptables son iones de metales alcalinos o de metales alcalino-térreos, por ejemplo iones de sodio, potasio, magnesio y calcio, e iones de metales de transición, por ejemplo átomos de cobre y de hierro. Los iones de amonio adecuados son NH₄⁺, iones de alquilamonio, dialquilamonio, trialquilamonio y tetraalquilamonio. Los iones de sulfonio adecuados son iones de trialquilsulfonio, por ejemplo iones de trimetilsulfonio.

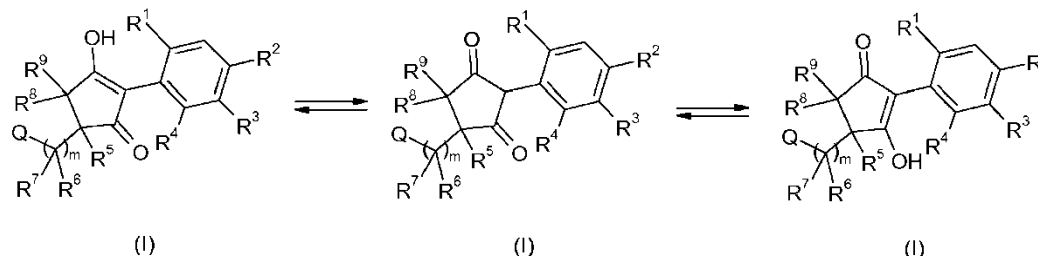
- 45 Se debería entender que en aquellos compuestos de fórmula I en la que G es un metal, amonio o sulfonio como se menciona anteriormente y como tal representa un catión, la carga negativa correspondiente está muy deslocalizada a lo largo de la unidad O-C=C-C=O.

Los grupos protectores G se seleccionan para permitir su eliminación mediante uno o una combinación de procedimientos bioquímicos, químicos o físicos para dar compuestos de fórmula I en la que G es H antes, durante o después de la aplicación al área o plantas tratadas. Los ejemplos de estos procedimientos incluyen escisión enzimática, hidrólisis química, y fotólisis. Los compuestos que poseen tales grupos G pueden ofrecer ciertas ventajas, tales como una penetración mejorada de la cutícula de las plantas tratadas, mayor tolerancia de los cultivos, compatibilidad o estabilidad mejorada en mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas, o lixiviación reducida en suelos.

- 55 En particular, el grupo protector G es un grupo -C(X^a)-R^a o -C(X^b)-X^c-R^b, y los significados de X^a, R^a, X^b, X^c y R^b son como se definen anteriormente.

Se prefiere que G sea hidrógeno, un metal alcalino o un metal alcalino-térreo, en el que se prefiere especialmente hidrógeno.

5 formas tautómeras:



Esta invención cubre todos estos isómeros y tautómeros, y sus mezclas en todas las proporciones. También, cuando los sustituyentes contienen dobles enlaces, pueden existir isómeros *cis* y *trans*. Estos isómeros están, también, dentro del alcance de los compuestos reivindicados de la fórmula (I).

10 En un grupo preferido de compuestos de la fórmula (I), R¹ es metilo, etil o metoxi.

15 ciano, nitro, flúor, cloro o metilsulfonilo.

[illegible]

Preferiblemente, R³ es hidrógeno.

45 Preferiblemente, R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, *iso*-propilo, halometilo, haloetilo, halógeno, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, halometoxi o haloetoxi, y más preferiblemente R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, cloro, bromo, etenilo, etinilo, metoxi o etoxi.

Preferiblemente, R^1 , R^2 y R^4 son metilo y R^3 es hidrógeno.

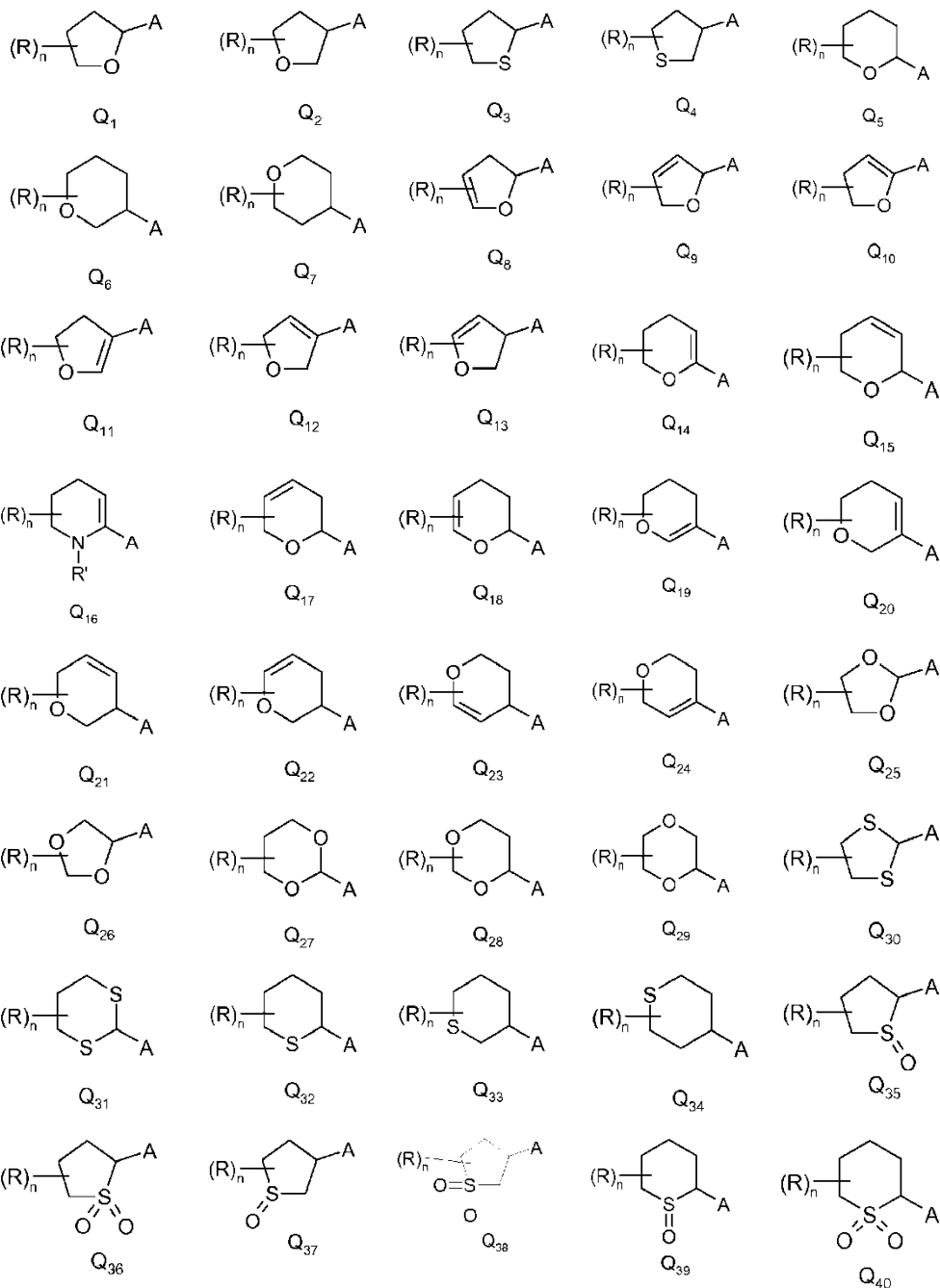
En otro grupo preferido de los compuestos de fórmula (I), R^5 es hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6 , y, más preferiblemente, R^5 es hidrógeno o metilo.

Preferiblemente, en los compuestos de la fórmula (I), R^6 y R^7 son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6 , y, más preferiblemente, R^6 y R^7 son independientemente hidrógeno o metilo.

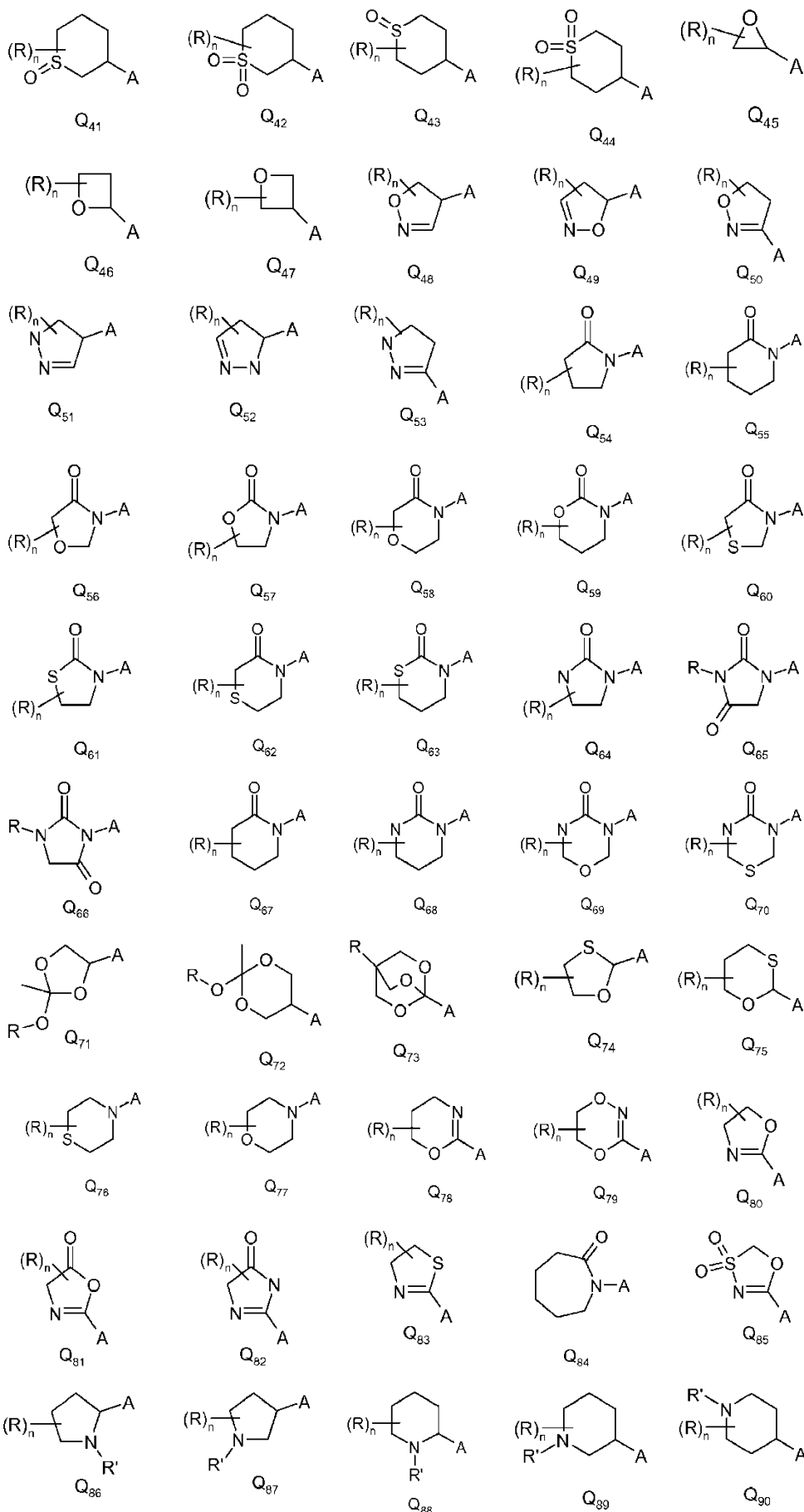
En otro grupo preferido de los compuestos de la fórmula (I), R^8 y R^9 son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6 , y, más preferiblemente, R^8 y R^9 son independientemente hidrógeno o metilo.

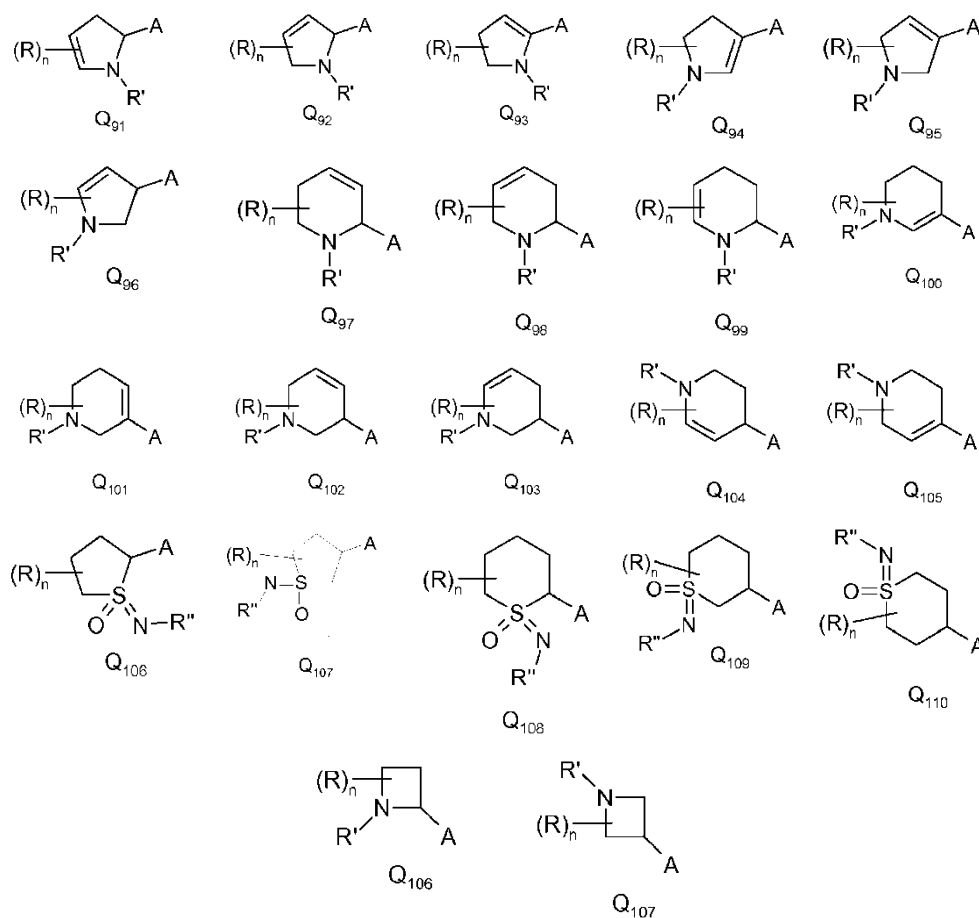
Anillos Q saturados o mono-insaturados preferidos son aquellos de la fórmula

10



15





5

en las que

10 R es hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, haloalquino de C₂-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, haloalqueno C₃-C₆-oxi, alquino C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfinilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfinilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo,

15 R' es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₂-C₈-aminocarbonilo, aril C₆-C₁₀-sulfonilo, aril C₆-C₁₀-carbonilo, aril C₆-C₁₀-aminocarbonilo, arilalquil C₇-C₁₆-aminocarbonilo, hetaril C₁-C₉-sulfonilo, hetaril C₁-C₉-carbonilo, hetaril C₁-C₉-aminocarbonilo, hetarilalquil C₂-C₁₅-aminocarbonilo,

20 R'' es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₂-C₈-aminocarbonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo o haloalquil C₁-C₆-sulfonilo,

n es 0, 1, 2, 3 o 4 y

A representa la posición de unión al resto $-(CR^6R^7)_m-$.

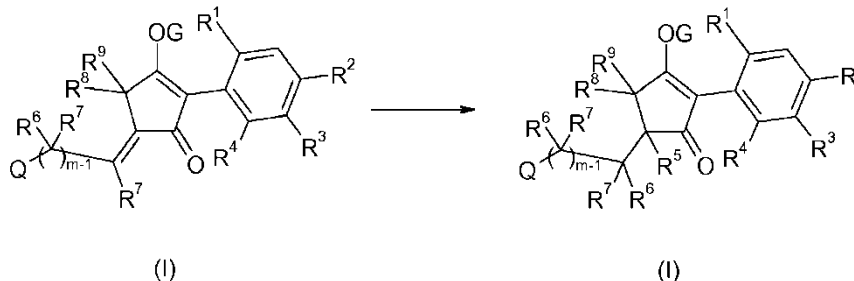
25 Los grupos Q₁, Q₂, Q₃, Q₄, Q₅, Q₆, Q₇, Q₂₅, Q₂₆, Q₂₇, Q₂₈, Q₂₉, Q₈₆, Q₈₇, Q₈₈, Q₈₉, Q₉₀ son más preferidos, y los grupos Q₁ a Q₇ son particularmente preferidos.

Preferiblemente, R y R' son independientemente hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ o haloalcoxi de C₁-C₄, y R'' es hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄ o haloalquil C₁-C₆-carbonilo.

30 Preferiblemente, n es 0, 1 y 2.

Preferiblemente, en los compuestos de la fórmula (I), m es 1 o 2, y lo más preferible, m es 1.

Ciertos compuestos de fórmula (I) son alquenos, y como tales sufren reacciones adicionales típicas de alquenos para dar compuestos adicionales de fórmula (I) según procedimientos conocidos. El ejemplo de tal reacción incluye, pero no se restringe a, halogenación o hidrogenación.



en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

Los compuestos de fórmula (I), en los que R⁵ y R⁶ forman un enlace y R⁷ es halógeno (preferiblemente cloruro o bromuro) o R⁷ es alquil C₁-C₆-sulfonato (preferiblemente mesilato) o haloalquil C₁-C₆-sulfonato (preferiblemente triflato) o un arilsulfonato (preferiblemente tosilato), pueden experimentar una reacción de acoplamiento cruzado con una pareja adecuada de acoplamiento bajo condiciones descritas en la bibliografía para las reacciones de Suzuki-Miyaura, Sonogashira y reacciones de acoplamiento cruzado relacionadas, para dar compuestos adicionales de fórmula (I) (véanse, por ejemplo, O'Brien, C. J. y Organ, M. G. *Angew. Chem. Int. Ed.* (2007), 46, 2768-2813; Suzuki, A. *Journal of Organometallic Chemistry* (2002), 653, 83; Miyaura N. y Suzuki, A. *Chem. Rev.* (1995), 95, 2457-2483).

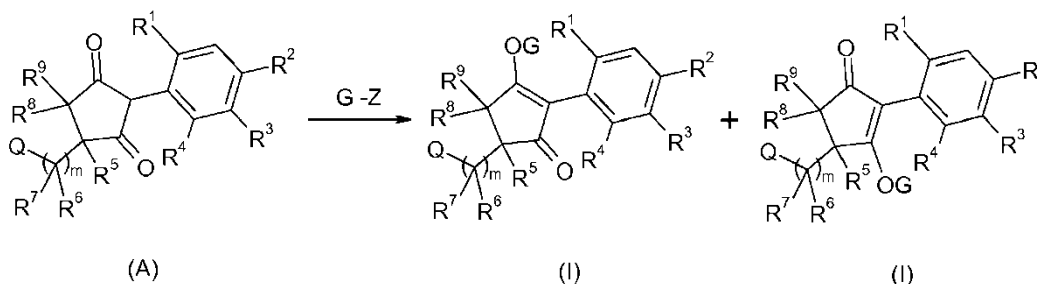
Los expertos en la técnica apreciarán que los compuestos de fórmula (I) pueden contener un resto aromático que posee uno o más sustituyentes capaces de ser transformados en sustituyentes alternativos en condiciones conocidas, y que estos compuestos pueden servir ellos mismos como intermedios en la preparación de compuestos adicionales de fórmula (I).

Por ejemplo, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹, R², R³ o R⁴ es alquenoilo o alquilo, se pueden reducir a compuestos de fórmula (I) en la que R¹, R², R³ o R⁴ es alquilo en condiciones conocidas, y los compuestos de fórmula (I) en la que R¹, R², R³ o R⁴ es halógeno, preferiblemente bromuro o yodo, pueden experimentar una reacción de acoplamiento cruzado con una pareja adecuada de acoplamiento en condiciones descritas en la bibliografía para reacciones de Suzuki-Miyaura, Sonogashira y reacciones de acoplamiento cruzado relacionadas, para dar compuestos adicionales de fórmula (I) (véase, por ejemplo, O'Brien, C. J. y Organ, M. G. *Angew. Chem. Int. Ed.* (2007), 46, 2768-2813; Suzuki, A. *Journal of Organometallic Chemistry* (2002), 653, 83; Miyaura N. y Suzuki, A. *Chem. Rev.* (1995), 95, 2457-2483).

Los compuestos de fórmula (I) en la que G es alquilo de C₁-C₈, haloalquilo de C₂-C₈, fenil-alquilo de C₁-C₈ (en el que el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sufinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₈ (en el que el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sufinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquenoilo de C₃-C₈, haloalquenoilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h, en los que X^a, X^b, X^c, X^d, X^e, X^f, R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R^f, R^g y R^h son como se definen anteriormente, se puede preparar tratando compuestos de fórmula (A), que son compuestos de fórmula (I) en la que G es H, con un reactivo G-Z, en el que G-Z es un agente alquilante tal como un haluro de alquilo (la definición de haluros de alquilo incluye haluros de alquilo de C₁-C₈ sencillos tales como yoduro de metilo y yoduro de etilo, haluros de alquilo sustituidos tales como éteres de clorometil-alquilo, Cl-CH₂-X^f-R^h, en los que X^f es oxígeno, y sulfuros de clorometil-alquilo Cl-CH₂-X^f-R^h, en los que X^f es azufre), un sulfonato de alquilo de C₁-C₈, o un sulfato de di-alquilo de C₁-C₈, o con un haluro de alquenoilo de C₃-C₈, o con un haluro de alquinilo de C₃-C₈, o con un agente acilante tal como un ácido carboxílico, HO-C(X^a)R^a, en el que X^a es oxígeno, un cloruro de ácido, Cl-C(X^a)R^a, en el que X^a es oxígeno, o anhídrido de ácido, [R^aC(X^a)]₂O, en el que X^a es oxígeno, o un isocianato, R^cN=C=O, o un cloruro de carbamoilo, Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d (en el que X^d es oxígeno y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloruro de tiocarbamoilo Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d (en el que X^d es azufre y con la condición de que ni R^c ni R^d sean hidrógeno) o un cloroformiato, Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en el que X^b y X^c son oxígeno), o un clorotioformiato Cl-C(X^b)-X^c-R^b (en el que X^b es oxígeno y X^c es azufre), o un cloroditioformiato Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en el que X^b y X^c son azufre), o un isotiocianato, R^cN=C=S, o por tratamiento secuencial con disulfuro de carbono y un agente alquilante, o con un agente fosforilante tal como un cloruro de fosforilo, Cl-P(X^e)(R^f)-R^g, o con un agente sulfonilante tal como un cloruro de sulfonilo Cl-SO₂-R^e, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de base.

Se pueden formar compuestos isoméricos de fórmula (I). Por ejemplo, los compuestos de fórmula (A) pueden dar lugar a dos compuestos isoméricos de fórmula (I), o a mezclas isoméricas de compuestos de fórmula (I). Esta

invención cubre ambos compuestos isoméricos de fórmula (I), junto con mezclas de estos compuestos en cualquier relación.



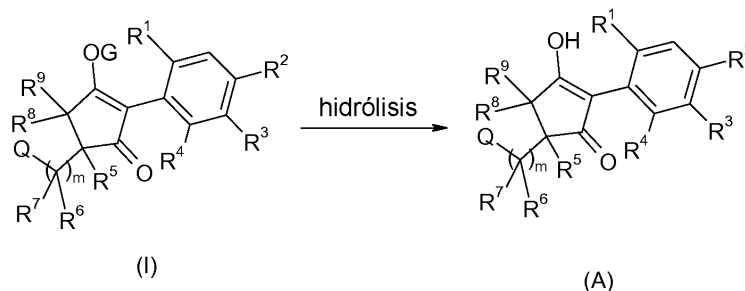
La O-acilación de 1,3-dionas cíclicas es conocida; los métodos adecuados se describen, por ejemplo, en el documento US4436666. Se han publicado procedimientos alternativos por Pizzorno M. T. y Albonico S. M., Chem. Ind. (Londres), (1972), 425; Born, H. et al. J. Chem. Soc. (1953), 1779; Constantino, M. G. et al. Synth. Commun. (1992), 22 (19), 2859; Tian, Y. et al. Synth. Commun. (1997), 27 (9), 1577; Chandra Roy, S. et al., Chem. Lett. (2006), 35 (1), 16; Zubaidha, P. K. et al. Tetrahedron Lett. (2004), 45, 7187 y por Zwanenburg, B. et al. Tetrahedron (2005), 45 (22), 7109.

La acilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar por procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, en los documentos US4551547, US4175135, US4422870, US4659372 y US4436666. Típicamente, las dionas de fórmula (A) se pueden tratar con un agente acilante, en presencia de al menos un equivalente de una base adecuada, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado. La base puede ser inorgánica, tal como un carbonato o hidróxido de un metal alcalino, o un hidruro metálico, o una base orgánica tal como una amina terciaria o un alcóxido metálico. Ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, hidróxido de sodio o potasio, hidruro de sodio, y las bases orgánicas adecuadas incluyen trietilaminas, tales como trimetilamina y trietilamina, piridinas u otras bases amínicas tales como 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los disolventes adecuados para esta reacción se seleccionan de forma que sean compatibles con los reactivos, e incluyen éteres tales como tetrahidrofurano y 1,2-dimetoxietano, y disolventes halogenados tales como diclorometano y cloroformo. Se pueden emplear ciertas bases, tales como piridina y trietilamina, de forma satisfactoria tanto como bases como disolventes. Para los casos en los que el agente acilante es un ácido carboxílico, la acilación se efectúa preferiblemente en presencia de un agente de acoplamiento, tal como yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y *N,N'*-carbodiimidazol, y opcionalmente una base tal como trietilamina o piridina en un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano, diclorometano o acetonitrilo. Procedimientos adecuados se describen, por ejemplo, por Zhang, W. y Pugh, G. Tetrahedron Lett. (1999), 40 (43), 7595, e Isobe, T. e Ishikawa, T. J. Org. Chem. (1999), 64 (19) 6984.

La fosforilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar utilizando un haluro de fosforilo o haluro de tiofosforilo y una base, mediante procedimientos análogos a los descritos en el documento US4409153.

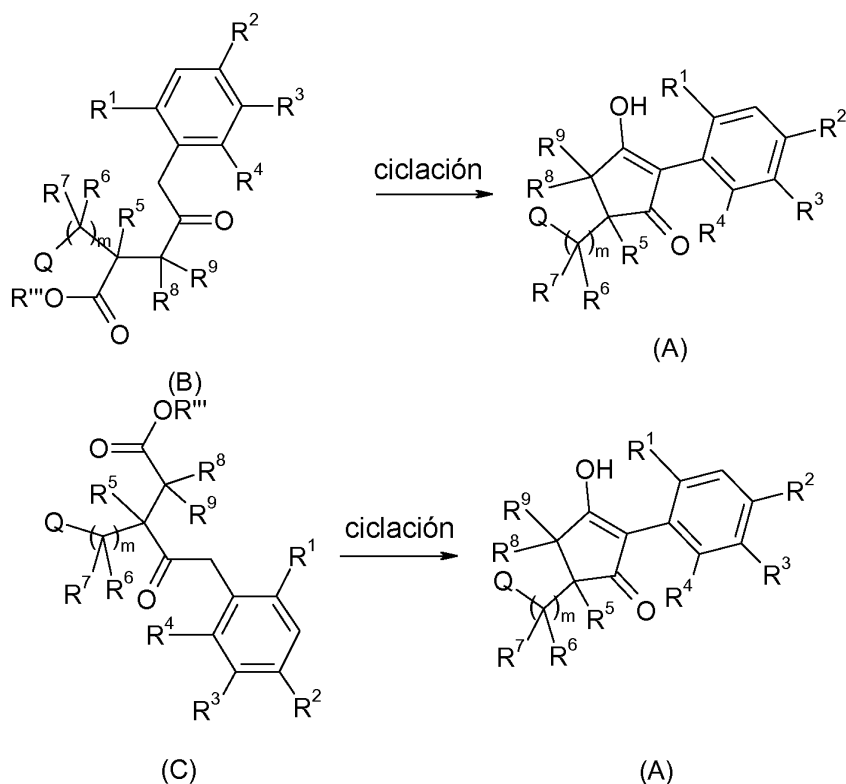
La sulfonilación de un compuesto de fórmula (A) se puede lograr usando un haluro de alquil- o arilsulfonilo, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de base, por ejemplo mediante el procedimiento de Kowalski, C. J. y Fields, K. W. J. Org. Chem. (1981), 46, 197.

Los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (I) mediante hidrólisis, preferiblemente en presencia de un catalizador ácido tal como ácido clorhídrico y opcionalmente en presencia de disolvente tal como tetrahidrofurano o acetona, preferiblemente entre 25°C y 150°C bajo calentamiento convencional o bajo irradiación de microondas.

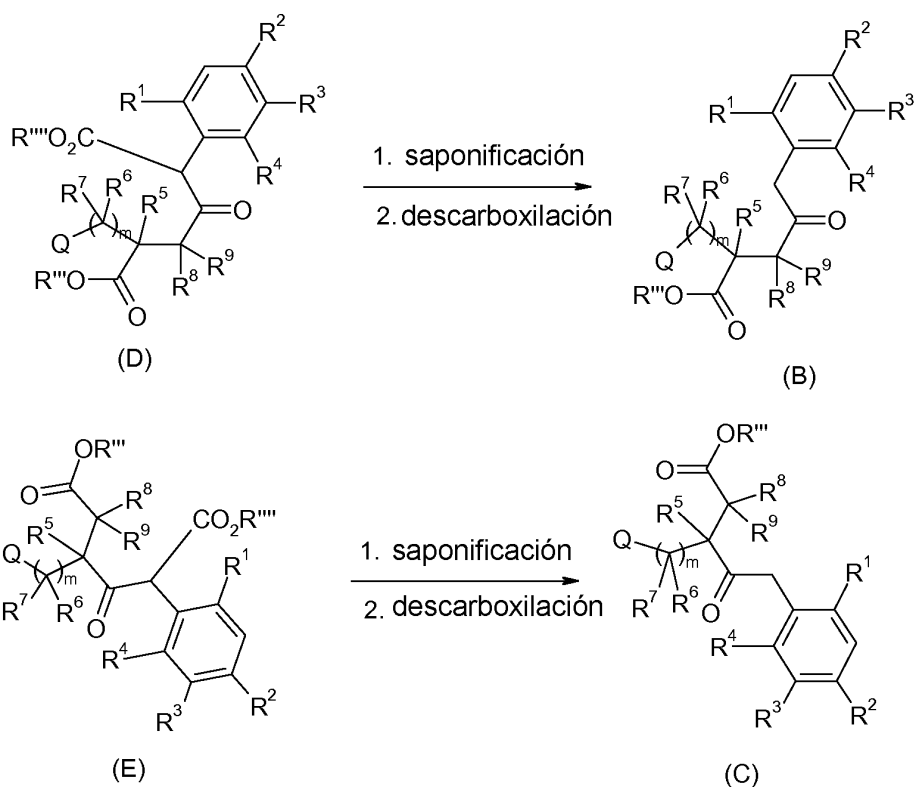


En un enfoque adicional, los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar mediante la ciclación de un compuesto de fórmula (B) o un compuesto de fórmula (C), en los que R''' es hidrógeno o un grupo alquilo, preferiblemente en presencia de un ácido o una base, y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, mediante métodos análogos a los descritos por T. N. Wheeler, documento US4209532. Los compuestos de fórmula (B) o compuestos

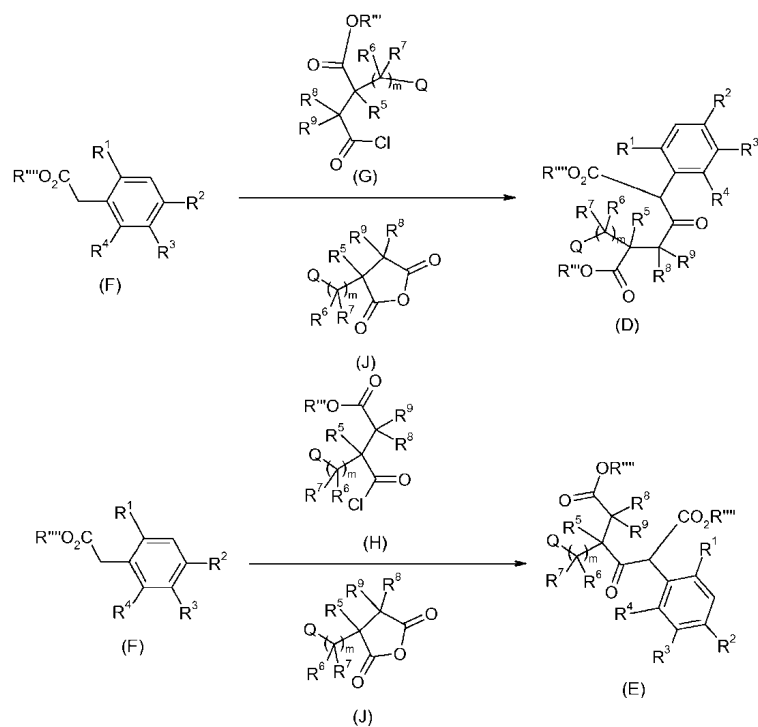
de fórmula (C), en los que R''' es hidrógeno, se pueden ciclar en condiciones ácidas, preferiblemente en presencia de un ácido fuerte tal como ácido sulfúrico, ácido polifosfórico o reactivo de Eaton, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado tal como ácido acético, tolueno o diclorometano.



- 5 Los compuestos de fórmula (B) o compuestos de fórmula (C), en los que R''' es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), se pueden ciclar en condiciones ácidas o básicas, preferiblemente en presencia de al menos un equivalente de una base fuerte tal como *tert*-butóxido de potasio, diisopropilamido de litio o hidruro de sodio, y en un disolvente tal como tetrahidrofurano, tolueno, dimetilsulfóxido o *N,N*-dimetilformamida.
- 10 Los compuestos de fórmula (B) y compuestos de fórmula (C), en los que R''' es H, se pueden esterificar a, respectivamente, compuestos de fórmula (B) y compuestos de fórmula (C), en los que R''' es alquilo, en condiciones estándar, por ejemplo calentando con un alcohol alquílico, ROH, en presencia de un catalizador ácido.
- 15 Los compuestos de fórmula (B) y compuestos de fórmula (C), en los que R''' es H, se pueden preparar, respectivamente, por saponificación de compuestos de fórmula (D) y compuestos de fórmula (E), en los que R''' es alquilo (preferiblemente metilo o etilo), en condiciones estándar, seguido de acidificación de la mezcla de reacción para efectuar la descarboxilación, mediante procedimientos similares a los descritos, por ejemplo, por T. N. Wheeler, documento US4209532.



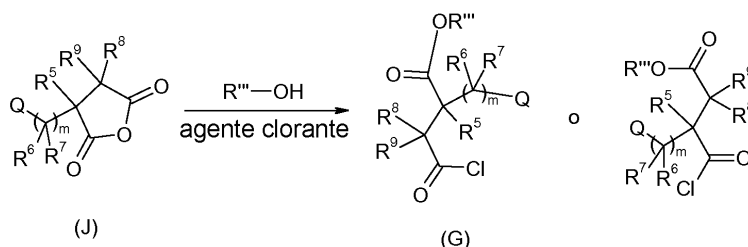
Los compuestos de fórmula (D) y compuestos de fórmula (E), en los que R''' es alquilo, se pueden preparar tratando, respectivamente, compuestos de fórmula (F) con cloruros de ácidos carboxílicos adecuados de fórmula (G), o cloruros de ácidos carboxílicos adecuados de fórmula (H), en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen *terc*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amiduro de sodio y diisopropilamiduro de litio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura entre -80°C y 30°C. Alternativamente, los compuestos de fórmula (D) y compuestos de fórmula (E), en los que R''' es H, se pueden preparar tratando un compuesto de fórmula (F) con una base adecuada (tal como *terc*-butóxido de potasio, bis(trimetilsilil)amiduro de sodio y diisopropilamiduro de litio) en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura adecuada (entre -80°C y 30°C), y haciendo reaccionar el anión resultante con un anhídrido adecuado de fórmula (J):



Los compuestos de fórmula (F) son compuestos conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

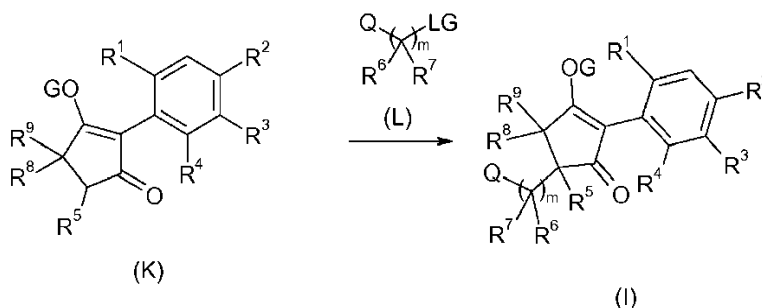
Los compuestos de fórmula (J) se pueden preparar, por ejemplo, por métodos análogos a los descritos por Ballini, R. et al. *Synthesis* (2002), (5), 681-685; Bergmeier, S. C. e Ismail, K. A. *Synthesis* (2000), (10), 1369-1371; Groutas, W. C. et al. *J. Med. Chem.* (1989), 32 (7), 1607-11 y Bernhard, K. y Lincke, H. *Helv. Chim. Acta* (1946), 29, 1457-1466.

Los compuestos de fórmula (G) o compuestos de fórmula (H) se pueden preparar a partir de un compuesto de fórmula (J) mediante tratamiento con un alcohol alquílico, $R'''-OH$, en presencia de una base, tal como dimetilaminopiridina o un alcóxido de metal alcalino (véanse, por ejemplo, Buser, S. y Vasella, A. *Helv. Chim. Acta*, (2005), 88, 3151, y M. Hart et al., *Bioorg. Med. Chem. Letters*, (2004), 14, 1969), seguido de tratamiento del ácido resultante con un agente clorante tal como cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo en condiciones conocidas (véanse, por ejemplo, Santelli-Rouvier. C. *Tetrahedron Lett.*, 1984, 25, (39), 4371; Walba D. y Wand, M. *Tetrahedron Lett.*, (1982), 23 (48), 4995; Cason, J. *Org. Synth. Coll. Vol. III*, (169), 1955).



Los compuestos de fórmula (G) y los compuestos de fórmula (H) se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos. Por ejemplo, los métodos análogos para obtener compuestos de fórmula (G) y compuestos de fórmula (H) se describen por Bergmeier, S. C. e Ismail, K. A. *Synthesis* (2000), (10), 1369-1371.

En un enfoque adicional, los compuestos de fórmula (I) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (K) con compuestos de fórmula (L) en la que LG es un grupo saliente tal como halógeno (preferiblemente yoduro o bromuro) o un alcohol activado (preferiblemente mesilato o tosilato) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butóxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C.



Los compuestos de fórmula (L) son conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos (véase, por ejemplo: documento WO2006016178; Ueno, H. et al. *J. Med. Chem.* (2005), 48(10), 3586-3604; Kanoh, S. et al. *Tetrahedron* (2002), 58(35), 7049-7064; Strachan, J.-P. et al. *J. Org. Chem.* (2006), 71(26), 9909-9911).

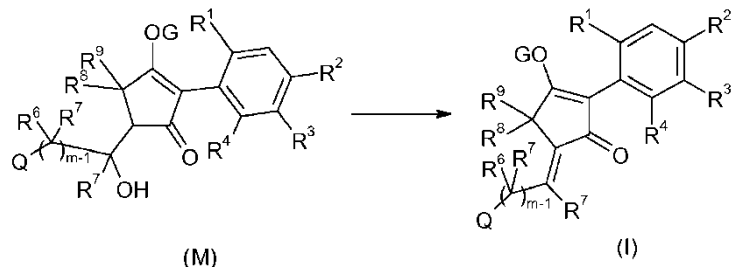
Los compuestos de fórmula (K) son compuestos conocidos o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Song, Y. S. S. et al. *Tetrahedron Lett.* (2005), 46 (46), 5987-5990; Kuethe, J. T. et al. *J. Org. Chem.* (2002), 67 (17), 5993-6000).

De manera alternativa, los compuestos de fórmula (K), en los que G es alquilo de C_1-C_6 , se pueden preparar por alquilación de compuestos de fórmula (K), en los que G es hidrógeno, en condiciones conocidas o por métodos conocidos (véase, por ejemplo, Eberhardt, U. et al. *Chem. Ber.* (1983), 116 (1), 119-135).

Los compuestos de fórmula (K) en los que G es hidrógeno son conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Nguyen, H. N. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (2003), 125 (39), 11818-11819; Bonjoch, J. et al. *Tetrahedron* (2001), 57(28), 6011-6017; Fox, J. M. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (2000), 122(7), 1360-1370; documentos US4338122; US4283348).

De manera alternativa, los compuestos de fórmula (I) en los que R^5 y R^6 forman un enlace se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (M) mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Nagaoka, H. et al. *Tetrahedron Letters* (1985), 26 (41), 5053-5056; Nagaoka, H. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (1986), 108 (16), 5019-5021;

Zuki, M. et al. Bull. Chem. Soc. Japan (1988), 61(4), 1299-1312; Enholm, E. J. et al. J. Org. Chem. (1996), 61 (16), 5384-5390; Clive, D. L. J. et al. Tetrahedron (2001), 57 (18), 3845-3858; Bartoli, G. et al. J. Org. Chem. (2002), 67 (25), 9111-9114. Jung, M. E. et al. Chem. Comm. (2003), (2), 196-197; documentos EP1433772; JP2004203844; IN194295)

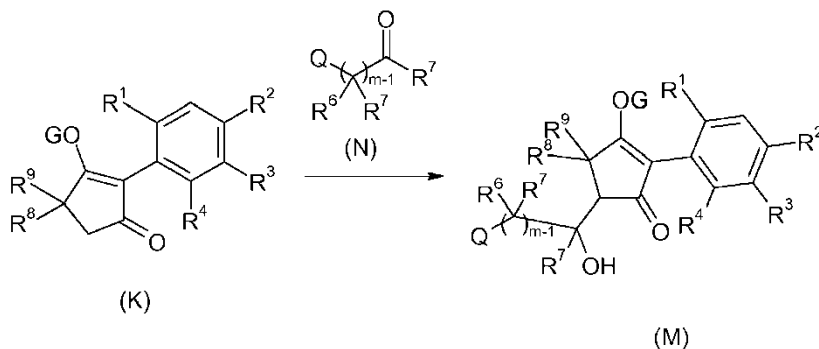


5

en la que R^5 y R^6 forman un enlace

Los compuestos de fórmula (M) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (K) (en los que R^5 es hidrógeno) con compuestos de fórmula (N) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, terc-butoxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C .

10

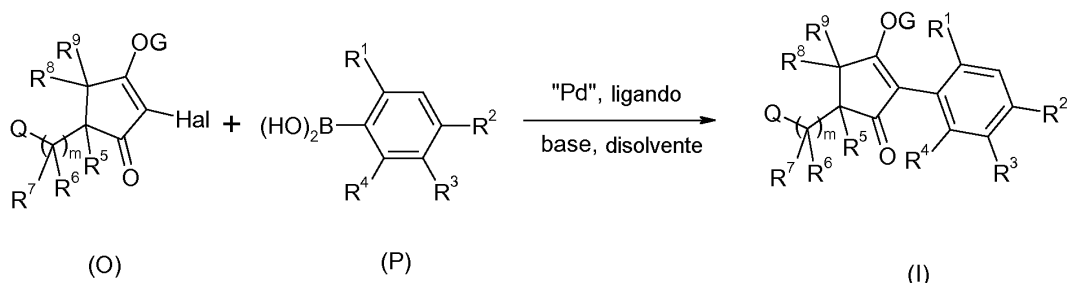


Los compuestos de fórmula (N) son compuestos conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos.

Los compuestos de fórmula (I) (en los que G es alquilo de C_1-C_4) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (O) (en los que G es alquilo de C_1-C_4 , y Hal es halógeno, preferiblemente bromo o yodo) con ácidos arilborónicos, Ar-B(OH)_2 , de fórmula (P), o ésteres de arilboronato, en presencia de un catalizador de paladio adecuado (por ejemplo 0,001-50% de acetato de paladio(II) con respecto al compuesto (O)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de fosfato de potasio con respecto al compuesto (O)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0,001-50% de (2-diciclohexilfosfino)-2',6'-dimetoxibifenilo con respecto al compuesto (O)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo tolueno o 1,2-dimetoxietano), preferiblemente entre 25°C y 200°C bajo calentamiento convencional o bajo irradiación de microondas (véanse, por ejemplo, Song, Y. S. S. et al. Tetrahedron Lett. (2005), 46 (46), 5987-5990; Kuethe, J. T. et al. J. Org. Chem. (2002), 67(17), 5993-6000).

15

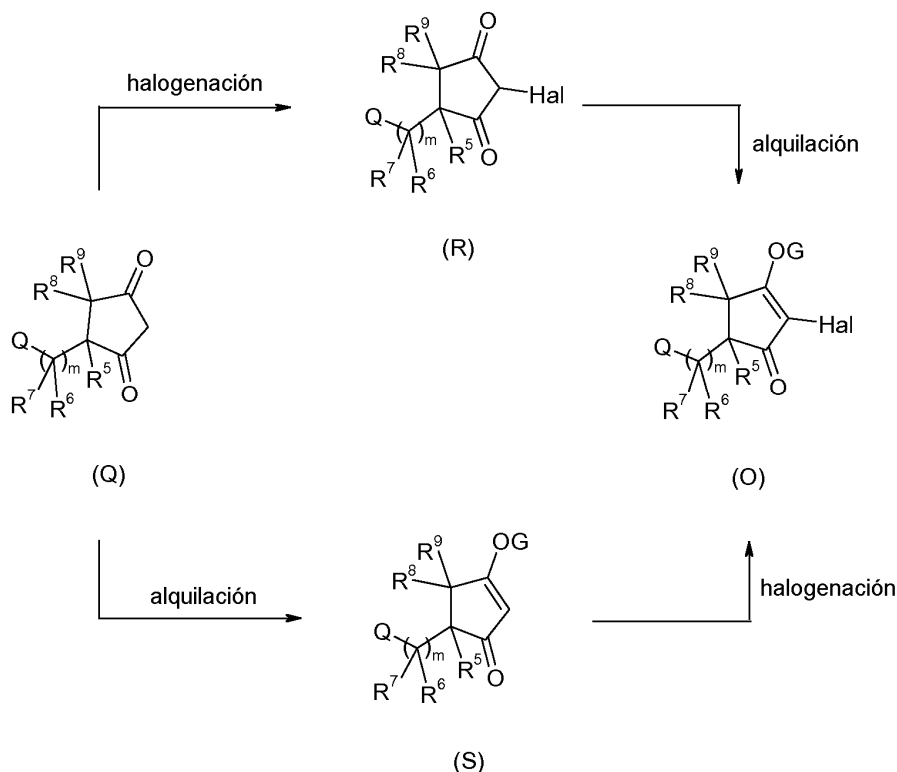
20



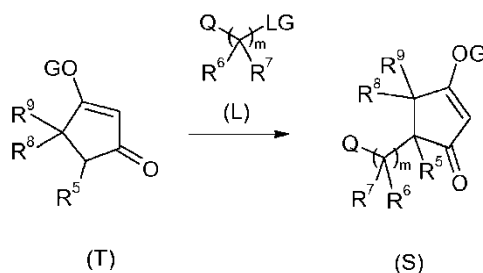
Un compuesto de fórmula (O) se puede preparar halogenando compuestos de fórmula (Q), seguido de la alquilación del haluro resultante de fórmula (R) con un haluro de alquilo de C_1-C_4 u ortoformiato de trialquilo de C_1-C_4 en condiciones conocidas, por ejemplo mediante los procedimientos de Shepherd R. G. et al. J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 2153-2155 y Lin Y.-L. et al. Bioorg. Med. Chem. (2002), 10, 685-690. Como alternativa, los compuestos de fórmula (O) se pueden preparar alquilando un compuesto de fórmula (Q) con un haluro de alquilo de C_1-C_4 o un ortoformiato de trialquilo de C_1-C_4 , y halogenando la enona resultante de fórmula (S) en condiciones

25

conocidas (véanse, por ejemplo, Song, Y. S. et al. Tetrahedron Lett. (2005), 46 (36), 5987-5990; Kuethe, J. T. et al. J. Org. Chem. (2002), 67(17), 5993-6000; Belmont, D. T. et al. J. Org. Chem. 1985, 50 (21), 4102-4107).

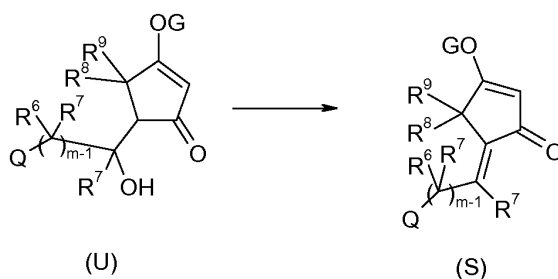


Los compuestos de fórmula (S) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (T) con compuestos de fórmula (L), en los que LG es un grupo saliente tal como halógeno (preferiblemente yoduro o bromuro) o una alcohol activado (preferiblemente mesilato o tosilato) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butoxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véanse, por ejemplo, Gulias, M. et al. Org. Lett. (2003), 5(11), 1975-1977; Altenbach, R. J. et al. J. Med. Chem. (2006), 49 (23), 6869-6887; Snowden, R. L. Tetrahedron (1986), 42 (12), 3277-90; Oppolzer, W. et al. Helv. Chim. Acta (1980), 63 (4), 788-92; Mellor, M. et al. Synth. Commun. 1979, 9 (1), 1-4).



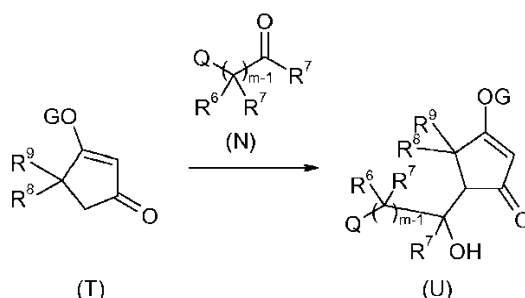
Los compuestos de fórmula (T) son conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos.

De manera alternativa, los compuestos de fórmula (S) en los que R⁵ y R⁶ forman un enlace se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (U) por métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Nagaoka, H. et al. Tetrahedron Letters (1985), 26 (41), 5053-5056; Nagaoka, H. et al. J. Am. Chem. Soc. (1986), 108 (16), 5019-5021; Zuki, M. et al. Bull. Chem. Soc. Japan (1988), 61(4), 1299-1312; Enholm, E. J. et al. J. Org. Chem. (1996), 61(16), 5384-5390; Clive, D. L. J. et al. Tetrahedron (2001), 57 (18), 3845-3858; Bartoli, G. et al. J. Org. Chem. (2002), 67 (25), 9111-9114; Jung, M. E. et al. Chem. Comm. (2003), (2), 196-197; documentos EP1433772; JP2004203844; IN194295).

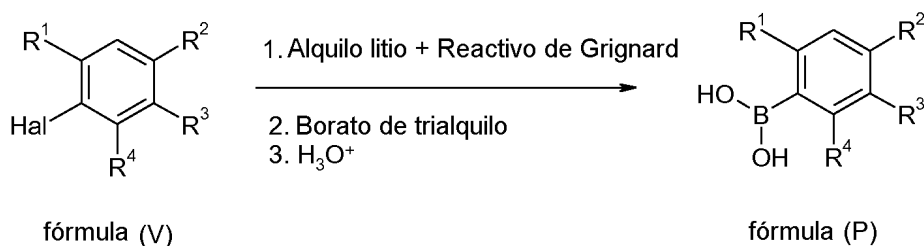


en la que R⁵ y R⁶ forman un enlace

Los compuestos de fórmula (U) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (T) con compuestos de fórmula (N) en condiciones básicas. Las bases adecuadas incluyen diisopropilamido de litio, hexametildisilazida sódica, *tert*-butoxido de potasio, y la reacción se lleva a cabo preferiblemente en un disolvente (tal como tetrahidrofurano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véase, por ejemplo, Aleman, J. et al. Chem. Comm. (2007), (38), 3921-3923).

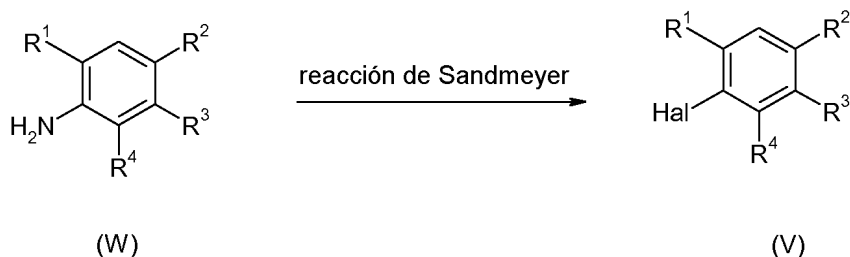


Los compuestos de fórmula (P) se pueden preparar a partir de un haluro de arilo de fórmula (V), en la que Hal es bromo o yodo, mediante métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Thompson W. et al. J. Org. Chem. (1984), 49, 5237 y R. Hawkins et al. J. Am. Chem. Soc. (1960), 82, 3053). Por ejemplo, un haluro de arilo de fórmula (V) se puede tratar con un alquil-litio o haluro de alquil-magnesio en un disolvente adecuado, preferiblemente éter dietílico o tetrahidrofurano, a una temperatura de entre -80°C y 30°C, y el reactivo de arilmagnesio o aril-litio obtenido se puede hacer reaccionar entonces con un borato de trialquilo (preferiblemente borato de trimetilo) para dar un dialquilboronato de arilo, que se puede hidrolizar para proporcionar un ácido borónico de fórmula (P) en condiciones ácidas.



Como alternativa, un compuesto de fórmula (V) se puede hacer reaccionar con un éster de boronato cíclico derivado de un 1,2- o un 1,3-alcanodiol tal como pinacol, 2,2-dimetil-1,3-propanodiol y 2-metil-2,4-pentanodiol en condiciones conocidas (véanse, por ejemplo, Miyauro N. et al., J. Org. Chem., (1995), 60, 7508, y Zhu W. et al., Org. Lett., (2006), 8 (2), 261), y el éster de boronato resultante se puede hidrolizar en condiciones ácidas para dar un ácido borónico de fórmula (P).

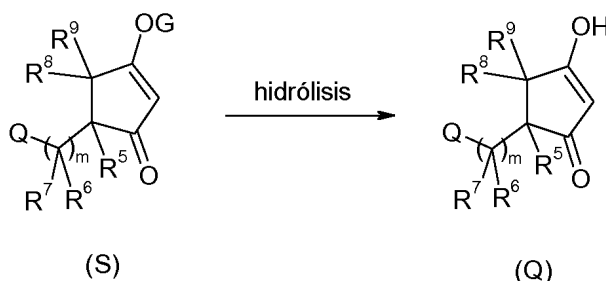
Los haluros de arilo de fórmula (V) son conocidos, o se pueden preparar a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos. Por ejemplo, los haluros de arilo de fórmula (V) se pueden preparar a partir de anilinas de fórmula (W) por métodos conocidos, por ejemplo la reacción de Sandmeyer, vía las sales de diazonio correspondientes.



Las anilinas de fórmula (W) son compuestos conocidos, o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos, mediante métodos conocidos.

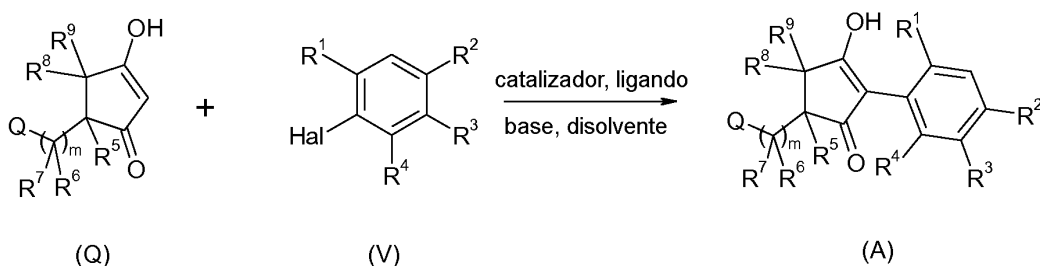
5 Como alternativa, compuestos de fórmula (V) se pueden obtener mediante halogenaciones de los compuestos conocidos correspondientes, mediante métodos conocidos.

Los compuestos de fórmula (Q) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (S) por hidrólisis, preferiblemente en presencia de un catalizador ácido tal como ácido clorhídrico y opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano o acetona, preferiblemente entre 25°C y 150°C bajo calentamiento convencional o bajo irradiación de microondas.

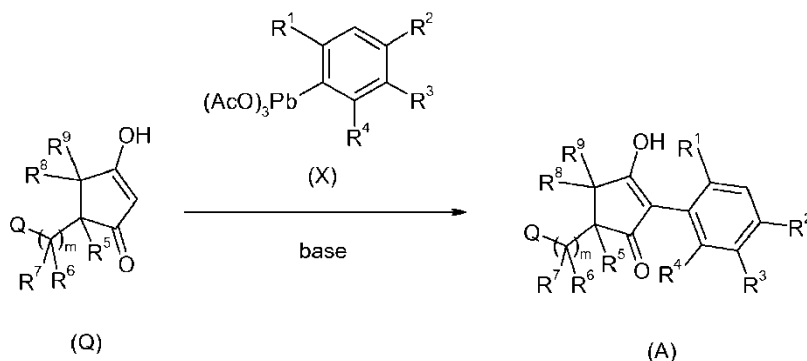


De manera alternativa, los compuestos de fórmula (Q) se pueden obtener a partir de compuestos conocidos por métodos conocidos (véanse, por ejemplo, Manukina, T. A. et al. Zhurnal Organicheskoi Khimii (1986), 22(4), 873-4; Mellor, M. et al. Synth. Commun. 1979, 9 (1), 1-4).

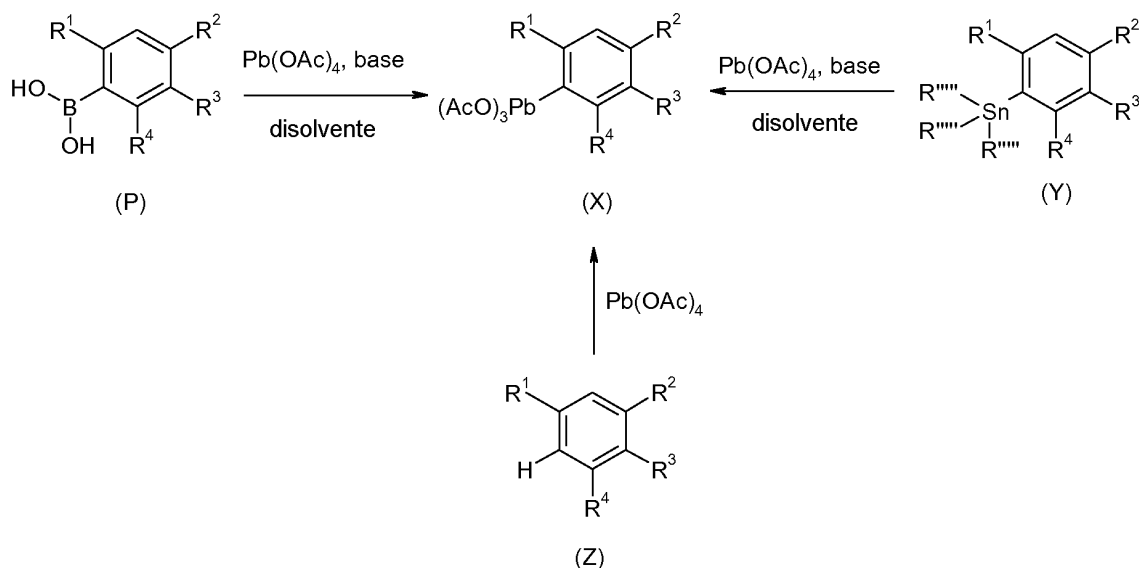
15 En un enfoque adicional, los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (Q) con haluros de arilo adecuados (tales como yoduros de arilo, bromuros de arilo o cloruros de arilo), Ar-Hal de fórmula (V), alquil C₁-C₆-sulfonatos (preferiblemente mesilato) o haloalquil C₁-C₆-sulfonatos (preferiblemente triflato) o arilsulfonatos (preferiblemente tosilato) adecuados en presencia de un catalizador de paladio adecuado (por ejemplo 0,001-50% de acetato de paladio(II) con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de fosfato de potasio con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0,001-50% de (2-diciclohexilfosfino)-2',4',6'-triisopropilbifenilo con respecto a compuestos de fórmula (Q)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo dioxano o 1,2-dimetoxietano), preferiblemente entre 25°C y 200°C. En la bibliografía se conocen acoplamientos similares (véanse, por ejemplo, Belmont, D. T. et al. J. Org. Chem. 1985, 50 (21), 4102-4107; Fox, J. M. et al. J. Am. Chem. Soc. (2000), 122 (7), 1360-1370; B. Hong et al., documento WO 2005/000233). De manera alternativa, los compuestos de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (Q) con haluros de arilo adecuados (tal como yoduros de arilo), Ar-Hal de fórmula (V), en presencia de un catalizador de cobre adecuado (por ejemplo 0,001-50% de yoduro de cobre (I) con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de carbonato de potasio con respecto a compuestos de fórmula (Q)) y preferiblemente en presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0,001-50% de L-prolina con respecto a compuestos de fórmula (Q)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo dimetilsulfóxido), preferiblemente entre 25°C y 200°C. En la bibliografía se conocen acoplamientos similares para haluros de arilo (véase, por ejemplo, Jiang, Y. et al. Synlett (2005), 18, 2731-2734).



Se pueden preparar compuestos adicionales de fórmula (A) haciendo reaccionar compuestos de fórmula (Q) con un reactivo órgano-plumbífero de fórmula (X) en las condiciones descritas, por ejemplo, por Pinhey J., Pure and Appl. Chem., (1996), Vol. 68 (4), 819, y por Moloney M. et al., Tetrahedron Lett., (2002), 43, 3407.

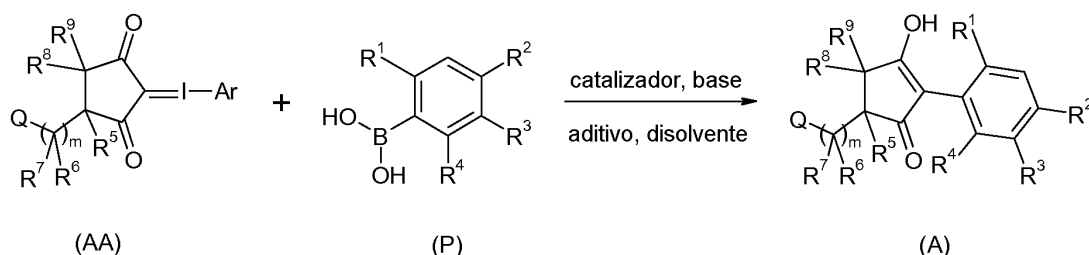


- 5 El reactivo órgano-plumbífero de fórmula (X) se puede preparar a partir de un ácido borónico de fórmula (P), un estannano de fórmula (Y), en la que R''' es alquilo de C₁-C₄, o mediante plumbación directa de un compuesto de fórmula (Z) con tetraacetato de plomo según procedimientos conocidos.



- 10 Otros compuestos de fórmula (A) se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula (Q) con un compuesto de triarilbismuto adecuado, en condiciones descritas, por ejemplo, por Fedorov A. U. et al., Russ. Chem. Bull. Int. Ed., (2005), 54 (11), 2602, y por Koech P. et al., J. Am. Chem. Soc., (2004), 126 (17), 5350 y las referencias allí.

- 15 Se pueden preparar compuestos adicionales de fórmula (A) haciendo reaccionar un iluro de yodonio de fórmula (AA), en la que Ar es un grupo fenilo opcionalmente sustituido, y un ácido arilborónico de fórmula (P), en presencia de un catalizador de paladio adecuado, una base y un disolvente adecuado.



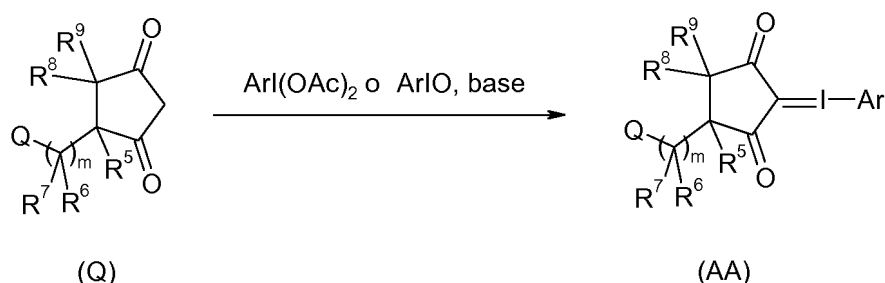
- 20 Los catalizadores de paladio adecuados son generalmente complejos de paladio(II) o paladio(0), por ejemplo dihaluros de paladio(II), acetato de paladio(II), sulfato de paladio(II), dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II), dicloruro de bis(triciclohexilfosfina)paladio(II), dicloruro de bis(triciclohexilfosfina)paladio(II), bis(dibencilidenacetona)paladio(0) o tetraquis(trifenilfosfina)paladio(0). El catalizador de paladio también se puede preparar *in situ* a partir de compuestos de paladio(II) o paladio(0) complejándolos con los ligandos deseados, por

ejemplo combinando la sal de paladio(II) a complejar, por ejemplo dicloruro de paladio(II) (PdCl_2) o acetato de paladio(II) ($\text{Pd}(\text{OAc})_2$), junto con el ligando deseado, por ejemplo trifenilfosfina (PPh_3), triciclopentilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo o 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenilo y el disolvente seleccionado, con un compuesto de fórmula (AA), el ácido arilborónico de fórmula (P) y una base.

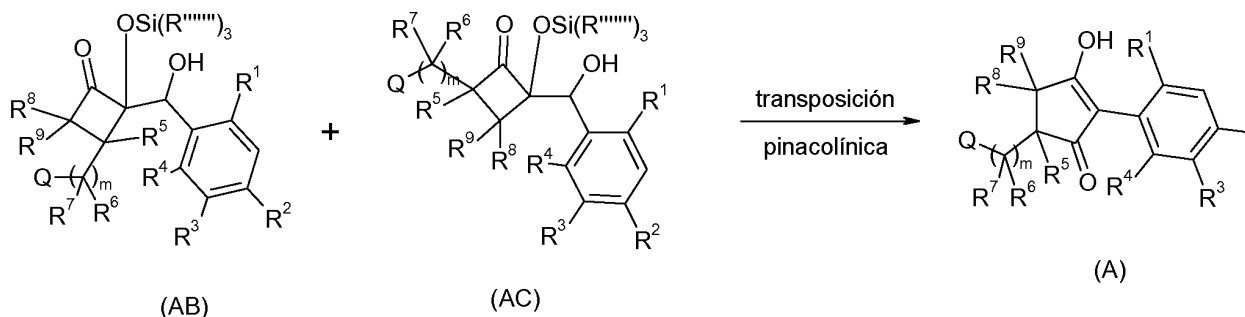
También son adecuados los ligandos bidentados, por ejemplo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno o 1,2-bis(difenilfosfino)etano. Calentando el medio de reacción, se forma así *in situ* el complejo de paladio(II) o complejo de paladio(0) deseado para la reacción de acoplamiento C-C, y después se inicia la reacción de acoplamiento C-C.

Los catalizadores de paladio se usan en una cantidad de 0,001 a 50% en moles, preferiblemente en una cantidad de 0,1 a 15% en moles, basado en el compuesto de fórmula (AA). La reacción también se puede llevar a cabo en presencia de otros aditivos, tales como sales de tetraalquilamonio, por ejemplo bromuro de tetrabutilamonio. Preferiblemente, el catalizador de paladio es acetato de paladio, la base es hidróxido de litio, y el disolvente es 1,2-dimetoxietano acuoso.

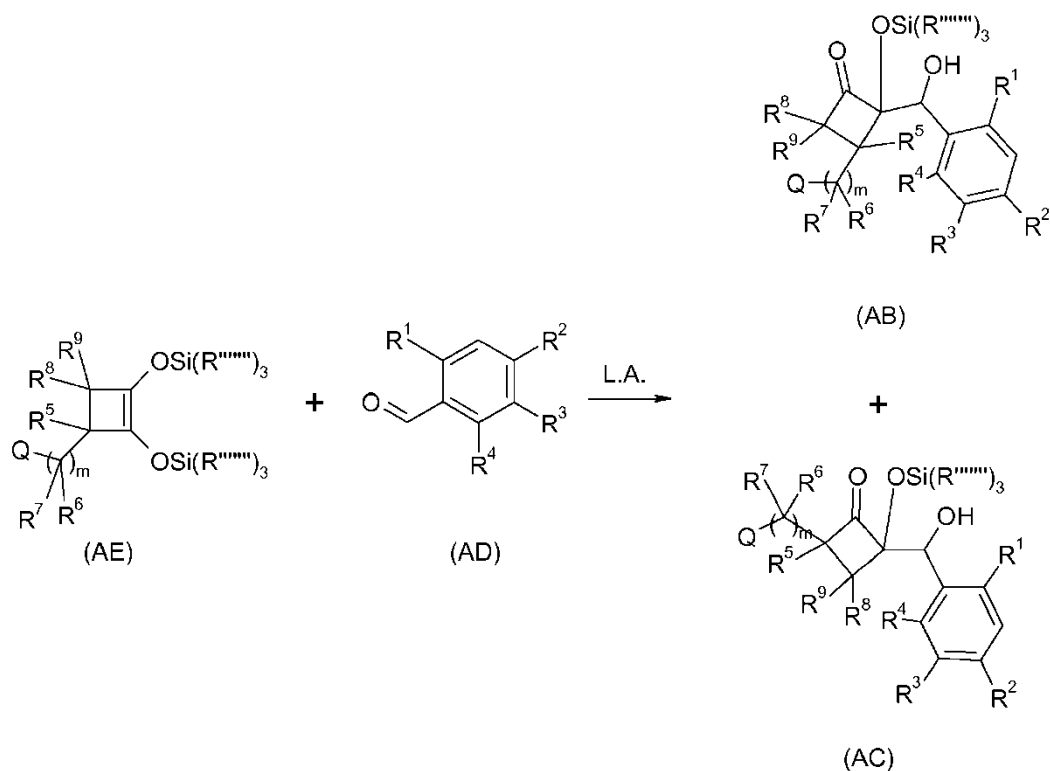
Un compuesto de fórmula (AA) se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula (Q) mediante tratamiento con un reactivo de yodo hipervalente, tal como (diacetoxi)yodobenceno o un yodosilbenceno, y una base tal como carbonato de sodio acuoso, hidróxido de litio o hidróxido de sodio en un disolvente tal como agua o un alcohol acuoso tal como etanol acuoso, según los procedimientos de Schank K. et al., *Synthesis*, (1983), 392, Moriarty R. M. et al., *J. Am. Chem. Soc.*, (1985), 107, 1375, o de Yang Z. et al., *Org. Lett.*, 2002, 4 (19), 3333.



Se pueden preparar compuestos adicionales de fórmula (A) mediante la transposición pinacolínica de compuestos de fórmula (AB) o compuestos de fórmula (AC), en los que $\text{R}^{\text{''''''}}$ es alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$ (preferiblemente metilo) en condiciones ácidas (véanse, por ejemplo, Eberhardt, U. et al. *Chem. Ber.* (1983), 116(1), 119-35 y Wheeler, T.N., documento US4283348).

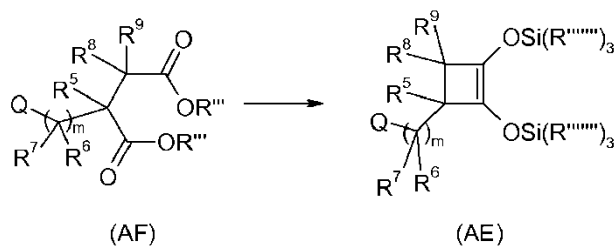


Los compuestos de fórmula (AB) y los compuestos de fórmula (AC) se pueden preparar tratando compuestos de fórmula (AD) con compuestos de fórmula (AE) en presencia de un ácido (tal como cloruro de titanio o yoduro de magnesio) opcionalmente en un disolvente adecuado (tal como diclorometano) a una temperatura entre -80°C y 30°C (véanse, por ejemplo, Li, W.-D.Z. y Zhang, X.-X. *Org. Lett.* (2002), 4(20), 3485-3488; Shimada, J. et al. *J. Am. Chem. Soc.* (1984), 106(6), 1759-73; Eberhardt, U. et al. *Chem. Ver.* (1983), 116(1), 119-35 y Wheeler, T.N., documento US4283348).



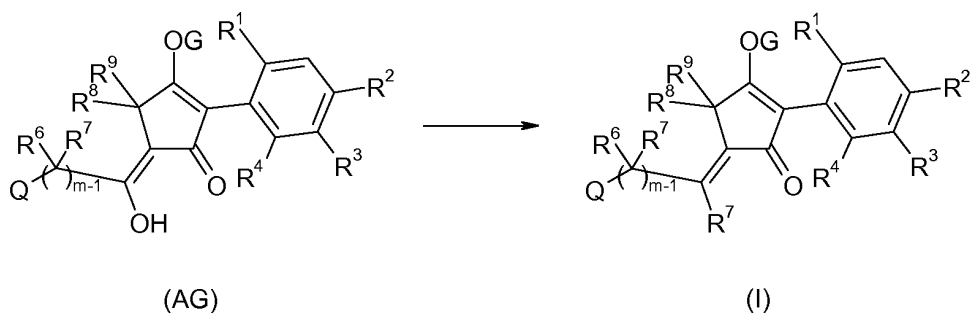
Los compuestos de fórmula (AD) son conocidos, o se pueden obtener por métodos conocidos a partir de compuestos de fórmula (V) o compuestos de fórmula (Z).

- 5 Los compuestos de fórmula (AE) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (AF) en los que R^{'''} es un grupo alquilo (preferiblemente metilo) en presencia de cloro-tri-alquil C₁-C₄-sililo y un metal (preferiblemente sodio) en un disolvente adecuado (tal como tolueno o éter dietílico) a una temperatura entre 20°C y 150°C (véanse, por ejemplo, Blanchard, A. N. y Burnell, D. J. *Tetrahedron Lett.* (2001), 42(29), 4779-4781 y Salaun, J. et al. *Tetrahedron* (1989), 45(10), 3151-62).



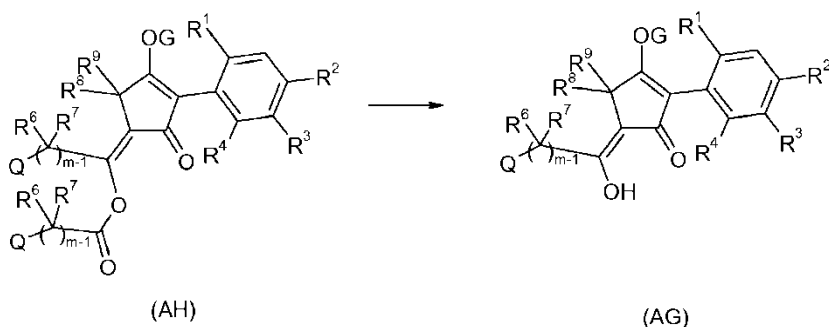
- 10 Los compuestos de fórmula (AF) son análogos a los compuestos de fórmula (H) y compuestos de fórmula (G), y se pueden preparar por métodos análogos a los descritos para los compuestos de fórmula (H) y compuestos de fórmula (G).

- 15 Se pueden preparar compuestos adicionales de fórmula (I), en los que R⁵ y R⁶ forman un enlace, y R⁷ es un alquil C₁-C₆-sulfonato (preferiblemente mesilato) o haloalquil C₁-C₆-sulfonato (preferiblemente triflato) o un arilsulfonato (preferiblemente tosilato), a partir de compuestos de fórmula (AG) siguiendo procedimientos conocidos (Specklin et al. *J. Org. Chem.* 2008, 73(19), 7845-7848).

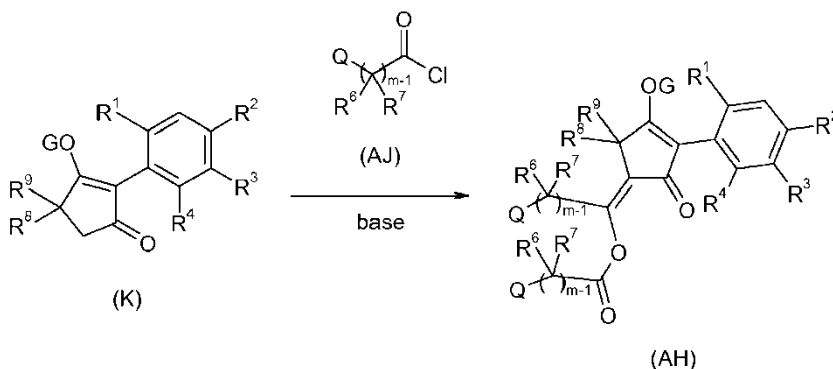


en la que R^5 y R^6 forman un enlace

Los compuestos de fórmula (AG) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (AH) en condiciones básicas o ácidas. Para un ejemplo de un procedimiento, véase G. Quinkert et al. *Helv. Chim. Acta*, 1986, 69(3), 469-537.

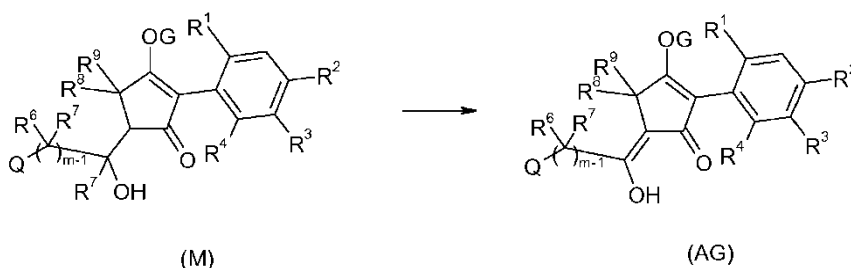


Los compuestos de fórmula (AH) se pueden preparar por reacción de compuestos de fórmula (K), en la que R^5 es hidrógeno, con cloruro de ácidos de fórmula (AJ) en presencia de una base.



Los compuestos de fórmula (AJ) son conocidos, o se pueden obtener por métodos conocidos a partir de compuestos conocidos.

De manera alternativa, los compuestos de fórmula (AG) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (M) usando procedimientos oxidativos (véase, por ejemplo, D. B. Dess y J. C. Martin *J. Org. Chem.* 1983, 48 (22), 4155-4156).



en la que R^7 es hidrógeno

Los compuestos de fórmula (I) según la invención se pueden usar como herbicidas en forma no modificada, como se obtienen en la síntesis, pero generalmente se formulan en composiciones herbicidas de diversas formas usando compuestos auxiliares de la formulación, tales como vehículos, disolventes y sustancias tensioactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, por ejemplo en forma de polvos finos, geles, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, comprimidos dispersables en agua, comprimidos prensados efervescentes, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua, sustancias oleosas capaces de fluir, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspensiones-emulsiones, suspensiones en cápsulas, gránulos emulsionables, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible con el agua como vehículo), películas de polímero impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo, por The Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5ª Edición, 1999. Dichas formulaciones se pueden usar tanto directamente como diluidas antes del uso. Las formulaciones diluidas se pueden preparar, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceites o disolventes.

Las formulaciones se pueden preparar, por ejemplo, mezclando el ingrediente activo con los compuestos auxiliares de la formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, disoluciones, dispersiones o emulsiones. Los ingredientes activos también se pueden formular con otros compuestos auxiliares, por ejemplo sólidos finalmente divididos, aceites minerales, aceites vegetales, aceites vegetales modificados, disolventes orgánicos, agua, sustancias tensioactivas, o combinaciones de los mismos.

Los ingredientes activos también pueden estar contenidos en microcápsulas muy finas que consisten en un polímero. La microcápsulas contienen los ingredientes activos en un soporte poroso. Esto permite que los ingredientes activos se liberen al entorno en cantidades controladas (por ejemplo, liberación lenta). Las microcápsulas tienen habitualmente un diámetro de 0,1 a 500 micrómetros. Contienen ingredientes activos en una cantidad de alrededor de 25 a 95% en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar presentes en forma de un sólido monolítico, en forma de partículas finas en una dispersión sólida o líquida, o en forma de una disolución adecuada. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, gomas naturales y sintéticas, celulosa, copolímeros de estireno-butadieno, poliacrilonitrilo, poliacrilato, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretano o polímeros modificados químicamente y xantatos de almidón u otros polímeros que son conocidos por la persona experta en la técnica a este respecto. Alternativamente, se pueden formar microcápsulas muy finas en las que el ingrediente activo está presente en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de sustancia base, pero en ese caso la microcápsula no está encapsulada.

Los compuestos auxiliares de la formulación adecuados para la preparación de las composiciones según la invención son conocidos *per se*. Como vehículos líquidos se pueden usar: agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceites vegetales, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, anhídridos de ácidos, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butilenos, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, ésteres alquílicos de ácido acético, diacetona alcohol, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, éter butílico de dietilenglicol, éter etílico de dietilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, éter metílico de dipropilenglicol, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, éter butílico de etilenglicol, éter metílico de etilenglicol, gamma-butirolactona, glicerol, acetato de glicerilo, diacetato de glicerilo, triacetato de glicerilo, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, metil isoamil cetona, metil isobutil cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, n-hexano, n-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG 400), ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, éter metílico de propilenglicol, p-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, éter metílico de propilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, metanol, etanol, isopropanol, y alcoholes de peso molecular más alto, tales como alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, N-metil-2-pirrolidona, y similares. El agua es generalmente el vehículo de elección para diluir los concentrados. Vehículos sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla de pirofilita, sílice, arcilla de atapulgita, kieselguhr, piedra caliza, carbonato cálcico, bentonita, montmorillonita cálcica, vainas de las semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, cáscaras molidas de nueces, lignina y materiales similares, como se describe, por ejemplo, en el documento CFR 180.1001. (c) y (d).

Se puede usar ventajosamente un gran número de sustancias tensioactivas, tanto en formulaciones sólidas como líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que pueden diluirse con un vehículo antes del uso. Las sustancias tensioactivas pueden ser aniónicas, catiónicas, no iónicas o poliméricas, y se pueden usar como agentes emulsionantes, humectantes, o agentes de suspensión, o para otros fines. Sustancias tensioactivas típicas incluyen, por ejemplo, las sales de alquilsulfatos, tales como laurilsulfato de dietilamonio; sales de alquilarilsulfonatos, tales como dodecibencenosulfonato cálcico; productos de adición de alquilfenol-óxido de alquileo, tales como etoxilato de nonilfenol; productos de adición de alcohol-óxido de alquileo, tales como etoxilato del alcohol tridecílico; jabones, tales como estearato sódico; sales de alquilnaftalenosulfonatos, tales como dibutilnaftalenosulfonato sódico; ésteres de dialquilo de sales de sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato sódico; ésteres de

sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminos cuaternarios, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio, ésteres de polietilenglicol con ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloques de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de mono- y di-alkilfosfato; y también sustancias adicionales descritas por ejemplo en "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood Nueva Jersey, 1981.

Compuestos auxiliares adicionales que se pueden usar habitualmente en formulaciones de plaguicidas incluyen los inhibidores de la cristalización, sustancias modificadoras de la viscosidad, agentes de suspensión, tintes, antioxidantes, agentes espumantes, agentes que absorben la luz, compuestos auxiliares de mezclado, antiespumantes, agentes formadores de complejos, sustancias neutralizantes o modificadoras del pH y tampones, inhibidores de la corrosión, fragancias, agentes humectantes, mejoradores de la absorción, micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas, y también fertilizantes líquidos y sólidos.

Las formulaciones también pueden comprender sustancias activas adicionales, por ejemplo otros herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas o insecticidas.

Las composiciones según la invención pueden incluir adicionalmente un aditivo que comprende un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres alquílicos de dichos aceites, o mezclas de dichos aceites y derivados de aceites. La cantidad de aditivo oleoso usado en la composición según la invención es generalmente de 0,01 a 10%, basada en la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso se puede añadir al tanque de pulverización en la concentración deseada después de que se haya preparado la mezcla de pulverización. Aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de semilla de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado, tal como AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.), ésteres de alquilo de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados metílicos, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de buey. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos, esencialmente 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de colza metilado, y también 5% en peso de emulsionantes y agentes modificadores del pH usuales. Aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden los ésteres alquílicos de los ácidos grasos de C₈-C₂₂, especialmente los derivados metílicos de ácidos grasos de C₁₂-C₁₈, siendo importantes por ejemplo los ésteres metílicos del ácido láurico, palmítico y oleico. Esos ésteres son conocidos como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de éster metílico de ácido graso preferido es Emery® 2230 y 2231 (Cognis GmbH). Esos y otros derivados oleosos son también conocidos del Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ª edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y acción de los aditivos oleosos se puede mejorar adicionalmente combinándolos con sustancias tensioactivas, tales como tensioactivos no iónicos, aniónicos o catiónicos. En el documento WO 97/34485, páginas 7 y 8, se dan ejemplos de tensioactivos aniónicos, no iónicos y catiónicos adecuados. Las sustancias tensioactivas preferidas son tensioactivos aniónicos del tipo dodecylbencenosulfonato, especialmente las sales de calcio de los mismos, y también los tensioactivos no iónicos del tipo etoxilato de alcohol graso. Se da preferencia especial a los alcoholes grasos de C₁₂-C₂₂ etoxilados que tienen un grado de etoxilación de 5 a 40. Ejemplos de tensioactivos comercialmente disponibles son los tipos Genapol (Clariant AG). También se prefieren los tensioactivos de silicona, especialmente heptametiltriloxanos modificados con poli(óxidos de alquilo), que están comercialmente disponibles como, por ejemplo, Silwet L-77®, y también tensioactivos perfluorados. La concentración de las sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total es en general de 1 a 30% en peso. Ejemplos de aditivos oleosos que consisten en mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de los mismos con tensioactivos son Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) o Actipron® (BP Oil UK Limited, GB).

También es posible usar solas en las formulaciones las sustancias tensioactivas mencionadas, es decir, sin aditivos oleosos.

Además, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/tensioactivo puede contribuir a una mejora adicional de la acción. Disolventes adecuados son, por ejemplo, Solvesso® (ESSO) y Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). La concentración de dichos disolventes puede ser de 10 a 80% en peso del peso total. Por ejemplo, en el documento US-A-4.834.908 se describen tales aditivos oleosos que pueden estar presentes mezclados con disolventes. Un aditivo oleoso comercialmente disponible descrito en ese documento se conoce con el nombre MERGE® (BASF Corporation). Aditivos oleosos adicionales que se prefieren según la invención son SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada) y Adigor® (Syngenta Crop Protection Canada).

Además de los aditivos oleosos listados anteriormente, con el fin de potenciar la actividad de las composiciones según la invención, también es posible añadir formulaciones de alquilpirrolidonas (por ejemplo Agrimax®) a la mezcla de pulverización. También se pueden usar formulaciones de látex sintéticos, por ejemplo compuestos de poliácrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-p-menteno (por ejemplo Bond®, Courier® o Emerald®). También es posible añadir a la mezcla de pulverización, como agente potenciador de la actividad, disoluciones que contengan ácido propiónico, por ejemplo Eurogkem Pen-e-trate®.

Las formulaciones herbicidas generalmente contienen de 0,1 a 99% en peso, especialmente de 0,1 a 95% en peso, de un compuesto de fórmula I, y de 1 a 99,9% en peso de un compuesto auxiliar de la formulación, que incluye preferiblemente de 0 a 25% en peso de una sustancia tensioactiva. Mientras que los productos comerciales se formularán preferiblemente como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas.

- 5 La tasa de aplicación de los compuestos de fórmula I puede variar dentro de límites amplios, y depende de la naturaleza del suelo, del método de aplicación (pre- o post-emergencia; tratamiento de semillas; aplicación en el surco de siembra; no aplicación de cultivo, etc.), de la planta de cultivo, de la hierba o malas hierbas a controlar, de las condiciones climáticas prevalentes, y de otros factores gobernados por el método de aplicación, el tiempo de aplicación, y el cultivo diana. Los compuestos de fórmula I según la invención se aplican generalmente a una tasa de
- 10 1 a 2000 g/ha, preferiblemente 1-1000 g/ha, y muy preferiblemente a 1-500 g/ha.

Las formulaciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones:

(% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

Ingrediente activo:	1 a 95%, preferiblemente 60 a 90%
Agente tensioactivo:	1 a 30%, preferiblemente 5 a 20%
Vehículo líquido:	1 a 80%, preferiblemente 1 a 35%

Polvos:

Ingrediente activo:	0,1 a 10%, preferiblemente 0,1 a 5%
Vehículo sólido:	99,9 a 90%, preferiblemente 99,9 a 99%

Concentrados en suspensión:

Ingrediente activo:	5 a 75%, preferiblemente 10 a 50%
Agua:	94 a 24%, preferiblemente 88 a 30%
Agente tensioactivo:	1 a 40%, preferiblemente 2 a 30%

Polvos humectables:

Ingrediente activo:	0,5 a 90%, preferiblemente 1 a 80%
Agente tensioactivo:	0,5 a 20%, preferiblemente 1 a 15%
Vehículo sólido:	5 a 95 %, preferiblemente 15 a 90%

Gránulos:

Ingrediente activo:	0,1 a 30%, preferiblemente 0,1 a 15%
Vehículo sólido:	99,5 a 70%, preferiblemente 97 a 85%

Los siguientes Ejemplos ilustran más ampliamente, pero no limitan, la invención.

F1. Concentrados emulsionables	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5 %	10 %	25 %	50 %
Dodecibencenosulfonato de calcio	6 %	8 %	6 %	8 %
éter poliglicólico de aceite de ricino (36 moles de óxido de etileno)	4 %	-	4 %	4 %
éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	-	4 %	-	2 %
NMP	-	10 %		20 %
Mezcla de hidrocarburos aromáticos de C ₉ -C ₁₂	85 %	78 %	55 %	16 %

Las emulsiones de cualquier concentración deseada pueden prepararse a partir de tales concentrados por dilución con agua.

F2. Disoluciones	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5%	10%	50%	90%
1-metoxi-3-(3-metoxi-propoxi)-propano	-	20%	20%	-
Polietilenglicol MW 400	20%	10%	-	-
NMP	-	-	30%	10%
Mezcla de hidrocarburos aromáticos de C ₉ -C ₁₂	75%	60%	-	-

Las disoluciones son adecuadas para aplicación en forma de microgotas.

F3. Polvos humectables	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5%	25%	50%	80%
Lignosulfonato de sodio	4%	-	3%	-
Laurilsulfato sódico	2%	3%	-	4%
Diisobutilnaftalensulfonato sódico	-	6%	5%	6%
Éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
Ácido silícico muy disperso	1%	3%	5%	10%
Caolín	88%	62%	35%	-

- 5 El ingrediente activo se mezcla a conciencia con los compuestos auxiliares, y la mezcla se tritura a conciencia en un molino adecuado, produciendo polvos humectables que pueden diluirse con agua para dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

F4. Gránulos revestidos	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1%	5%	15%
Ácido silícico muy dispersado	0,9%	2%	2%
Vehículo inorgánico (diámetro 0,1-1 mm), por ejemplo CaCO ₃ o SiO ₂	99,0%	93%	83%

El ingrediente activo se disuelve en cloruro de metileno, la disolución se pulveriza sobre el vehículo, y entonces el disolvente se separa por evaporación a vacío.

F5. Gránulos revestidos	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1%	5%	15%
Polietilenglicol MW 200	1,0%	2%	3%
Ácido silícico muy disperso	0,9%	1%	2%
Vehículo inorgánico (diámetro 0,1-1 mm), por ejemplo CaCO ₃ o SiO ₂	98,0%	92%	80%

- 10 El ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente, en una mezcladora, al vehículo humedecido con polietilenglicol. De esta manera se obtienen gránulos revestidos no pulverulentos.

F6. Gránulos extruidos	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	0,1%	3%	5%	15%
Lignosulfonato de sodio	1,5%	2%	3%	4%
Carboximetilcelulosa	1,4%	2%	2%	2%

Caolín	97,0%	93%	90%	79%
--------	-------	-----	-----	-----

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los compuestos auxiliares, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extruye y luego se seca en una corriente de aire.

F7. Polvos:	a)	b)	c)
Ingrediente activo	0,1%	1%	5%
Talco	39,9%	49%	35%
Caolín	60,0%	50%	60%

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

F8. Concentrados en suspensión:	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	3%	10%	25%	50%
etilenglicol	5%	5%	5%	5%
nonilfenol poliglicol éter (15 moles de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
lignosulfonato de sodio	3%	3%	4%	5%
carboximetilcelulosa	1%	1%	1%	1%
disolución acuosa al 37% de formaldehído	0,2%	0,2%	0,2%	0,2%
emulsión de aceite de silicona	0,8%	0,8%	0,8%	0,8%
agua	87%	79%	62%	38%

- 5 El ingrediente activo finamente triturado se mezcla íntimamente con los compuestos auxiliares, dando un concentrado en suspensión del que se pueden preparar suspensiones de cualquier concentración deseada por dilución con agua.

10 La invención también se refiere a un método para controlar selectivamente hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, y para el control no selectivo de malas hierbas, el cual comprende tratar las plantas útiles o el área de cultivo, o su locus, con un compuesto de fórmula I. Los cultivos de plantas útiles en los que se puede usar las composiciones según la invención incluyen especialmente cereales, en particular trigo y cebada, arroz, maíz, colza, remolacha, caña de azúcar, haba de soja, algodón, girasol, cacahuete y cultivos de plantación.

15 El término "cultivos" debe entenderse que incluye también cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO, y HPPD) como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha hecho tolerante por ejemplo a imidazolinonas, tal como imazamox, por métodos convencionales de reproducción es colza de verano (cánola) Clearfield®. Ejemplos de cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas por métodos de ingeniería genética incluyen, por ejemplo, variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®. Las malas hierbas a controlar pueden ser tanto malas

20 hierbas monocotiledóneas como dicotiledóneas, tales como, por ejemplo, Stellaria, Nasturtium, Agrostis, Digitaria, Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola y Veronica. El control de malas hierbas monocotiledóneas, en particular Agrostis, Avena, Setaria, Lolium, Echinochloa, Bromus, Alopecurus and Sorghum es muy amplio.

25 También se entiende que cultivos son aquellos que se han hecho resistentes a insectos dañinos por métodos de ingeniería genética, por ejemplo maíz Bt (resistente al taladrador del maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo del algodón) y también patatas Bt (resistentes al escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt-176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína que se forma de manera natural por las bacterias del suelo *Bacillus thuringiensis*. Ejemplos de toxinas y plantas transgénicas que son capaces de

30 sintetizar tales toxinas se describen en los documentos EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427529. Ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y su material de semilla pueden ser resistentes a herbicidas y, al mismo tiempo, también resistentes a la alimentación de

35 los insectos (acontecimientos transgénicos "apilados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de

expresar una proteína Cry3 insecticidamente activa mientras que al mismo tiempo son tolerantes al glifosato. Se entiende que el término “cultivos” también incluye cultivos obtenidos como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética y que contienen los así llamados rasgos de producción total (por ejemplo, mejor sabor, estabilidad durante el almacenamiento, contenido nutricional).

- 5 Se entiende que las áreas en cultivo incluyen tierra sobre la que las plantas de cultivo ya están creciendo, así como la tierra destinada al cultivo de esas plantas de cultivo.

Los compuestos de fórmula I según la invención también se pueden usar en combinación con otros herbicidas. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de fórmula I es uno de aquellos compuestos enumerados en las Tablas 1 a 102 más abajo. Son especialmente importantes las siguientes mezclas del compuesto de fórmula I:

- 10 compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfen-sodio, compuesto de fórmula I + aclonifen, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopirialida, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de
- 15 fórmula I + anilofós, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benazolina, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzfendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de
- 20 fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafós, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + bórax, compuesto de fórmula I + bromacilo, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinilo, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de fórmula I + butafenacilo, compuesto de fórmula I + butamifós, compuesto de fórmula I + butralina, compuesto de
- 25 fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + clorflurenol, compuesto de fórmula I + clorflurenol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + clorimurón, compuesto de
- 30 fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfurón, compuesto de fórmula I + clortal, compuesto de fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de
- 35 fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralida, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de
- 40 fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenilo, compuesto de fórmula I + orto-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + para-diclorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclorprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenican, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrin, compuesto de fórmula I + dimetenamid, compuesto de
- 50 fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de fórmula I + dimetipin, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarínico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamid, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diurón, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfuralin, compuesto de
- 55 fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifeno, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula I + etobenzanida, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flamprop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop-P, compuesto de
- 60 fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-

sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloralin, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofeno, compuesto de fórmula I + fluoroglicofen-etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metilo-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula I + fomesafeno, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amónico, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula I + HC-252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquin, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofan, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + yoxinilo, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + isourón, compuesto de fórmula I + isoxaben, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofeno, compuesto de fórmula I + lenacilo, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metabenziazurón, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S-metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzina, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalina, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazona, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfenol, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalina, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamida, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafeno, compuesto de fórmula I + pinoxadeno, compuesto de fórmula I + piperofós, compuesto de fórmula I + arsenito potásico, compuesto de fórmula I + azida potásica, compuesto de fórmula I + pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluazol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanilo, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxycarbazona, compuesto de fórmula I + propoxycarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraclonilo, compuesto de fórmula I + piraflufeno, compuesto de fórmula I + piraflufeno-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifeno, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piriftalida, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfan, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quincloxac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quinoclamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito de sodio, compuesto de fórmula I + azida sódica, compuesto de fórmula I + clorato de sodio, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio,

compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacilo, compuesto de fórmula I + terbumetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralkoxidim, compuesto de fórmula I + tri-alato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético (Nº DE REGISTRO CAS 353292-31-6), compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltofen-3-carboxílico (BAY636), compuesto de fórmula I + BAY747 (Nº DE REGISTRO CAS 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topamezona (Nº DE REGISTRO CAS 210631-68-8), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (Nº DE REGISTRO CAS 352010-68-5), y compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluorometil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

Las parejas de mezclamiento para el compuesto de fórmula I también pueden estar en forma de ésteres o sales, como se menciona por ejemplo en The Pesticide Manual, 12ª edición (BCPC), 2000.

Los compuestos de fórmula I según la invención también se pueden usar en combinación con protectores de herbicidas. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I es uno de esos compuestos listados en las Tablas 1 a 102 más abajo. Especialmente se toman en consideración las siguientes mezclas con protectores de herbicidas:

compuesto de fórmula I + cloquintocet-mexilo, compuesto de fórmula I + cloquintocet ácido y sus sales, compuesto de fórmula I + fenclorazol-etilo, compuesto de fórmula I + fenclorazol ácido y sus sales, compuesto de fórmula I + mefenpir-dietilo, compuesto de fórmula I + mefenpir diácido, compuesto de fórmula I + isoxadifen-etilo, compuesto de fórmula I + isoxadifen ácido, compuesto de fórmula I + furilazol, compuesto de fórmula I + isómero R de furilazol, compuesto de fórmula I + N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, compuesto de fórmula I + benoxacor, compuesto de fórmula I + diclormida, compuesto de fórmula I + AD-67, compuesto de fórmula I + oxabetrinilo, compuesto de fórmula I + ciometrinilo, compuesto de fórmula I + isómero Z de ciometrinilo, compuesto de fórmula I + fenclorim, compuesto de fórmula I + ciprosulfamida, compuesto de fórmula I + anhídrido naftálico, compuesto de fórmula I + flurazol, compuesto de fórmula I + CL 304.415, compuesto de fórmula I + diciclonón, compuesto de fórmula I + fluxofenim, compuesto de fórmula I + DKA-24, compuesto de fórmula I + R-29148 y compuesto de fórmula I + PPG-1292. También se puede observar un efecto de protección para las mezclas compuesto de la fórmula I + dimron, compuesto de la fórmula I + MCPA, compuesto de la fórmula I + mecoprop y compuesto de la fórmula I + mecoprop-P.

Los protectores y herbicidas mencionados anteriormente se describen, por ejemplo, en el Pesticide Manual, Twelfth Edition, British Crop Protection Council, 2000. R-29148 se describe, por ejemplo, por P. B. Goldsbrough et al., Plant Physiology, (2002), Vol. 130 p. 1497-1505 y referencias allí; PPG-1292 es conocido a partir del documento WO09211761, y la N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida es conocida desde el documento EP365484.

Se prefieren especialmente benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciprosulfamida, mefenpir-dietilo, y N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, en el que cloquintocet-mexilo es particularmente valioso.

La tasa de aplicación del protector con respecto al herbicida depende enormemente del modo de aplicación. En el caso del tratamiento del campo, generalmente se aplica de 0,001 a 5,0 kg de protector/ha, preferiblemente de 0,001 a 0,5 kg de protector/ha, y generalmente de 0,001 a 2 kg de herbicida/ha, pero preferiblemente de 0,005 a 1 kg/ha.

Las composiciones herbicidas según la invención son adecuadas para todos los métodos de aplicación habituales en agricultura, tales como, por ejemplo, aplicación pre-emergencia, aplicación post-emergencia, y tratamiento de las semillas. Dependiendo del uso pretendido, los protectores se pueden usar para tratar previamente el material de semilla de una planta de cultivo (tratando la semilla o plántulas), o se pueden introducir en el suelo antes o después de la siembra, seguido de la aplicación del compuesto de la fórmula I (sin proteger), opcionalmente en combinación con un co-herbicida. Sin embargo, también se pueden aplicar solos o junto con el herbicida, antes o después de la emergencia de las plantas. El tratamiento de las plantas o del material de semilla con el protector puede tener lugar por lo tanto en principio independientemente del momento de aplicación del herbicida. Generalmente se prefiere el tratamiento de la planta mediante aplicación simultánea de herbicida y protector (por ejemplo, en forma de una mezcla de tanque). La tasa de aplicación del protector con respecto al herbicida depende enormemente del modo de aplicación. En el caso del tratamiento del campo, generalmente se aplica de 0,001 a 5,0 kg de protector/ha, preferiblemente de 0,001 a 0,5 kg de protector/ha. En el caso de tratamiento de semillas, generalmente se aplica de

0,001 a 10 g de protector/kg de semilla, preferiblemente de 0,05 a 2 g de protector/kg de semilla. Cuando el protector se aplica en forma líquida, con empapamiento de las semillas, poco tiempo antes de la siembra, es ventajoso usar disoluciones de protector que contengan el ingrediente activo en una concentración de 1 a 10000 ppm, preferiblemente de 100 a 1000 ppm.

- 5 Se prefiere aplicar el otro herbicida junto con uno de los protectores mencionados anteriormente.

Los siguientes ejemplos ilustran la invención adicionalmente, pero no limitan la invención.

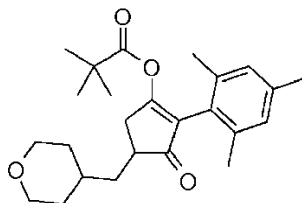
Ejemplos de preparación:

- 10 Los expertos en la técnica apreciarán que ciertos compuestos descritos más abajo son β -cetoenoles, y, como tales, pueden existir como un tautómero individual o como una mezcla de tautómeros ceto-enólicos y dicetónicos, como se describe, por ejemplo, por J. March, Advanced Organic Chemistry, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos se muestran en la Tabla T1 como un tautómero enólico individual, pero se debería inferir que esta descripción cubre tanto la forma dicetónica como cualesquiera posibles enoles que pudiesen surgir por tautomería. Además, algunos de los compuestos en la Tabla T1 y en la Tabla P1 se dibujan como enantiómeros individuales con fines de simplicidad, pero excepto que se especifiquen como enantiómeros individuales, estas estructuras se deberían interpretar como una mezcla de enantiómeros. Dentro de la sección experimental detallada, el tautómero dicetónico se escoge con fines de nomenclatura, incluso si el tautómero predominante es la forma enólica.

15 Cuando se observa más de un tautómero en RMN de protón, los datos mostrados son para la mezcla de tautómeros.

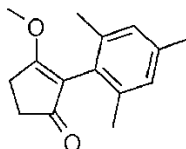
Ejemplo 1:

- 20 Preparación de éster 3-oxo-4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido 2,2-dimetil-propiónico



Etapla 1:

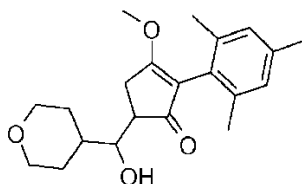
Preparación de 2-(2,4,6-trimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona



- 25 A una suspensión de 2-bromo-3-metoxi-ciclopent-2-enona (6,75 g, 35,3 mmoles), ácido 2,4,6-trimetilfenilborónico (6,99 g, 42,6 mmoles) y fosfato de potasio recientemente molido (15 g, 70,6 mmoles) en tolueno desgasificado (180 ml) bajo nitrógeno se añaden $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (159 mg, 0,71 mmoles) y S-Phos (579 mg, 1,41 mmoles), y la reacción se calienta hasta 90°C con agitación bajo N_2 durante 4 horas. La mezcla de reacción se reparte entre acetato de etilo (150 ml) y agua (150 ml), y la capa orgánica se elimina, se añade gel de sílice a la capa orgánica, el disolvente se evapora a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para dar 2-(2,4,6-trimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (6,2 g).

Etapla 2:

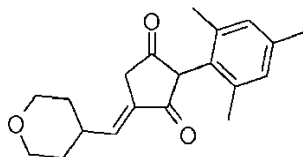
Preparación de 5-[hidroxi-(tetrahidro-piran-4-il)-metil]-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona



- 5 A una disolución de *N*-etil-*N,N*-diisopropilamina (527 μ l, 3,76 mmoles) en THF (5 ml) bajo N_2 a -78°C se añade, gota a gota, una disolución 2,5M de butil-litio en hexano (1,32 ml, 3,3 mmoles), y la reacción se deja agitar a -78°C durante 20 minutos. Esta disolución amarilla pálida se añade entonces gota a gota, durante un período de 10 minutos, a una disolución de 2-(2,4,6-trimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (691 ml, 3 mmoles) en THF (5 ml) bajo N_2 , que se enfría previamente hasta -78°C . La disolución resultante se deja agitar a -78°C durante 40 minutos. Se añade entonces en una porción una disolución de tetrahidropiran-4-carbaldehído (377 mg, 3,3 mmoles) en THF (1 ml), y la mezcla de reacción se agita a -78°C durante 30 minutos antes de dejarla calentar hasta la temperatura ambiente durante un período de 60 minutos. La reacción se paralizó mediante adición de cloruro de amonio acuoso saturado (50 ml), y se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 ml). Los orgánicos combinados se purificaron mediante cromatografía ultrarrápida para dar 5-[hidroxi-(tetrahidro-piran-4-il)-metil]-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (648 mg).

Etapla 3:

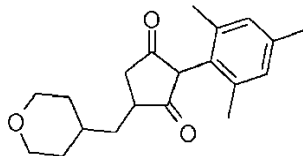
Preparación de 4-[1-(tetrahidro-piran-4-il)-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



- 15 A una disolución de 5-[hidroxi-(tetrahidro-piran-4-il)-metil]-3-metoxi-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-2-enona (408 mg, 1,18 mmoles) en acetona (2 ml) se añade una disolución 2N de ácido clorhídrico (2 ml), y la disolución resultante se calienta hasta 130°C mediante irradiación de microondas durante 90 minutos. La mezcla de reacción se diluyó con ácido clorhídrico 2N (25 ml), y se extrajo con acetato de etilo (2 x 25 ml). Los orgánicos combinados se lavan con salmuera (25 ml), se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran, y se concentran a vacío para dar 4-[1-(tetrahidro-piran-4-il)-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (302 mg).

Etapla 4:

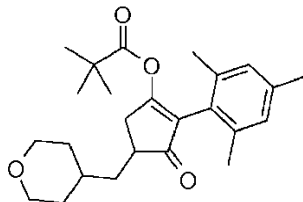
Preparación de 4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



- 25 A una disolución de 4-[1-(tetrahidro-piran-4-il)-met-(*E*)-iliden]-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (270 mg, 0,86 mmoles) en etanol (10 ml) se añade paladio al 10% sobre carbón (27 mg), y la disolución resultante se agita bajo hidrógeno (3 bares) durante 5 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se filtra entonces a través de una almohadilla de celita, que se lava con metanol, y el filtrado se concentra a vacío para dar 4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (258 mg).

Etapla 5:

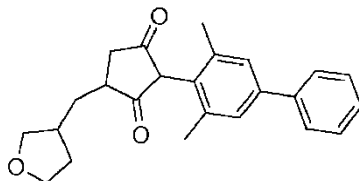
- 30 Preparación de éster 3-oxo-4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido 2,2-dimetil-propiónico



- 35 A una disolución de 4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (100 mg, 0,25 mmoles) en diclorometano (5 ml) y trietilamina (140 μ l, 1 mmol) se añade el cloruro de pivaloilo (91 μ l, 1 mmol) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agita toda la noche a temperatura ambiente. Se añade gel de sílice a la mezcla de reacción bruta, el disolvente se evapora a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para dar éster 3-oxo-4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido 2,2-dimetil-propiónico (102 mg).

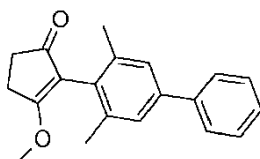
Ejemplo 2:

Preparación de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-4-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona



Etapa 1:

Preparación de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-3-metoxiciclopent-2-enona



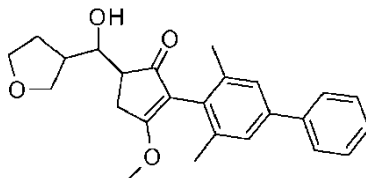
5

A una mezcla de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (1 g, 3,4 mmoles), fluoruro de cesio (1,5 g, 9,87 mmoles), ácido fenilborónico (0,5 g, 4,1 mmoles) y [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloro-paladio(II) (0,44 g, 0,54 mmoles) se añade dimetoxietano desgasificado (10 ml), y la suspensión resultante se agita en nitrógeno durante 45 minutos y después se calienta a 80°C durante 4 h. Tras enfriar hasta la temperatura ambiente, la mezcla de reacción se acidifica con ácido clorhídrico acuoso 1 N. La fase acuosa se extrae posteriormente con acetato de etilo (3 x 100 ml) y después todas las fracciones orgánicas se combinan, se secan sobre sulfato de sodio anhidro y se concentran a vacío. El material resultante se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para producir 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-3-metoxi ciclopent-2-enona (0,7 g) como un sólido blanco.

10

Etapa 2:

15 Preparación de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-5-[hidroxil-(tetrahidrofuran-3-il)-metil]-3-metoxi-ciclopent-2-enona



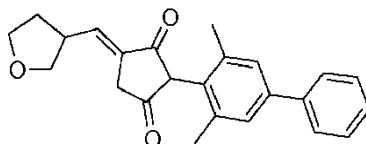
20

A una disolución de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (0,6 g, 2,05 mmoles) en tetrahidrofurano (12 ml) se añade una disolución 1 molar de bis(trimetilsilil)amido de litio en THF (2,5 ml, 2,5 mmoles) en una atmósfera de nitrógeno a -75°C. La disolución resultante se agita a -75°C durante 40 minutos, y a esta mezcla se añade durante 20 minutos una disolución de 3-tetrahidrofuranocarboxaldehído (0,42 g, 4,1 mmoles) en THF. La disolución resultante se agita a -75°C durante 2 horas. El baño de enfriamiento se retira, y la mezcla se deja alcanzar la temperatura ambiente, y después se agita durante 2 horas. La mezcla de reacción se paraliza con agua enfriada con hielo (100 ml), y se extrae con acetato de etilo (3 x 75 ml, se seca sobre sulfato de sodio anhidro, se filtra, y el filtrado se concentra a vacío para dar un residuo (1,1 g) que se usa como tal para la siguiente etapa.

25

Etapa 3:

Preparación de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-4-[1-(tetrahidrofuran-3-il)metiliden]-ciclopentano-1,3-diona



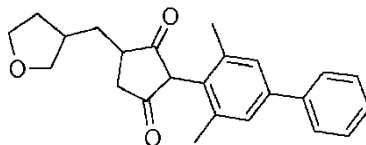
30

Una mezcla de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-5-[hidroxil-(tetrahidrofuran-3-il)-metil]-3-metoxi-ciclopent-2-enona (1,1 g, 2,8 mmoles), acetona (21 ml) y ácido clorhídrico 2N (10 ml) se calienta bajo condiciones de microondas a 130°C durante 40 minutos. El disolvente orgánico se evapora a vacío, se diluye con agua (100 ml), y se extrae con acetato de etilo (3 x 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se combinan, se lavan con agua y con salmuera, se secan sobre sulfato de sodio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a vacío. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-4-[1-(tetrahidrofuran-3-il)metiliden]-ciclopentano-1,3-diona (0,29 g).

35

Etapa 4:

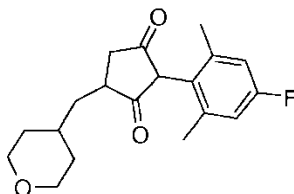
Preparación de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-4-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)-ciclopentano-1,3-diona



- 5 A una disolución de 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-4-[1-(tetrahidrofuran-3-il)metiliden]-ciclopentano-1,3-diona (0,29 g, 0,8 mmoles) en metanol (10 ml) se añade paladio al 10% sobre carbono (0,06 g), seguido de agitación bajo una atmósfera de 1 bar de hidrógeno durante 8 horas. La mezcla de reacción se filtra entonces a través de tierra de diatomeas y se concentra para dar un producto bruto que se purifica mediante cromatografía ultrarrápida (hexano/acetato de etilo) para producir 2-(3,5-dimetilbifenil-4-il)-4-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)-ciclopentano-1,3-diona (0,12 g).

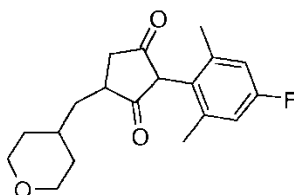
Ejemplo 3:

- 10 Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona



Etapla 1:

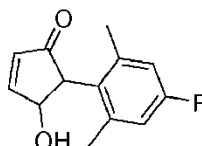
Preparación de (4-fluoro-2,6-dimetilfenil)furan-2-ilmetanol



- 15 A una disolución de 5-fluoro-2-yodo-1,3-xileno (11 g, 44 mmoles) en tetrahidrofurano (110 ml) se añade una disolución 1,6 molar de n-butil-litio en hexano (33 ml, 52 mmoles) en una atmósfera de nitrógeno a -75°C. La disolución resultante se agita a -75°C durante 60 minutos, y a esta mezcla se añade durante 20 minutos una disolución de furfural (6,3 g, 65,6 mmoles) en THF (20 ml). La disolución resultante se agita a -75°C durante 2 horas. El baño de enfriamiento se retira y la mezcla se deja alcanzar la temperatura ambiente, y después se agita durante 5 horas. La mezcla de reacción se paraliza con agua enfriada con hielo (1000 ml) y se extrae con acetato de etilo (3 x 250 ml), se seca sobre sulfato de sodio anhidro, se filtra, y el filtrado se concentra a vacío para dar un residuo que se purifica mediante cromatografía ultrarrápida (hexano/acetato de etilo) para producir (4-fluoro-2,6-dimetilfenil)furan-2-ilmetanol (6 g).

Etapla 2:

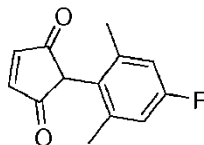
- 25 Preparación de 5-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona



- 30 Una mezcla de (4-fluoro-2,6-dimetilfenil)furan-2-ilmetanol (6 g, 27 mmoles), acetona (150 ml), agua (24 ml) y ácido ortofosfórico (0,6 ml) se calienta bajo condiciones de microondas a 120°C durante 50 minutos. El disolvente orgánico se evapora a vacío, se diluye con agua (150 ml) y se extrae con acetato de etilo (3 x 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se combinan, se lavan con agua y con salmuera, se secan sobre sulfato de sodio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a vacío. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxiciclopent-2-enona (3 g).

Etapla 3:

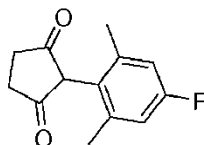
Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona



- 5 A una disolución de 5-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-ciclopent-2-enona (3 g, 13,6 mmoles) en acetona (36 ml) se añade reactivo de Jones recientemente preparado (24 ml) a 0°C. La disolución resultante se agita a 0°C durante 60 minutos. La mezcla de reacción se paraliza con alcohol isopropílico enfriado con hielo (25 ml), y se agita durante una hora. Los orgánicos se evaporan a vacío y se extraen con acetato de etilo, se secan sobre sulfato de sodio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a vacío para dar un residuo que se purifica mediante cromatografía ultrarrápida (hexano/acetato de etilo) para producir 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona (2,9 g).

Etapas 4:

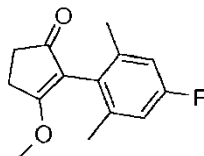
- 10 Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-ciclopentano-1,3-diona



- 15 A una disolución de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)ciclopent-4-eno-1,3-diona (2,9 g, 13,3 mmoles) en ácido acético (116 ml) se añade cinc en polvo (6 g, 91,7 mmoles) a 25-30°C. La disolución resultante se agita a 25-30°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se filtra entonces a través de tierra de diatomeas y se concentra para dar un producto bruto (2,9 g), que se usa para la siguiente etapa.

Etapas 5:

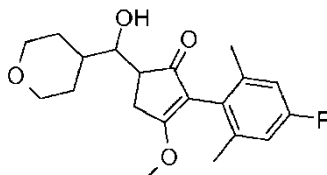
Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona



- 20 A una disolución de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-ciclopentano-1,3-diona (2,9 g, 13,3 mmoles) en tetrahidrofurano (290 ml) se añade carbonato de potasio anhidro (22 g, 159 mmoles) y yodometano (22,6 g, 159 mmoles). La mezcla resultante se agita a 25-30°C durante 16 horas. La capa orgánica se evapora, la mezcla de reacción se paraliza con agua (150 ml) y se extrae con acetato de etilo (3 x 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se combinan, se lavan con agua y con salmuera, se secan sobre sulfato de sodio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a vacío. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (2 g).

Etapas 6:

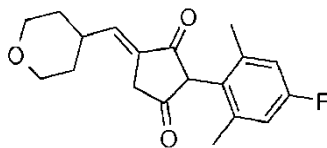
Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-3-metoxi-5-[1-tetrahidropiran-4-il-etil]-ciclopent-2-enona



- 30 A una disolución de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (0,5 g, 2,1 mmoles) en tetrahidrofurano (10 ml) se añade una disolución 1 molar de bis(trimetilsilil)amido de litio en THF (2,7 ml) en una atmósfera de nitrógeno a -75°C. La disolución resultante se agita a -75°C durante 40 minutos, y a esta mezcla se añade durante 20 minutos una disolución de 3-tetrahidrofurancarboxaldehído (0,5 g, 4,38 mmoles) en THF. La disolución resultante se agita a -75°C durante 2 horas. El baño de enfriamiento se retira, y la mezcla se deja alcanzar la temperatura ambiente y después se agita durante 2 horas. La mezcla de reacción se paraliza con agua enfriada con hielo (100 ml) y se extrae con acetato de etilo (3 x 75 ml), se seca sobre sulfato de sodio anhidro, se filtra, y el filtrado se concentra a vacío para dar un residuo (0,7 g), que se usa como tal para la siguiente etapa.

Etapa 7:

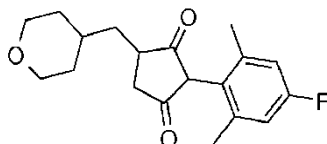
Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-[1-(tetrahidropiran-4-il)-metiliden]-ciclopentano-1,3-diona



Una mezcla de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-3-metoxi-5-[1-(tetrahidropiran-4-il)-etil]-ciclopent-2-enona (0,7 g, 2 mmoles), acetona (10 ml) y ácido clorhídrico 2N (10 ml) se calienta bajo condiciones de microondas a 130°C durante 40 minutos. El disolvente orgánico se evapora a vacío, se diluye con agua (100 ml) y se extrae con acetato de etilo (3 x 75 ml). Los extractos orgánicos combinados se combinan, se lavan con agua y con salmuera, se secan sobre sulfato de sodio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a vacío. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-[1-(tetrahidropiran-4-il)-metiliden]-ciclopentano-1,3-diona (0,23 g).

Etapa 8:

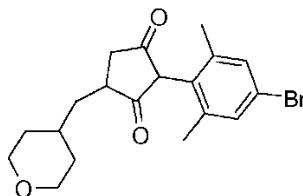
Preparación de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-[tetrahidropiran-4-ilmetil]-ciclopentano-1,3-diona



A una disolución de 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-[1-(tetrahidropiran-4-il)-metiliden]-ciclopentano-1,3-diona (0,14 g, 0,44 mmoles) en metanol (3 ml) se añade paladio al 10% sobre carbono (1,5 mg), seguido de agitación bajo una atmósfera de 1 bar de hidrógeno durante 8 horas. La mezcla de reacción se filtra entonces a través de tierra de diatomeas y se concentra para dar un producto bruto que se purifica mediante cromatografía ultrarrápida (hexano/acetato de etilo) para producir 2-(4-fluoro-2,6-dimetilfenil)-4-[tetrahidropiran-4-ilmetil]-ciclopentano-1,3-diona (0,13 g).

Ejemplo 3:

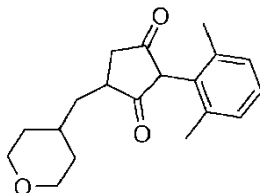
Preparación de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona



Una disolución de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-[1-(tetrahidropiran-4-il)-metiliden]-ciclopentano-1,3-diona (0,1 g, 0,26 mmoles) en metanol (100 ml) se somete a hidrogenación bajo condiciones de H-Cube, usando platino al 10% sobre carbono bajo una atmósfera de hidrógeno de 20 bares. La mezcla de reacción se concentra entonces para dar un producto bruto que se purifica mediante cromatografía ultrarrápida (hexano/acetato de etilo) para producir 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona (0,09 g).

Ejemplo 4:

Preparación de 2-(2,6-dimetilfenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona

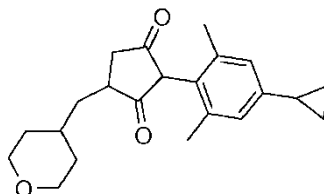


A una disolución de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-[1-(tetrahidropiran-4-il)-metiliden]-ciclopentano-1,3-diona (0,3 g, 0,8 mmoles) en metanol (5 ml) se añade paladio al 10% sobre carbono (0,06 g), seguido de agitación bajo una atmósfera de 1 bar de hidrógeno durante 8 horas. La mezcla de reacción se filtra entonces a través de tierra de

diatomeas y se concentra para dar un producto bruto que se purifica mediante cromatografía ultrarrápida (hexano/acetato de etilo) para producir 2-(2,6-dimetilfenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona (0,12 g).

Ejemplo 5:

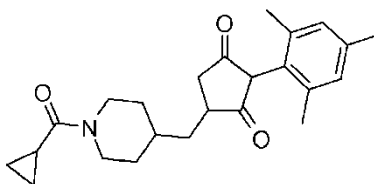
Preparación de 2-(4-ciclopropil-2,6-dimetil-fenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)-ciclopentano-1,3-diona



Una mezcla de 2-(4-bromo-2,6-dimetilfenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)ciclopentano-1,3-diona (0,1 g, 0,26 mmoles), fosfato de potasio (0,11 g, 0,53 mmoles), ácido ciclopropilborónico (0,09 g, 1,05 mmoles) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0) (0,06 g, 0,053 mmoles), tolueno (2 ml), dimetoxietano (0,5 ml) y agua (0,5 ml) se calienta bajo condiciones de microondas a 130°C durante 22 minutos. El disolvente orgánico se evapora a vacío, se diluye con agua, y se extrae con acetato de etilo (3 x 25 ml). Los extractos orgánicos combinados se combinan, se lavan con agua y con salmuera, se secan sobre sulfato de sodio anhidro, se filtran, y el filtrado se concentra a vacío. El residuo se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, seguido de HPLC preparativa, para dar 2-(4-ciclopropil-2,6-dimetil-fenil)-4-(tetrahidropiran-4-ilmetil)-ciclopentano-1,3-diona (0,012 g).

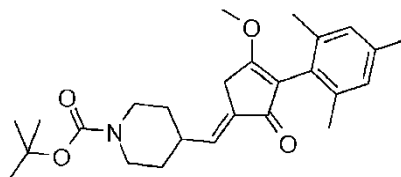
Ejemplo 6:

Preparación de 4-(1-ciclopropanocarbonil-piperidin-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



Etapla 1:

Preparación de éster terc-butílico del ácido 4-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-3-en-(E)-ilidenmetil]-piperidin-1-carboxílico

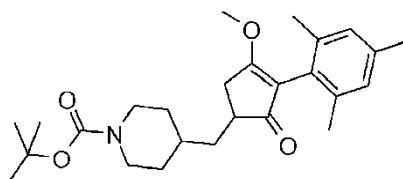


A una disolución de 2-(2,4,6-trimetilfenil)-3-metoxi-ciclopent-2-enona (9,05 g, 39,21 mmoles) en THF (150 ml) bajo N₂ a -78°C se añade, gota a gota durante un período de 30 minutos, una disolución de diisopropilamido de litio (24 ml, 43,24 mmoles, 1,8 M en hexano/THF/etilbenceno), y la reacción se deja agitar a esta temperatura durante otros 30 minutos. Se añade entonces éster *terc*-butílico del ácido 4-formil-piperidin-1-carboxílico (10 g, 43,24 mmoles) en una porción, y la reacción se mantiene a -78°C durante 30 minutos, antes de dejarla calentar gradualmente hasta la temperatura ambiente durante un período de 60 minutos. Se añade entonces *terc*-butoxido de potasio (7,28 g, 64,86 mmoles) en una porción, y la reacción se agita a temperatura ambiente durante otras 2 horas.

La reacción se paraliza mediante adición de disolución acuosa saturada de cloruro de amonio (500 ml), y se extrae con acetato de etilo (500 ml). La capa orgánica se elimina, se añade gel de sílice a la capa orgánica, el disolvente se evapora a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para dar éster *terc*-butílico del ácido 4-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-3-en-(E)-ilidenmetil]-piperidin-1-carboxílico (15,33 g).

Etapla 2:

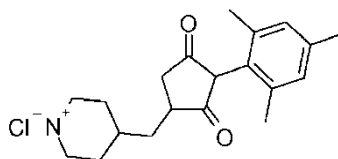
Preparación de éster terc-butílico del ácido 4-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-3-enilmetil]-piperidin-1-carboxílico



- 5 A una disolución de éster *tert*-butilico del ácido 4-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-3-en-(*E*)-ilidenmetil]-piperidin-1-carboxílico (15,33 g, 36,02 mmoles) en etanol (150 ml) se añade paladio al 10% sobre carbón activado (1,53 g), y la reacción se agita en hidrógeno (4 bares) durante horas. La reacción se filtra a través de una almohadilla de Celite, y el disolvente se elimina a presión reducida para dar éster *tert*-butilico del ácido 4-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-3-enilmetil]-piperidin-1-carboxílico (15,4 g)

Etapas 3:

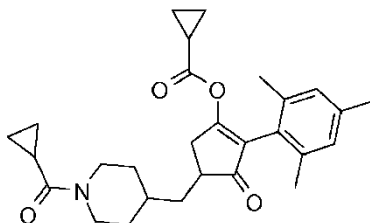
Preparación de hidrocloreto de 4-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentilmetil]-piperidinio



- 10 A una disolución de éster *tert*-butilico del ácido 4-[4-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-3-enilmetil]-piperidin-1-carboxílico (15,4 g, 36 mmoles) en acetona (100 ml) se añade HCl 2N (100 ml), y la reacción se calienta a reflujo durante 4 horas. El disolvente se elimina a presión reducida para dar hidrocloreto de 4-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentilmetil]-piperidinio (12,58 g).

Etapas 4:

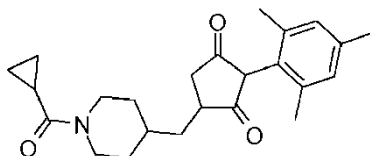
- 15 Preparación de éster 4-(1-ciclopropanocarbonil-piperidin-4-ilmetil)-3-oxo-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido ciclopropanocarboxílico



- 20 A una suspensión de hidrocloreto de 4-[2,4-dioxo-3-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentilmetil]-piperidinio (175 mg, 0,5 mmoles) en DCM (5 ml) se añade trietilamina (697 μ l, 5 mmoles), seguido de cloruro de ciclopropilcarbonilo (608 μ l, 4,5 mmoles), y la reacción se agita a temperatura ambiente durante 5 horas. Se añade gel de sílice a la reacción bruta, el disolvente se evapora a presión reducida, y el residuo se purifica mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para dar éster 4-(1-ciclopropanocarbonil-piperidin-4-ilmetil)-3-oxo-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico del ácido ciclopropanocarboxílico (162 mg).

Etapas 5:

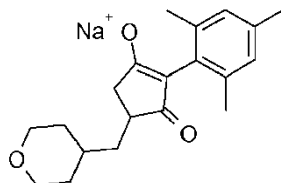
- 25 Preparación de 4-(1-ciclopropanocarbonil-piperidin-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



- 30 A una suspensión de éster 4-(1-ciclopropanocarbonil-piperidin-4-ilmetil)-3-oxo-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopent-1-enílico (162 mg, 0,36 mmoles) en metanol se añade carbonato de potasio (149 mg, 1,08 mmoles), y la reacción se agita a temperatura ambiente durante 4 horas. El disolvente se elimina a presión reducida, y el residuo se disuelve en agua (2 ml). Después se añade HCl 2N (3 ml), y el precipitado resultante se separa por filtración, se lava con hexano, y se seca al aire para dar 4-(1-ciclopropanocarbonil-piperidin-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (72 mg).

Ejemplo 7:

Preparación de la sal sódica de la 4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona



- 5 Una disolución 0,5 M de metóxido de sodio en metanol (2 ml, 1 mmol) se añade a la 4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (314 mg, 1 mmol) a temperatura ambiente en nitrógeno. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La mezcla de reacción se evaporó a presión reducida para dar la sal sódica de la 4-(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-2-(2,4,6-trimetil-fenil)-ciclopentano-1,3-diona (336 mg).

Cuando se observa más de un tautómero o confórmero rotacional en el espectro de RMN de protón, los datos mostrados más abajo son para la mezcla de isómeros y confórmeros.

Excepto que se señale de otro modo, los espectros de RMN de protón se registraron a temperatura ambiente.

- 10 Los compuestos caracterizados mediante HPLC-MS se analizaron usando uno de los tres métodos descritos más abajo.

Método A

- 15 Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando una HPLC Waters 2795 equipada con una columna Waters Atlantis dC18 (longitud de la columna 20 mm, diámetro interno de la columna 3 mm, tamaño de partículas 3 micrómetros, temperatura 40°C), un conjunto de fotodiodos Waters, y Micromass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo usando un tiempo de experimentación de tres minutos, según la siguiente tabla de gradientes:

Tiempo (min.)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	90,0	10,0	2,00
0,25	90,0	10,0	2,00
2,00	10,0	90,0	2,00
2,50	10,0	90,0	2,00
2,60	90,0	10,0	2,00
3,0	90,0	10,0	2,00
Disolvente A: H ₂ O que contiene 0,1% de HCOOH			
Disolvente B: CH ₃ CN que contiene 0,1% de HCOOH			

Método B

- 20 Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando un inyector Waters 2777 con una HPLC de microbomba 1525 equipada con una columna Waters Atlantis dC18 IS (longitud de la columna 20 mm, diámetro interno de la columna 3 mm, tamaño de partículas 3 micrómetros), un conjunto de fotodiodos Waters 2996, Waters 2420 ELSD y Micromass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo usando un tiempo de experimentación de tres minutos, según la siguiente tabla de gradientes:

Tiempo (min.)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	95,0	5	1,300
2,50	0,00	100	1,300
2,80	0,00	100	1,300
2,90	95,0	5	1,300
Disolvente A: H ₂ O con 0,05% de TFA			

Disolvente B: CH₃CN con 0,05% de TFA

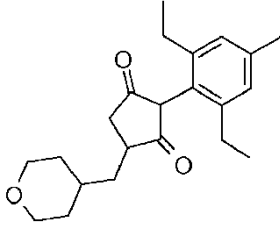
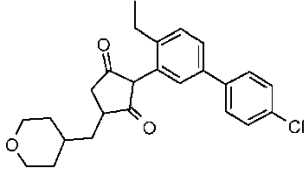
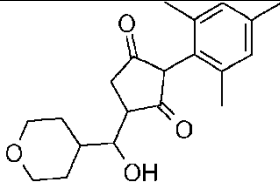
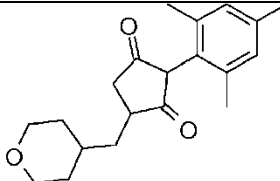
Método C

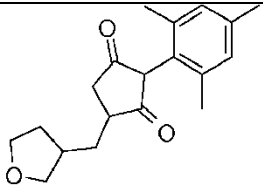
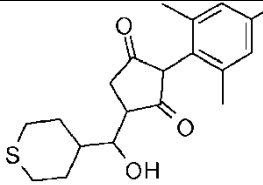
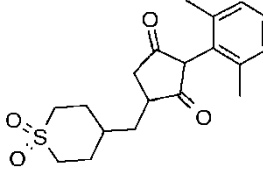
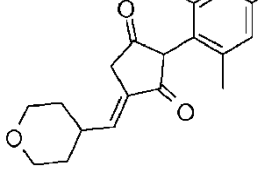
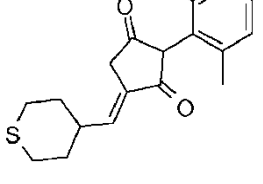
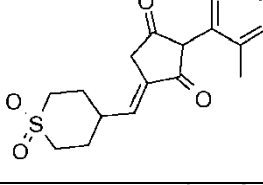
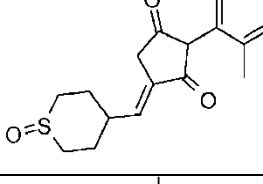
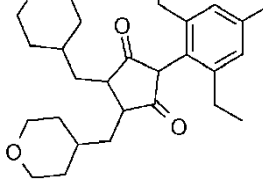
5 Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizaron usando un Thermo Finnigan Surveyor MSQ Plus equipado con una columna Waters Xterra (longitud de la columna 50 mm, diámetro interno de la columna 4,6 mm, tamaño de partículas 3,5 micrómetros, temperatura 40°C), un conjunto de fotodiodos Surveyor Plus y un MicroMass ZQ2000. El análisis se llevó a cabo usando un tiempo de experimentación de seis minutos, según la siguiente tabla de gradientes:

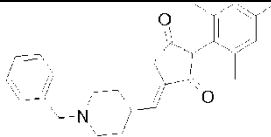
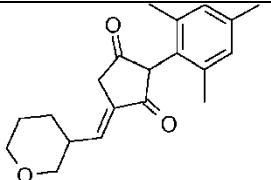
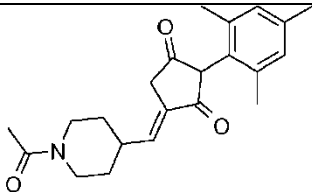
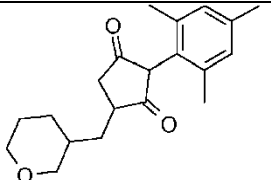
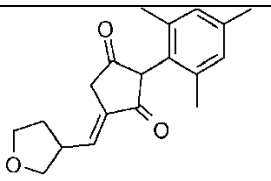
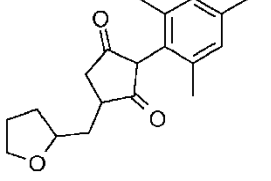
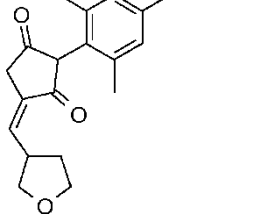
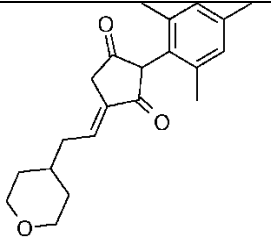
Tiempo (min.)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Caudal (ml / mn)
0,00	90,0	10,0	1,30
3,80	0,00	100	1,30
4,80	0,00	100	1,30
5,00	90,0	10,0	1,30
6,00	90,0	10,0	1,30

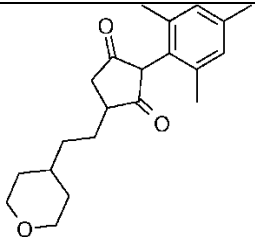
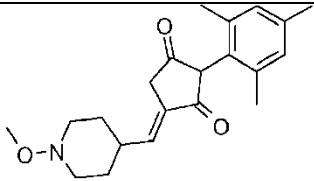
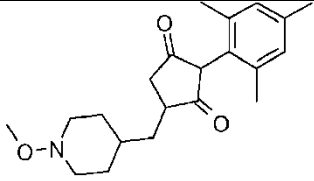
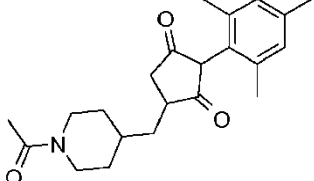
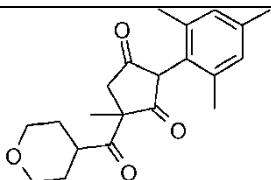
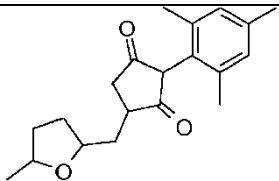
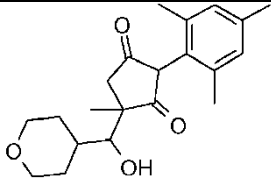
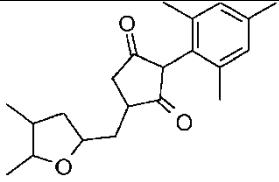
Disolvente A: H₂O con 0,05% de HCOOH
 Disolvente B: CH₃CN con 0,05% de HCOOH

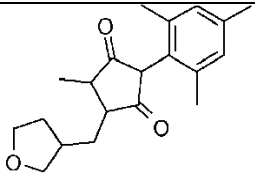
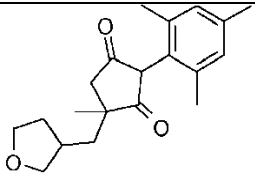
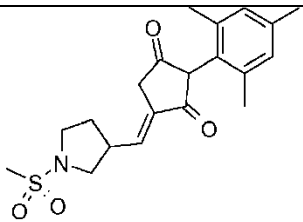
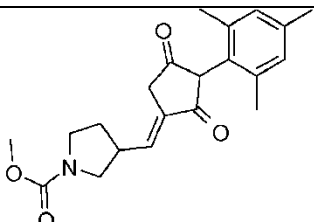
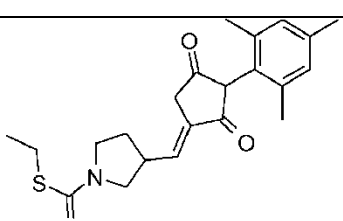
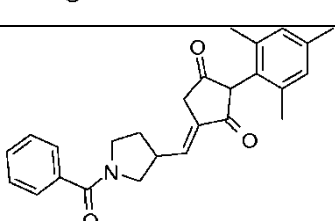
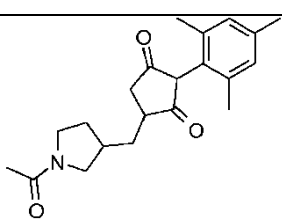
Tabla T1

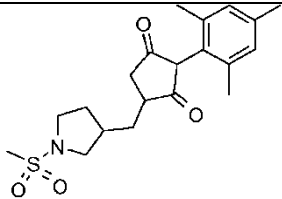
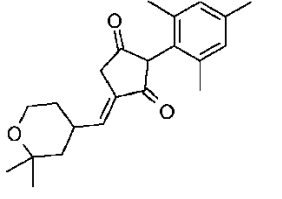
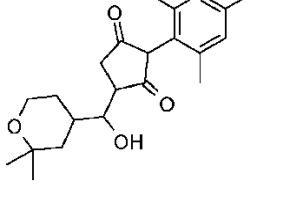
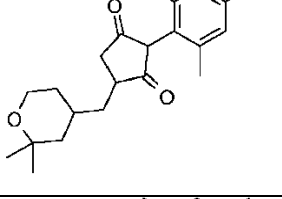
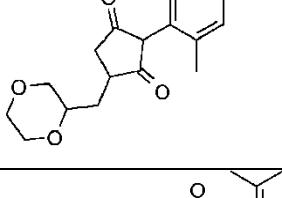
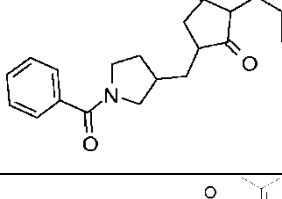
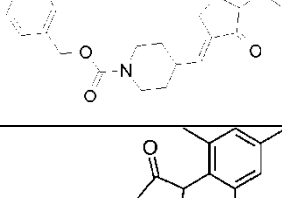
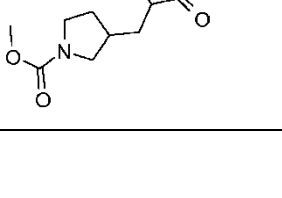
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale), LC/MS u otro dato físico
T1		δ ppm 1,05-1,10 (m, 6H), 1,29-1,45 (m, 3H), 1,49-1,57 (m, 1H), 1,62-1,72 (m, 3H), 1,90-1,96 (m, 2H), 2,32-2,39 (m, 8H), 3,36-3,43 (m, 2H), 3,93-3,99 (m, 2H)
T2		δ ppm 1,14 (t, 3H), 1,28-1,43 (m, 3H), 1,58-1,74 (m, 3H), 1,85-1,97 (m, 1H), 2,50 (c, 2H), 2,61-3,10 (m, 3 H), 3,30-3,47 (m, 2H), 3,89-4,02 (m, 2H), 7,24 (d, 1H), 7,38-7,41 (m, 2H), 7,42 (d, 1H), 7,45-7,49 (m, 2H). 7,55 (dd, 1H)
T3		δ ppm 1,50-1,58 (m, 2H), 1,66-1,82 (m, 3H), 2,09 (s, 6H), 2,27 (s, 3H), 2,32-2,43 (m, 1H), 2,69-2,82 (m, 1H), 2,96 (s, 1H), 3,35-3,48 (m, 2H), 3,67-3,76 (m, 1H), 3,99-4,11 (m, 2H), 6,90 (s, 2H)
T4		δ ppm 1,29-1,46 (m, 3H), 1,61-1,76 (m, 3H), 1,86-1,98 (m, 1H), 2,08 (d, 6H), 2,28 (s, 3H), 2,37 (d (a), 1H), 2,80-2,95 (m, 2H), 3,35-3,47 (m, 2H), 3,92-4,04 (m, 2H), 6,92 (s, 2H)

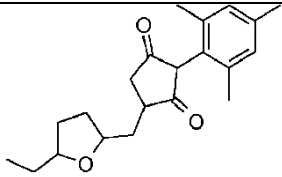
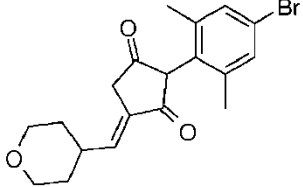
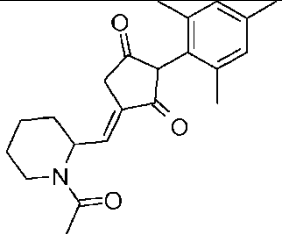
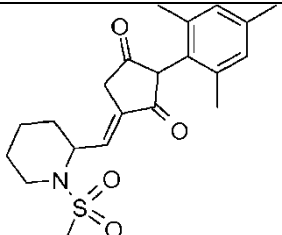
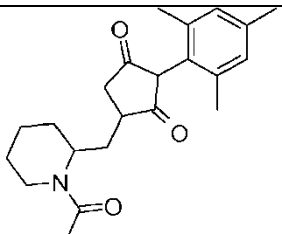
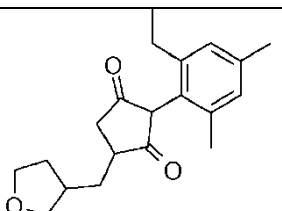
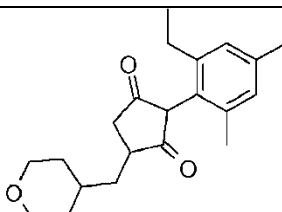
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T5		δ ppm 1,48-1,68 (m, 2H), 2,05-2,13 (m, 8H), 2,28 (s, 3H), 2,33-2,46 (m, 2H), 2,80-2,98 (m (a), 2H), 3,36-3,47 (m, 1H), 3,78 (dd, 1H), 3,86-3,92 (m, 1H), 3,95 (dd, 1H), 6,92 (s, 2H)
T6		δ ppm 1,46-1,61 (m, 2H), 1,66-1,86 (m, 1H), 1,93-2,05 (m, 2H), 2,07-2,09 (m, 6H), 2,27 (s, 3H), 2,65-2,83 (m, 6H), 2,91-3,05 (m, 1H), 3,67 (d, 1H), 6,90 (s, 2H)
T7		δ ppm 1,41-1,53 (m, 1H), 1,85-2,02 (m, 4H), 2,05-2,10 (m, 6H), 2,12-2,25 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,30-2,38 (m, 1H), 2,83-3,14 (m, 6H), 6,93 (s, 2H)
T8		δ ppm 1,51-1,73 (m, 4H), 2,10 (s, 6H), 2,29 (s, 3H), 2,40-2,55 (m, 1H), 3,13 (s, 2H), 3,48 (td, 2H), 3,92-4,06 (m, 2H), 6,01 (s, 1H), 6,94 (s, 2H)
T9		δ ppm 1,67 (m, 2H), 1,98-2,08 (m, 2H), 2,10 (s, 6H), 2,27-2,30 (m, 4H), 2,63-2,83 (m, 4H), 3,09 (s, 2H), 6,00 (d, 1H), 6,94 (s, 2H)
T10		δ ppm 2,10 (s, 6H), 2,13-2,25 (m, 5H), 2,29 (s, 3H), 2,44-2,62 (m, 1H), 2,99-3,27 (m, 6H), 6,02 (d, 1H), 6,94 (s, 2H)
T11		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 345 rt = 1,17 minutos
T12		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 441

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T13		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 402$ rt = 1,31 minutos
T14		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 313$ rt = 1,39 minutos
T15		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 354$ rt = 1,27 minutos
T16		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$ rt = 1,34 minutos
T17		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 299$ rt = 1,27 minutos
T18		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 301$ rt = 1,36 minutos
T19		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 299$ rt = 1,32 minutos
T20		δ ppm 1,19-1,38 (m, 2H), 1,52-1,72 (m, 3H), 2,05 (s, 6H), 2,03-2,07 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,94 (s, 2H), 3,24-3,30 (m, 2H), 3,79-2,83 (m, 2H), 6,21 (t, 1H), 6,87 (s, 2H)

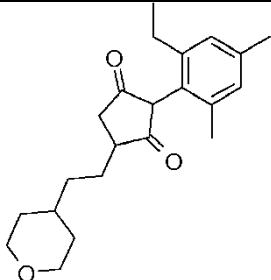
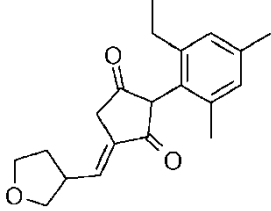
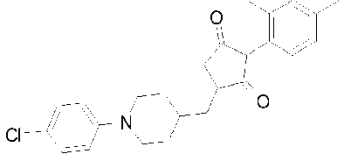
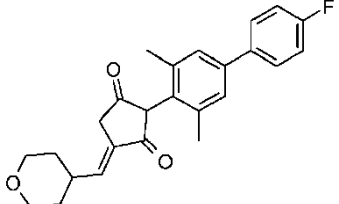
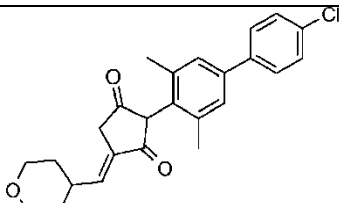
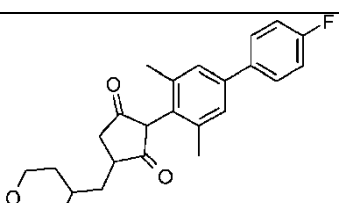
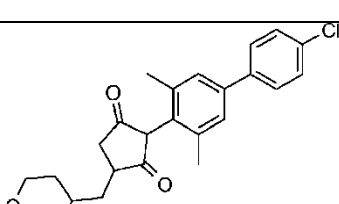
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T21		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 329$ rt = 1,34 minutos
T22		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 344$ rt = 1,27 minutos
T23		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 344$ rt = 1,19 minutos
T24		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 356$ rt = 1,29 minutos
T25		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 343$ rt = 1,33 minutos
T26		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$ rt = 1,46 minutos
T27		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 345$ rt = 1,10 minutos
T28		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 329$ rt = 1,52 minutos

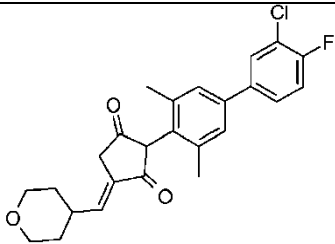
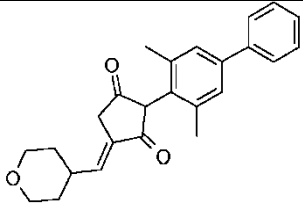
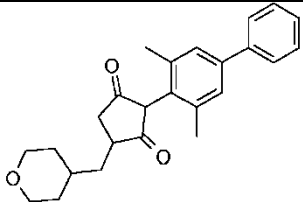
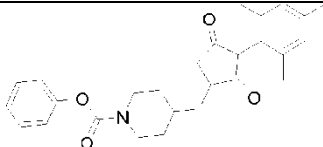
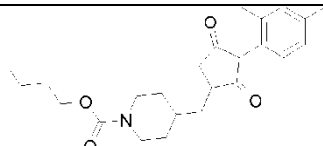
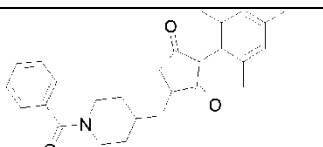
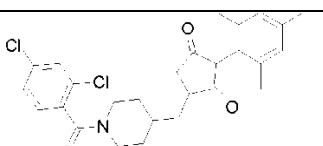
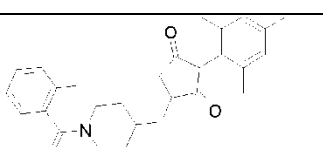
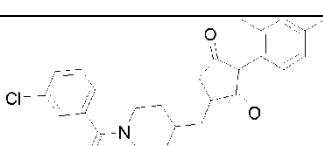
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T29		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$ rt = 1,24 minutos
T30		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$ rt = 1,21 minutos
T31		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 376$ rt = 1,29 minutos
T32		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 356$ rt = 1,36 minutos
T33		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 386$ rt = 1,51 minutos
T34		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 402$ rt = 1,42 minutos
T35		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 342$ rt = 1,21 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T36		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 378$ $\text{rt} = 1,29$ minutos
T37		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 341$ $\text{rt} = 1,44$ minutos
T38		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 359$ $\text{rt} = 1,22$ minutos
T39		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 343$ $\text{rt} = 1,42$ minutos
T40		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 317$ $\text{rt} = 1,22$ minutos
T41		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 404$ $\text{rt} = 1,41$ minutos
T42		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 446$ $\text{rt} = 1,66$ minutos
T43		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 358$ $\text{rt} = 1,34$ minutos

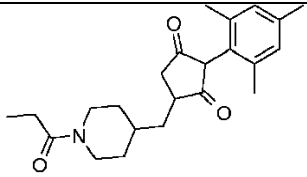
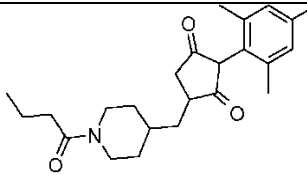
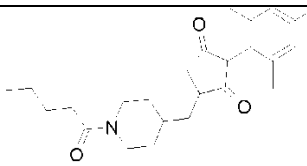
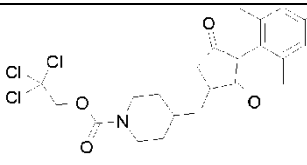
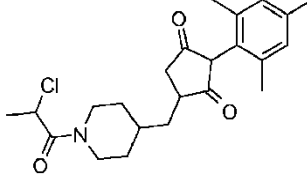
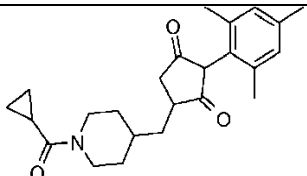
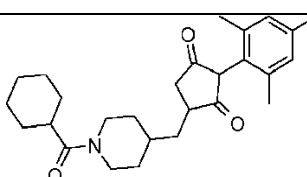
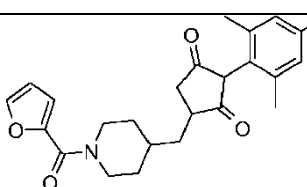
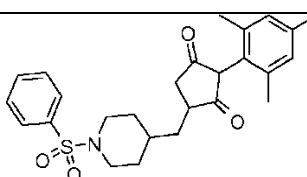
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T44		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 329$ $\text{rt} = 1,59$ minutos
T45		δ (DMSO-d_6) ppm 1,45 (m, 2H), 1,59 (m, 2H), 2,01 (s, 6H), 3,08 (s a), 3,37 (m, 2H), 3,87 (m, 2H), 5,75 (s, 1H), 6,04 (s a, 1H), 7,27 (s, 2H).
T46		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 354$ $\text{rt} = 1,32$ minutos
T47		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 390$ $\text{rt} = 1,38$ minutos
T48		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 356$ $\text{rt} = 1,38$ minutos
T49		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$ $\text{rt} = 1,34$ minutos
T50		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 329$ $\text{rt} = 1,29$ minutos

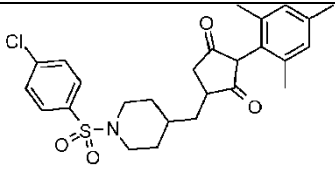
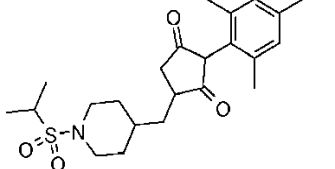
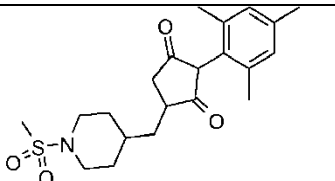
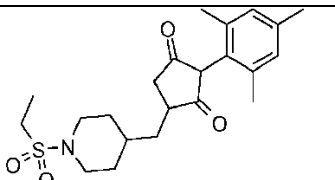
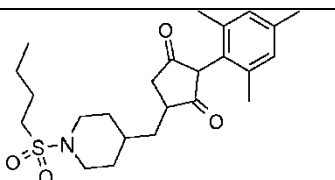
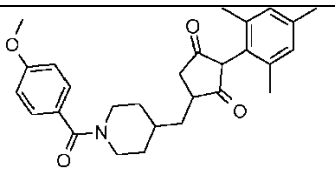
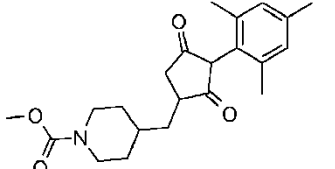
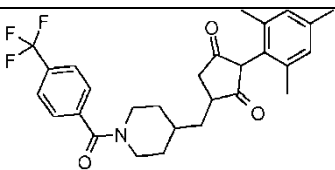
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T51		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 392$ $\text{rt} = 1,36$ minutos
T52		LC-MS (Método C) ES^- : $\text{M-H}^+ = 299$ $\text{Rt} = 4,75$ minutos Punto de fusión: $165-167^\circ\text{C}$
T53		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 314$ $\text{rt} = 1,09$ minutos
T54		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 412$ $\text{rt} = 1,63$ minutos
T55		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 414$ $\text{rt} = 1,61$ minutos
T56		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 327$ $\text{rt} = 1,39$ minutos
T57		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 341$ $\text{rt} = 1,39$ minutos

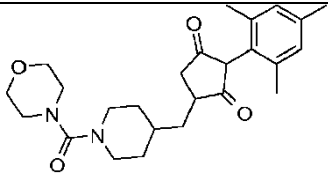
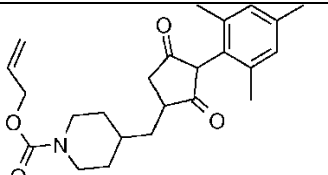
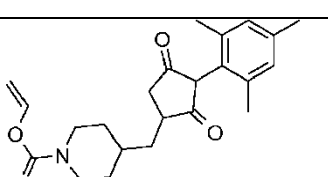
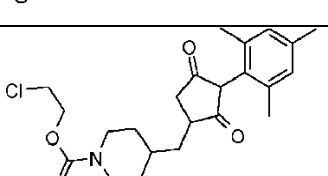
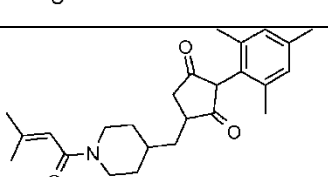
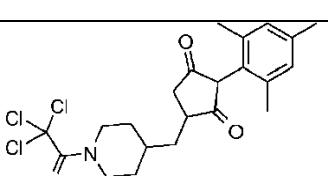
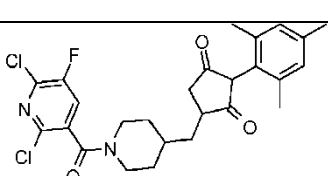
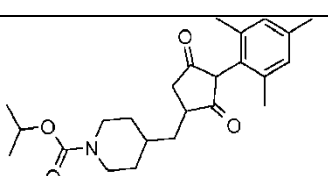
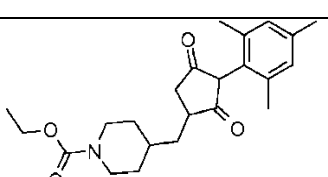
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T58		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 343$ rt = 1,34 minutos
T59		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 313$ rt = 1,29 minutos
T60		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 426, 424$ rt = 1,56 minutos
T61		Punto de fusión: 230-232 °C
T62		LC-MS (Método C) ES^- : $\text{M-H}^+ = 407, 409$ rt= 5,77 minutos Punto de fusión: 242-244 °C
T63		Punto de fusión: 115-117 °C
T64		Punto de fusión: 232-233 °C

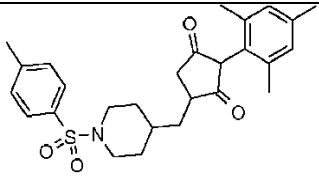
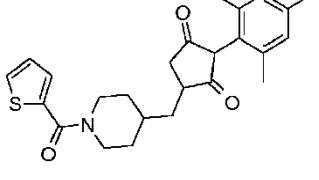
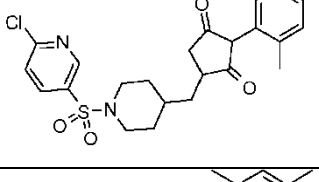
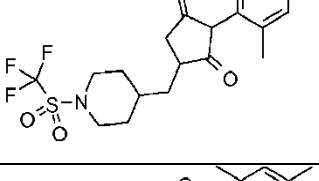
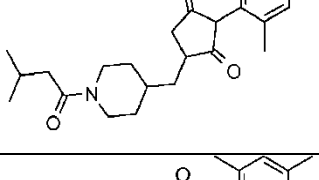
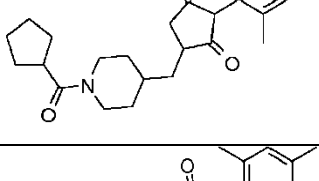
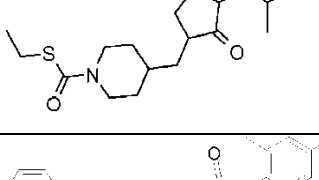
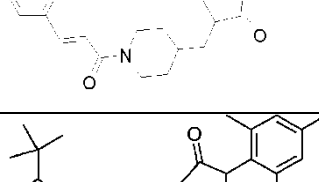
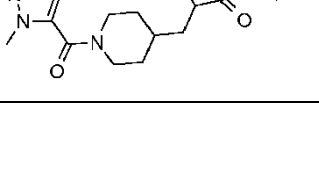
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T65		Punto de fusión: 225-227 °C
T66		LC-MS (Método C) ES^+ : $\text{MH}^+ = 375$ rt= 4,93 minutos
T67		LC-MS (Método C) ES^+ : $\text{MH}^+ = 377$ rt= 4,05 minutos
T68		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 434$ rt = 1,61 minutos
T69		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 414$ rt = 1,64 minutos
T70		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 418$ rt = 1,44 minutos
T71		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 490, 488, 486$ rt = 1,61 minutos
T72		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 432$ rt = 1,49 minutos
T73		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 454, 452$ rt = 1,55 minutos

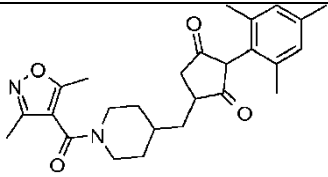
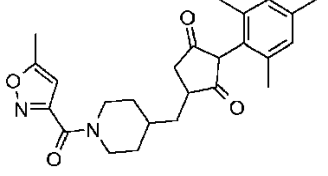
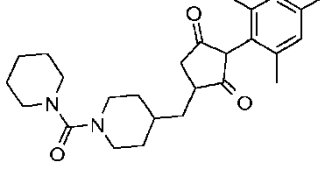
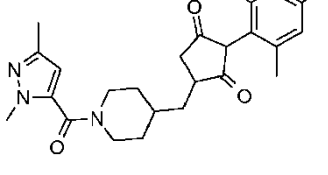
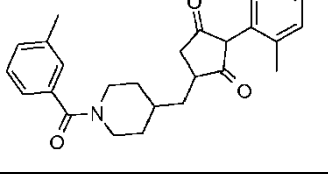
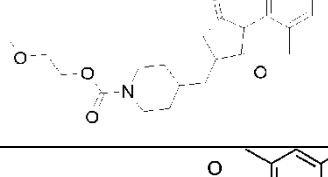
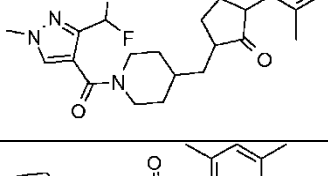
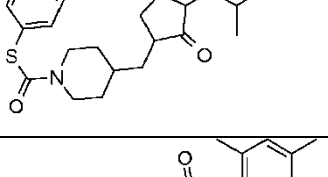
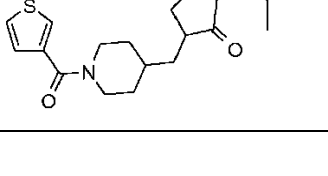
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T74		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 490, 488, 486$ rt = 1,64 minutos
T75		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 436$ rt = 1,48 minutos
T76		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 454, 452$ rt = 1,56 minutos
T77		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 494$ rt = 1,70 minutos
T78		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 432$ rt = 1,52 minutos
T79		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 398$ rt = 1,47 minutos
T80		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 384$ rt = 1,38 minutos
T81		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 386$ rt = 1,25 minutos
T82		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 432$ rt = 1,49 minutos

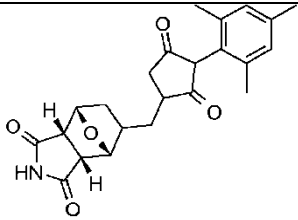
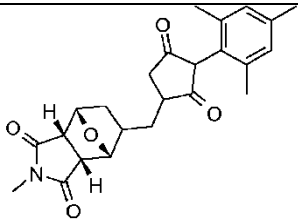
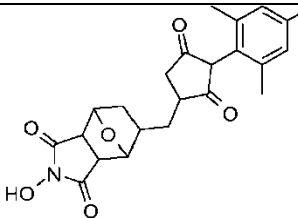
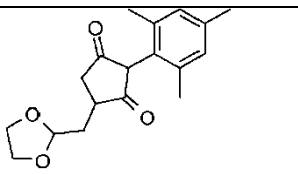
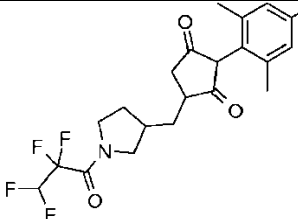
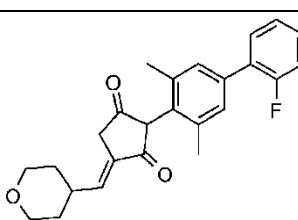
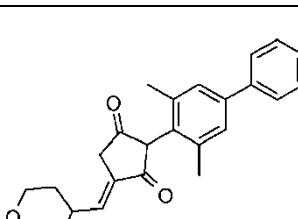
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T83		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 370$ rt = 1,32 minutos
T84		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 384$ rt = 1,39 minutos
T85		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 398$ rt = 1,48 minutos
T86		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 492, 490, 488$ rt = 1,71 minutos
T87		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 406, 404$ rt = 1,42 minutos
T88		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 382$ rt = 1,36 minutos
T89		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 424$ rt = 1,55 minutos
T90		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 408$ rt = 1,38 minutos
T91		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 454$ rt = 1,60 minutos

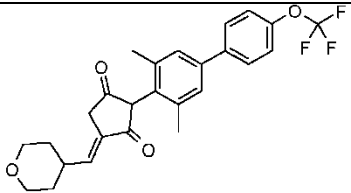
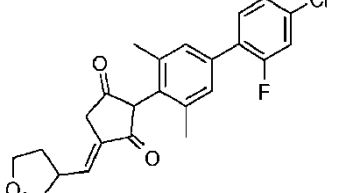
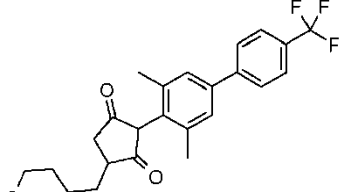
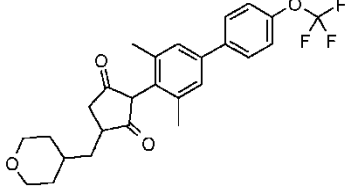
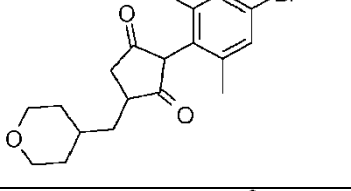
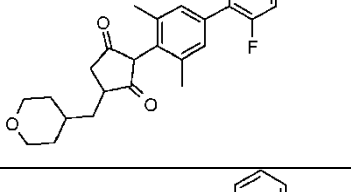
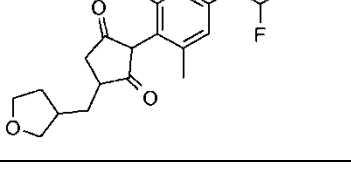
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T92		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 490, 488$ rt = 1,70 minutos
T93		
T94		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 392$ rt = 1,34 minutos
T95		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 406$ rt = 1,39 minutos
T96		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 434$ rt = 1,60 minutos
T97		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 448$ rt = 1,47 minutos
T98		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 372$ rt = 1,40 minutos
T99		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 486$ rt = 1,60 minutos

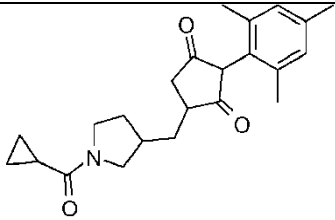
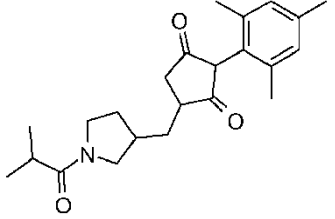
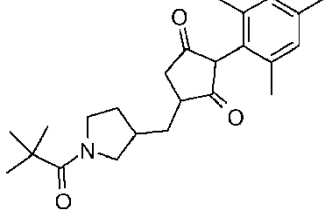
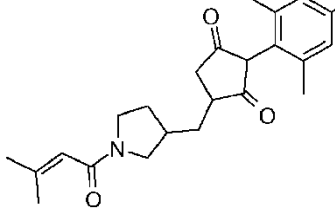
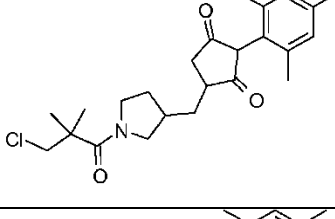
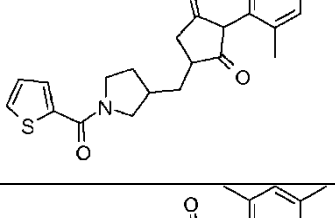
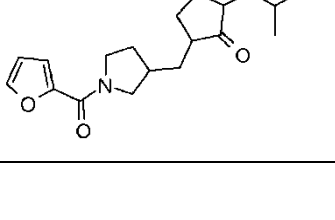
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T100		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 427$ rt = 1,31 minutos
T101		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 398$ rt = 1,51 minutos
T102		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 384$ rt = 1,51 minutos
T103		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 422, 420$ rt = 1,52 minutos
T104		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 396$ rt = 1,41 minutos
T105		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 462, 460, 458$ rt = 1,64 minutos
T106		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 509, 507, 505$ rt = 1,58 minutos
T107		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 400$ rt = 1,54 minutos
T108		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 386$ rt = 1,46 minutos

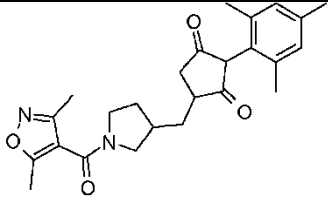
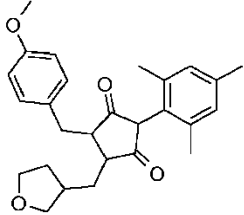
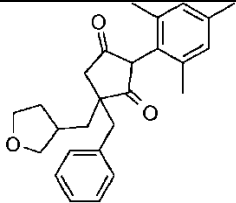
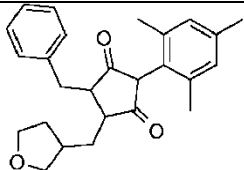
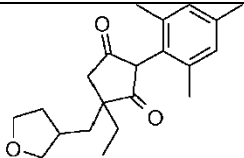
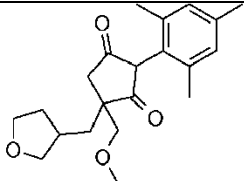
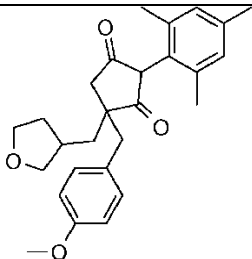
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T109		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 468$ $\text{rt} = 1,65$ minutos
T110		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 424$ $\text{rt} = 1,44$ minutos
T111		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 455, 453$ $\text{rt} = 1,42$ minutos
T112		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 446$ $\text{rt} = 1,66$ minutos
T113		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 398$ $\text{rt} = 1,44$ minutos
T114		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 410$ $\text{rt} = 1,50$ minutos
T115		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 402$ $\text{rt} = 1,56$ minutos
T116		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 444$ $\text{rt} = 1,55$ minutos
T117		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 478$ $\text{rt} = 1,54$ minutos

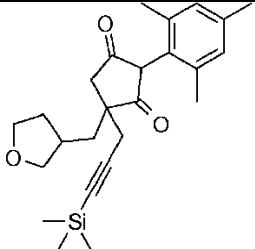
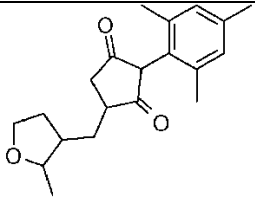
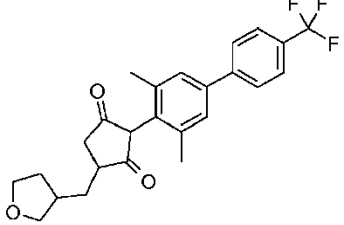
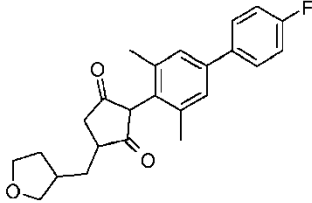
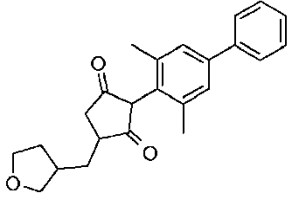
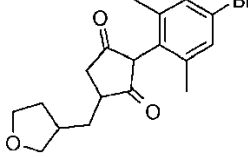
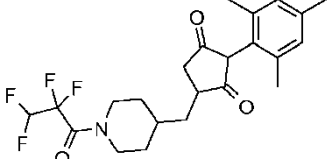
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T118		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 437$ rt = 1,35 minutos
T119		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 423$ rt = 1,42 minutos
T120		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 425$ rt = 1,51 minutos
T121		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 436$ rt = 1,36 minutos
T122		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 432$ rt = 1,52 minutos
T123		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 416$ rt = 1,38 minutos
T124		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 472$ rt = 1,35 minutos
T125		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 450$ rt = 1,67 minutos
T126		

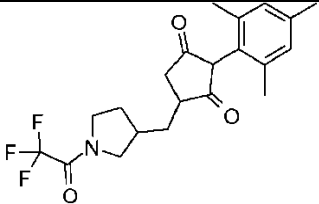
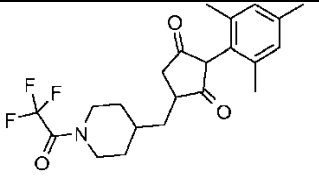
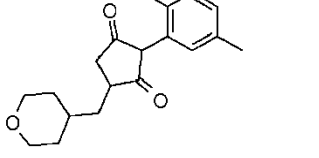
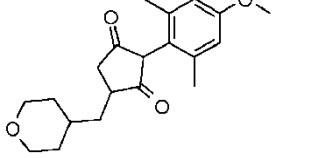
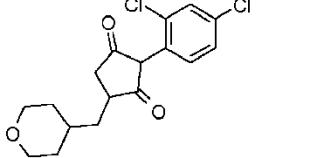
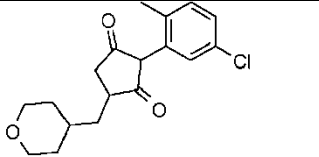
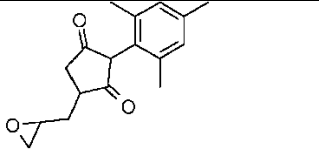
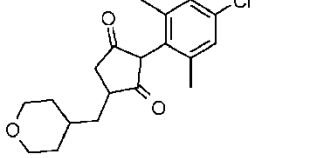
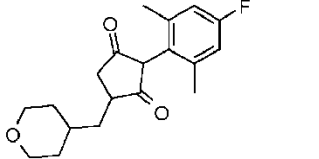
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T127		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 396$ rt = 1,12 minutos
T128		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 410$ rt = 1,21 minutos
T129		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 412$ rt = 1,14 minutos
T130		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 303$ rt = 1,26 minutos
T131		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 428$ rt = 1,46 minutos
T132		LC-MS (Método C) ES^- : $\text{M-H}^+ = 425, 427$ rt= 4,50 minutos
T133		LC-MS (Método C) ES^- : $\text{M-H}^+ = 441$ rt= 4,47 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T134		δ ppm 1,64-1,62 (m, 4H), 2,5 (m, 1H), 3,16 (s, 2H), 3,52-3,46 (m, 2H), 4,02-3,98 (m, 2H), 6,03 (d, 1H), 6,26 (s, 1H), 7,29-7,25 (m, 4H), 7,56 (d, 2H).
T135		Punto de fusión: 135-137 °C
T136		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 445 rt= 4,43 minutos
T137		δ (CD ₃ OD) ppm 1,8-1,5 (m, 6H), 2,07 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 2,67-2,59 (m, 2H), 3,2 (m, 2H), 3,35 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 7,22 (s, 2H), 7,58 (d, 2H), 7,67 (d, 2H).
T138		δ ppm 1,33 (m, 3H), 1,66 (m, 3H), 1,88 (m, 1H), 2,05 (s, 6H), 2,29 (m, 1H), 2,78 (m, 2H), 3,38 (m, 2H), 3,9 (m, 2H), 7,21 (s, 2H).
T139		δ ppm 1,4 (m, 4H), 1,7 (m, 2H), 1,9 (m, 1H), 2,18(2xs,6H), 2,4(a, 1H), 2,9 (a, 2H), 3,4 (m, 2H), 3,97 (m, 2H), 7,14 (m, 1H), 7,2 (m, 1H), 7,28 (s, 2H), 7,32 (d, 1H), 7,4 (m, 1H).
T140		LC-MS (Método C) ES ⁺ : MH ⁺ = 380 rt= 3,98 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T141		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 368$ rt = 1,29 minutos
T142		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 370$ rt = 1,39 minutos
T143		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 384$ rt = 1,39 minutos
T144		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 382$ rt = 1,36 minutos
T145		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 420, 418$ rt = 1,41 minutos
T146		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 410$ rt = 1,38 minutos
T147		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 394$ rt = 1,31 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T148		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 423$ rt = 1,27 minutos
T149		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 421$ rt = 1,65 minutos
T150		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 391$ rt = 1,62 minutos
T151		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 391$ rt = 1,65 minutos
T152		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 329$ rt = 1,45 minutos
T153		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 345$ rt = 1,38 minutos
T154		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 421$ rt = 1,60 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale), LC/MS u otro dato físico
T155		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 411 rt = 1,81 minutos
T156		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 315 rt = 1,37 minutos
T157		δ ppm 1,6 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 2,20 (s, 6H), 2,40 (m, 2H), 2,90 (a, 2H), 3,40 (m, 1H), 3,76 (m, 1H), 3,90 (m, 2H), 7,31 (s, 2H), 7,66 (m, 4H).
T158		δ ppm 1,60 (m, 2H), 2,05 (m, 2H), 2,10 (s, 6H), 2,40 (m, 2H), 2,90 (m, 2H), 3,40 (m, 1H), 3,78 (m, 1H), 3,9 (m, 2H), 7,10 (t, 2H), 7,25 (s, 2H), 7,5 (m, 2H).
T159		δ ppm 1,4 (a, 2H), 1,9 (a, 2H), 2,09 (s, 3H), 2,1 (s, 3H), 2,22 (d, 2H), 2,6 (m, 2H), 3,2 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 3,76 (m, 2H), 7,25 (s, 2H), 7,32 (d, 1H), 7,39 (t, 2H), 7,52 (d, 2H).
T160		δ ppm 1,33 (m, 3H), 1,4 (m, 1H), 1,55 (m, 1H), 1,95 (m, 1H), 2,01 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 2,10 (m, 1H), 2,29-2,17 (m, 2H), 2,75-2,57 (m, 2H), 3,3 (m, 1H), 3,69 (m, 1H), 3,82 (m, 2H), 7,17 (s, 2H),
T161		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 442 rt = 1,66 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T162		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 396$ rt = 1,51 minutos
T163		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 410$ rt = 1,59 minutos
T164		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 301$ rt = 1,31 minutos
T165		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 331$ rt = 1,27 minutos
T166		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 341, 343, 345$ rt = 1,39 minutos
T167		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 321, 323$ rt = 1,39 minutos
T168		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 273$ rt = 1,26 minutos
T169		δ ppm 1,33 (m, 3H), 1,65 (m, 3H), 1,9 (m, 1H), 2,08 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 2,35 (d, 1H), 2,85 (d, 2H), 3,39 (m, 2H), 3,97 (m, 2H), 7,09 (s, 2H).
T170		δ ppm 1,42 (m, 3H), 1,70 (m, 3H), 1,89 (m, 1H), 2,08 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 2,34 (d, 1H), 2,85 (d, 2H), 3,39 (m, 2H), 3,97 (m, 2H), 6,8 (d, 2H).

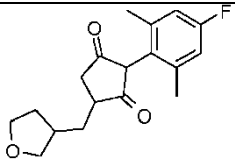
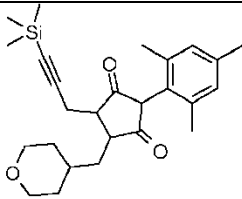
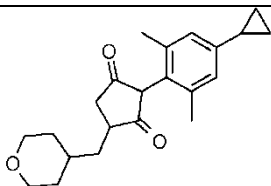
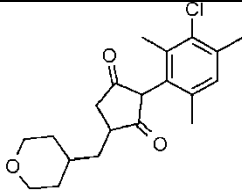
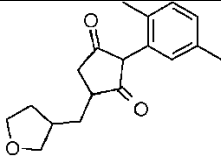
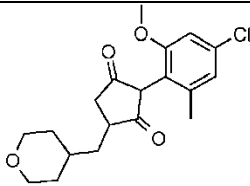
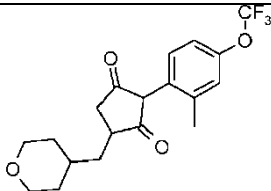
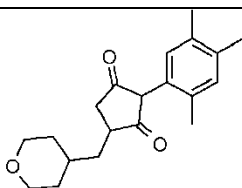
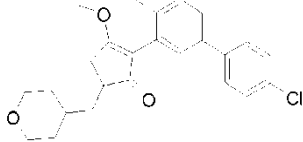
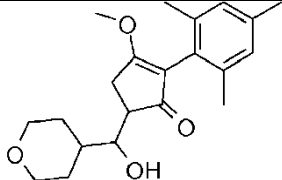
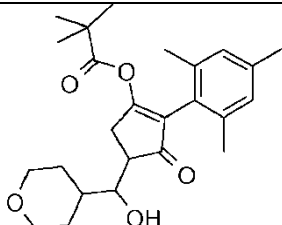
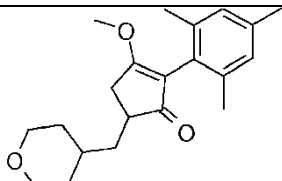
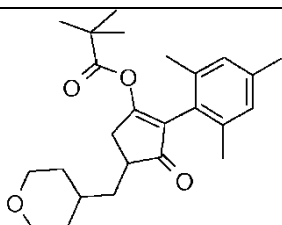
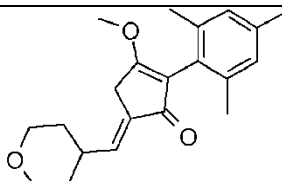
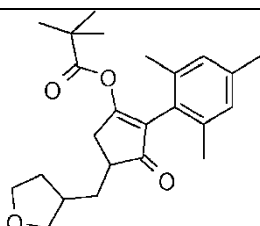
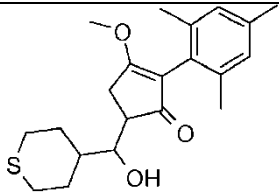
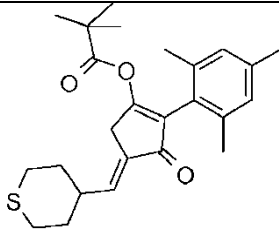
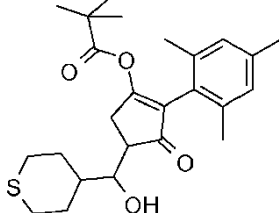
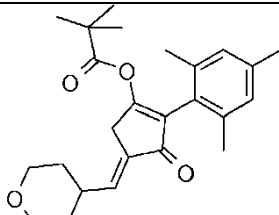
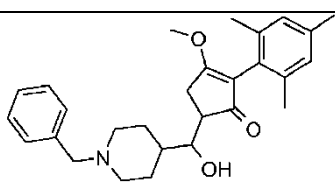
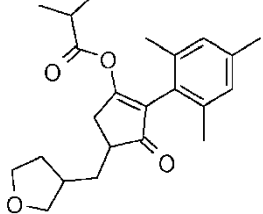
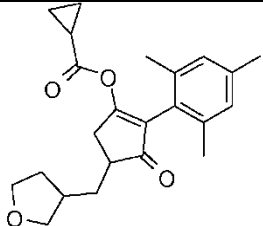
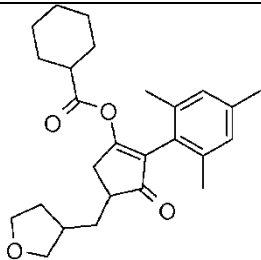
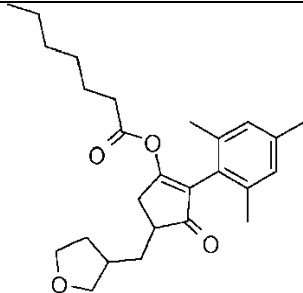
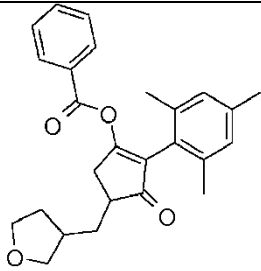
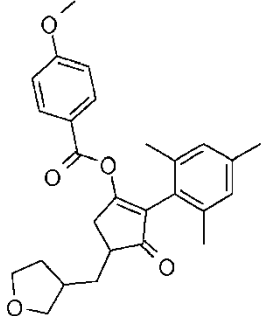
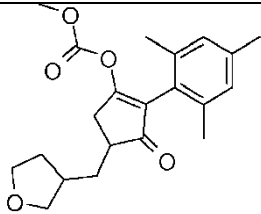
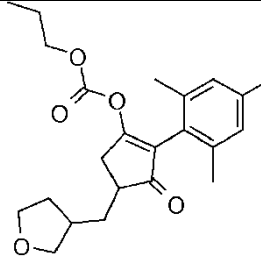
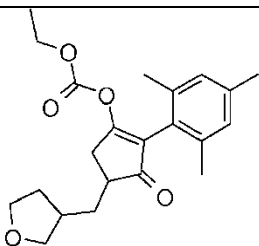
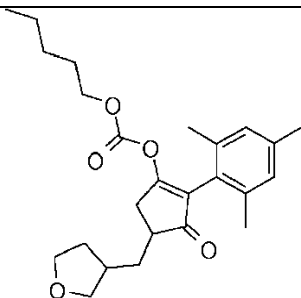
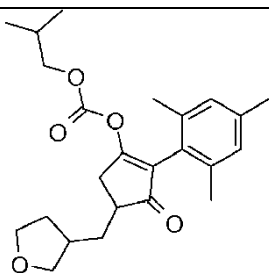
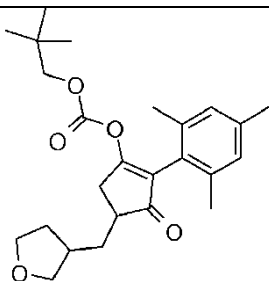
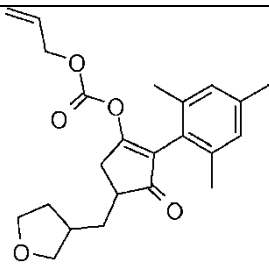
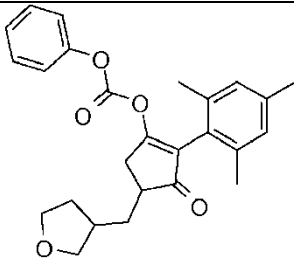
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señal), LC/MS u otro dato físico
T171		LC-MS (Método C) ES^+ : $\text{MH}^+ = 305$ rt = 3,37 minutos
T172		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 425$ rt = 1,83 minutos
T173		δ ppm 0,65 (m, 2H), 0,9 (m, 2H), 1,41 (m, 3H), 1,68 (m, 3H), 1,80 (m, 1H), 1,90 (m, 1H), 2,07 (s, 6H), 2,35 (a, 1H), 2,8 (a, 2H), 3,38 (m, 2H), 3,96 (m, 2H), 6,78 (s, 2H)
T174		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 349, 351$ rt = 1,48 minutos
T175		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 287$ rt = 1,24 minutos
T176		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 351, 353$ rt = 1,35 minutos
T177		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 371$. rt = 1,51 minutos
T178		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$. rt = 1,31 minutos

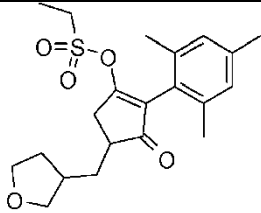
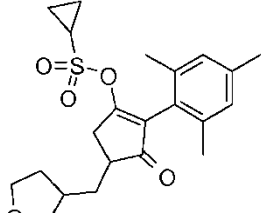
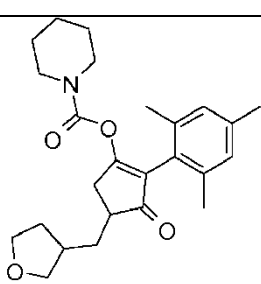
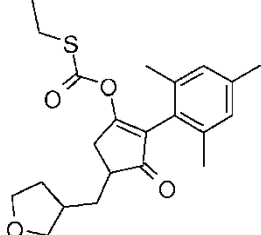
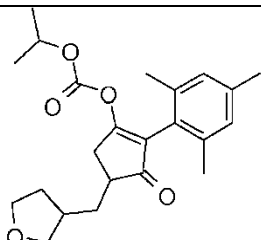
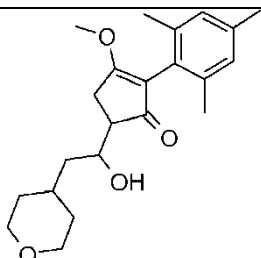
Tabla P1

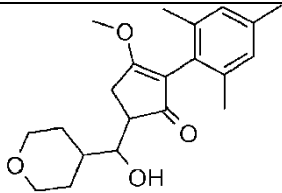
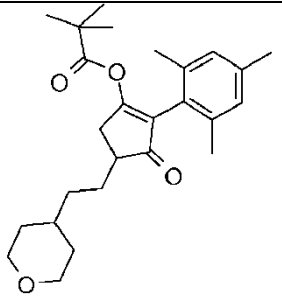
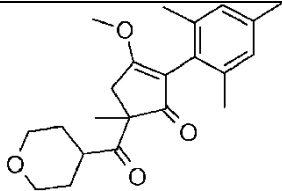
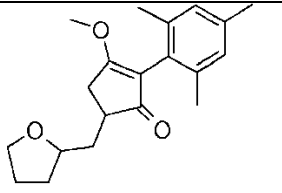
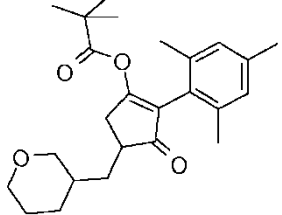
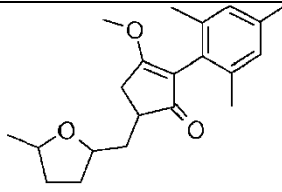
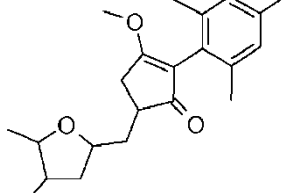
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P1		δ ppm 1,21 (t, 3H), 1,32-1,47 (m, 3H), 1,61-1,70 (m, 2H), 1,72-1,82 (m, 1H), 1,91-2,02 (m, 1H), 2,42-2,58 (m, 3H), 2,65-2,77 (m, 1H), 3,00 (dd, 1H), 3,35-3,45 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,95-4,04 (m, 2H), 7,24 (d, 1H), 7,38-7,41 (m, 2H), 7,42 (d, 1H), 7,45-7,49 (m, 2H), 7,55 (dd, 1H)
P2		δ ppm 1,53 (d, 2H), 1,70-1,79 (m, 2H), 1,85 (td, 1H), 2,09 (d, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,50 (dd, 1H), 2,73-2,81 (m, 1H), 2,83-2,94 (m, 1H), 3,33-3,48 (m, 2H), 3,61 (d, 1H), 3,74 (s, 3H), 4,01-4,10 (m, 2H), 4,58 (s, 1H), 6,87 (s, 2H)
P3		δ ppm 1,11 (s, 9H), 1,53 (d, 2H), 1,69-1,91 (m, 3H), 2,06 (d, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,78-2,86 (m, 3H), 2,89 (ddd, 1H), 3,13 (dd, 1H), 3,33-3,47 (m, 2H), 3,69 (d, 1H), 4,05 (td, 2H), 4,13 (s, 3H), 6,85 (s, 2H)
P4		δ ppm 1,28-1,46 (m, 3H), 1,61-1,70 (m, 2H), 1,70-1,79 (m, 1H), 1,94 (ddd, 1H), 2,08 (d, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,44 (dd, 1H), 2,66-2,77 (m, 1H), 2,97 (dd, 1H), 3,35-3,48 (m, 2H), 3,73 (s, 3H), 3,95-4,05 (m, 2H), 6,87 (s, 2H)
P5		δ ppm 1,09 (s, 9H), 1,28-1,46 (m, 3H), 1,59-1,69 (m, 2H), 1,70-1,77 (m, 1H), 1,94 (ddd, 1H), 2,05 (d, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,70 (dd, 1H), 2,76-2,86 (m, 1H), 3,16 (dd, 1H), 3,33-3,45 (m, 2H), 3,91-4,07 (m, 2H), 6,84 (s, 2H)
P6		δ ppm 1,58-1,68 (m, 4H), 2,12 (s, 6H), 2,27 (s, 3H), 2,37-2,54 (m, 1H), 3,09 (d, 2H), 3,49 (td, 2H), 3,55 (s, 3H), 3,96-4,07 (m, 2H), 5,92 (d, 1H), 6,88 (s, 2H)
P7		δ ppm 1,09 (s, 9H), 1,58-1,66 (m, 2H), 2,05 (d, 6H), 2,07-2,15 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,35-2,45 (m, 1H), 2,64-2,79 (m, 2H), 3,17 (dd, 1H), 3,40 (dt, 1H), 3,79 (ddd, 1H), 3,89 (ddd, 1H), 3,97 (t, 1H), 6,84 (s, 2H)

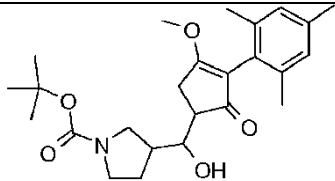
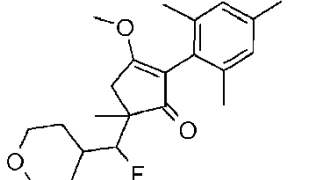
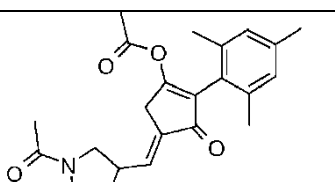
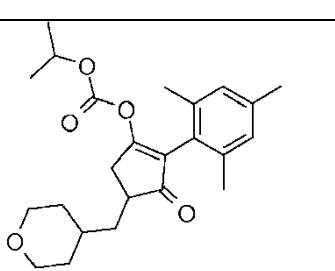
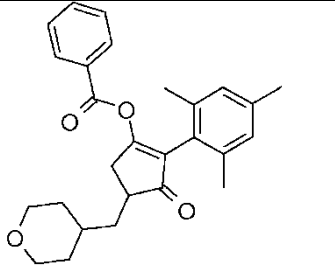
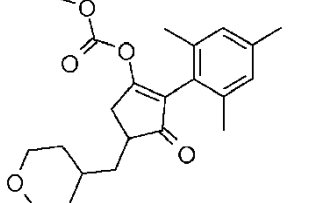
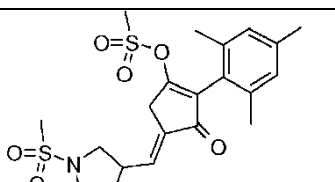
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P8		δ ppm 1,44-1,52 (m, 1H), 1,79 (ddd, 1H), 1,88-1,95 (m, 1H), 1,96-2,03 (m, 2H), 2,08 (d, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,44 (dd, 1H), 2,66-2,74 (m, 4H), 2,75-2,81 (m, 1H), 2,82-2,92 (m, 1H), 3,59 (dd, 1H), 3,74 (s, 3H), 4,75 (s, 1H), 6,87 (s, 2H)
P9		δ ppm 1,11 (s, 9H), 1,70 (ddd, 2H), 1,97-2,06 (m, 2H), 2,07 (s, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,28-2,40 (m, 1H), 2,62-2,80 (m, 4H), 3,59 (d, 2H), 6,57 (d, 1H), 6,85 (s, 2H)
P10		δ ppm 1,11 (s, 9H), 1,48-1,53 (m, 1H), 1,74-1,84 (m, 1H), 1,88-1,95 (m, 1H), 1,96-2,02 (m, 2H), 2,05 (d, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,63-2,73 (m, 4H), 2,74-2,82 (m, 1H), 2,90 (ddd, 1H), 3,10 (dd, 1H), 3,67 (dd, 1H), 4,32 (s, 1H), 6,85 (s, 2H)
P11		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 397 rt = 1,95 minutos
P12		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 315 rt = 1,37 minutos
P13		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 371 rt = 1,83 minutos
P14		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 369 rt = 1,73 minutos

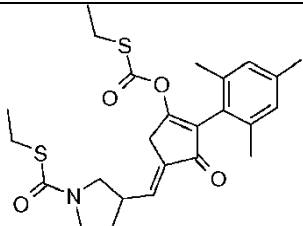
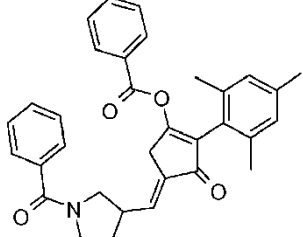
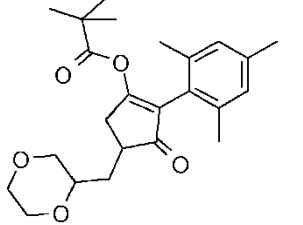
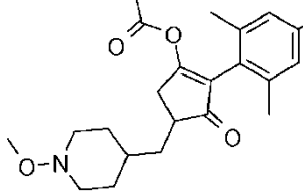
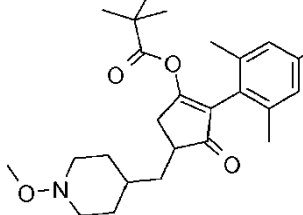
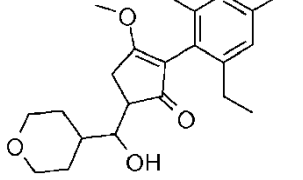
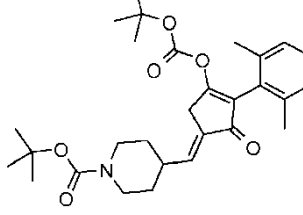
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P15		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 411$ rt = 1,95 minutos
P16		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 413$ rt = 2,00 minutos
P17		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 405$ rt = 1,81 minutos
P18		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 435$ rt = 1,81 minutos
P19		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 359$ rt = 1,56 minutos
P20		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 387$

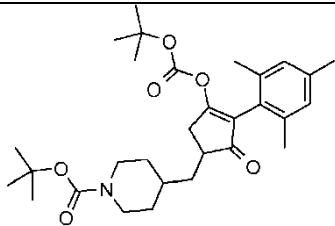
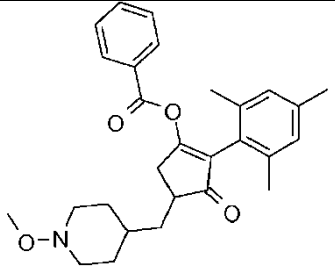
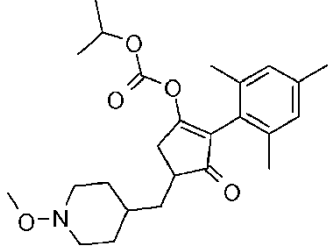
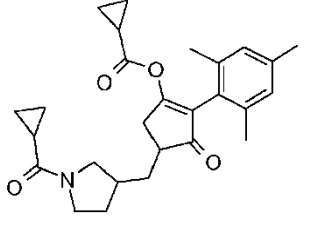
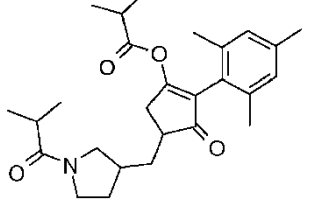
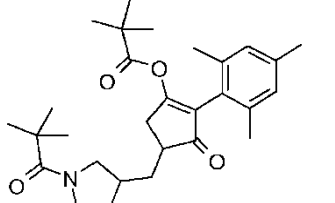
Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señal) u otro dato físico
P21		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 373
P22		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 415
P23		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 401
P24		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 415
P25		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 385
P26		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 421 rt = 1,83 minutos

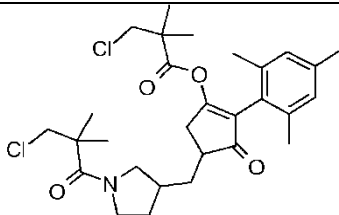
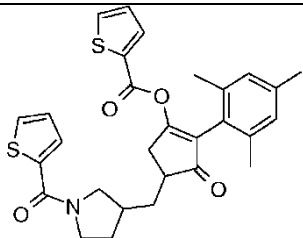
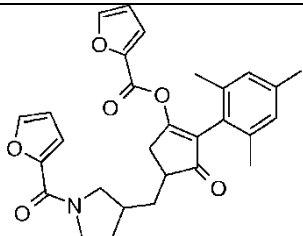
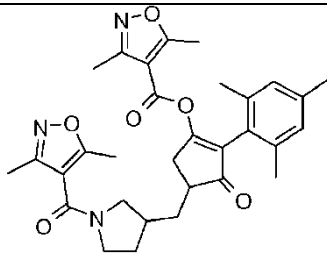
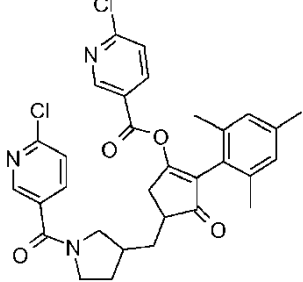
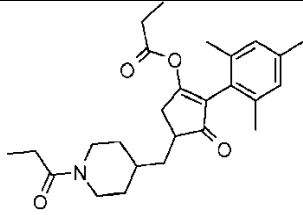
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P27		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 393$ rt = 1,64 minutos
P28		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 405$ rt = 1,66 minutos
P29		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 412$ rt = 1,73 minutos
P30		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 389$ rt = 1,83 minutos
P31		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 387$ rt = 1,78 minutos
P32		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 359$ rt = 1,26 minutos

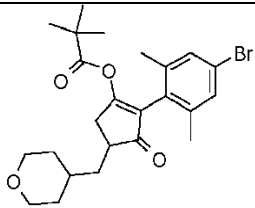
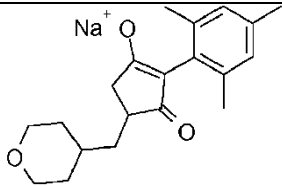
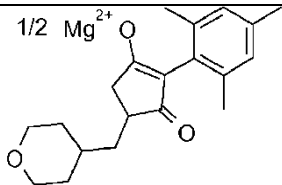
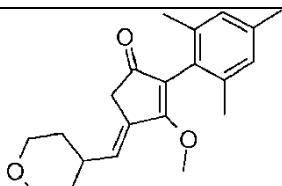
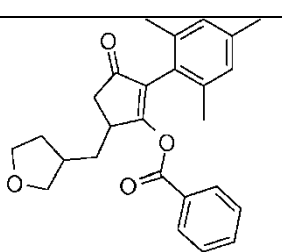
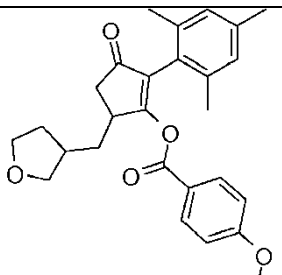
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P33		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 345$
P34		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 413$ rt = 2,03 minutos
P35		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 357$ rt = 1,44 minutos
P36		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 315$
P37		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{M}+\text{H}^+ = 399$ rt = 1,98 minutos
P38		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 329$
P39		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 342$

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P40		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 430$
P41		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 361$ rt = 1,54 minutos
P42		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 382$
P43		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 401$ rt = 1,77 minutos
P44		LC-MS (Método B) ES^+ : $\text{MH}^+ = 419$ rt = 1,84 minutos
P45		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 373$ rt = 1,64 minutos
P46		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 454$ rt = 1,51 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P47		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 474 rt = 1,91 minutos
P48		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 506 rt = 1,85 minutos
P49		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 401 rt = 1,81 minutos
P50		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 386 rt = 1,53 minutos
P51		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 428 rt = 1,88 minutos
P52		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 359 rt = 1,46 minutos
P53		LC-MS (Método A) ES^+ : MH^+ = 512 rt = 2,03 minutos

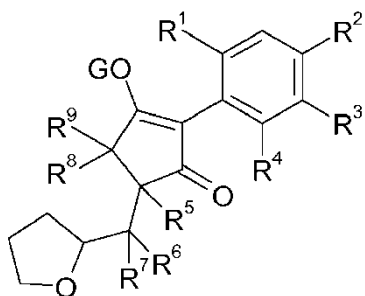
Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P54		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 514$ rt = 2,03 minutos
P55		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 448$ rt = 1,78 minutos
P56		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 430$ rt = 1,64 minutos
P57		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 436$ rt = 1,56 minutos
P58		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 440$ rt = 1,71 minutos
P59		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 468$ rt = 1,85 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 excepto que es señale) u otro dato físico
P60		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 540, 538, 536$ rt = 1,85 minutos
P61		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 520$ rt = 1,76 minutos
P62		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 488$ rt = 1,63 minutos
P63		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 546$ rt = 1,66 minutos
P64		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 582, 580, 578$ rt = 1,86 minutos
P65		LC-MS (Método A) ES^+ : $\text{MH}^+ = 426$ rt = 1,78 minutos

Número de compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ excepto que es señale) u otro dato físico
P66		Punto de fusión: 82-84 °C
P67		δ ppm (D ₂ O) 1,20-1,40 (m, 3H), 1,60-1,85 (m, 4H), 2,01 (s, 6H), 2,15-2,25 (m, 4H), 2,60-2,70 (m, 2H), 3,40-3,55 (m, 2H), 3,90-4,05 (m, 2H), 6,91 (s, 2H)
P68		δ ppm (D ₂ O) 1,20-1,40 (m, 3H), 1,60-1,85 (m, 4H), 2,01 (s, 6H), 2,15-2,25 (m, 4H), 2,60-2,70 (m, 2H), 3,40-3,55 (m, 2H), 3,90-4,05 (m, 2H), 6,91 (s, 2H)
P69		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 327 rt = 1,54 minutos
P70		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 405 rt = 1,75 minutos
P71		LC-MS (Método A) ES ⁺ : MH ⁺ = 435 rt = 1,81 minutos

Los compuestos de las siguientes Tablas 1 a 102 se pueden obtener de una manera análoga.

La Tabla 1 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en la que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1 a continuación:

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,001	CH ₃	H	H	H
1,002	CH ₃	CH ₃	H	H
1,003	CH ₃	H	CH ₃	H
1,004	CH ₃	H	H	CH ₃
1,005	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
1,006	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
1,007	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1,008	CH ₃	Cl	H	H
1,009	CH ₃	Cl	H	CH ₃
1,010	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
1,011	CH ₃	H	Cl	H
1,012	CH ₃	H	H	Cl
1,013	CH ₃	CH ₃	Cl	H
1,014	CH ₃	CH ₃	H	Cl
1,015	CH ₃	H	Cl	CH ₃
1,016	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃
1,017	CH ₃	Br	H	H
1,018	CH ₃	Br	H	CH ₃
1,019	CH ₃	Br	H	OCH ₃
1,020	CH ₃	H	Br	H
1,021	CH ₃	H	H	Br
1,022	CH ₃	CH ₃	Br	H
1,023	CH ₃	CH ₃	H	Br
1,024	CH ₃	H	Br	CH ₃
1,025	CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃
1,026	CH ₃	CH ₃ O	H	H

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,027	CH ₃	CH ₃ O	H	CH ₃
1,028	CH ₃	CH ₃ O	H	Cl
1,029	CH ₃	CH ₃ O	H	Br
1,030	CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	H
1,031	CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	CH ₃
1,032	CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	Cl
1,033	CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	Br
1,034	CH ₃	H	CH ₃ O	H
1,035	CH ₃	H	H	CH ₃ O
1,036	CH ₃	CH ₃	CH ₃ O	H
1,037	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃ O
1,038	CH ₃	H	CH ₃ O	CH ₃
1,039	CH ₃	CH ₃	CH ₃ O	CH ₃
1,040	CH ₃	-CH=CH ₂	H	CH ₃
1,041	CH ₃	CH ₃	H	-CH=CH ₂
1,042	CH ₃	-C.CH	H	CH ₃
1,043	CH ₃	CH ₃	H	-C.CH
1,044	CH ₃	-CH=CH ₂	H	-CH=CH ₂
1,045	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃
1,046	CH ₃	fenilo	H	CH ₃
1,047	CH ₃	2-fluorofenilo	H	CH ₃
1,048	CH ₃	2-clorofenilo	H	CH ₃
1,049	CH ₃	2-trifluorometilfenilo	H	CH ₃
1,050	CH ₃	2-nitrofenilo	H	CH ₃
1,051	CH ₃	2-metilfenilo	H	CH ₃
1,052	CH ₃	2-metanosulfonilfenilo	H	CH ₃
1,053	CH ₃	2-cianofenilo	H	CH ₃
1,054	CH ₃	3-fluorofenilo	H	CH ₃
1,055	CH ₃	3-clorofenilo	H	CH ₃
1,056	CH ₃	3-trifluorometilfenilo	H	CH ₃
1,057	CH ₃	3-nitrofenilo	H	CH ₃
1,058	CH ₃	3-metilfenilo	H	CH ₃
1,059	CH ₃	3-metanosulfonilfenilo	H	CH ₃
1,060	CH ₃	3-cianofenilo	H	CH ₃

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,061	CH ₃	4-fluorofenilo	H	CH ₃
1,062	CH ₃	4-clorofenilo	H	CH ₃
1,063	CH ₃	4-bromofenilo	H	CH ₃
1,064	CH ₃	4-difluorometoxifenilo	H	CH ₃
1,065	CH ₃	2-fluoro-4-clorofenilo	H	CH ₃
1,066	CH ₃	2-cloro-4-clorofenilo	H	CH ₃
1,067	CH ₃	2-metil-4-clorofenilo	H	CH ₃
1,068	CH ₃	4-trifluorometilfenilo	H	CH ₃
1,069	CH ₃	4-nitrofenilo	H	CH ₃
1,070	CH ₃	4-metilfenilo	H	CH ₃
1,071	CH ₃	4-metanosulfonilfenilo	H	CH ₃
1,072	CH ₃	4-cianofenilo	H	CH ₃
1,073	CH ₃	H	fenilo	H
1,074	CH ₃	H	2-fluorofenilo	H
1,075	CH ₃	H	2-clorofenilo	H
1,076	CH ₃	H	2-trifluorometilfenilo	H
1,077	CH ₃	H	2-nitrofenilo	H
1,078	CH ₃	H	2-metilfenilo	H
1,079	CH ₃	H	2-metilsulfonilfenilo	H
1,080	CH ₃	H	2-cianofenilo	H
1,081	CH ₃	H	3-fluorofenilo	H
1,082	CH ₃	H	3-clorofenilo	H
1,083	CH ₃	H	3-trifluorometilfenilo	H
1,084	CH ₃	H	3-nitrofenilo	H
1,085	CH ₃	H	3-metilfenilo	H
1,086	CH ₃	H	3-metilsulfonilfenilo	H
1,087	CH ₃	H	3-cianofenilo	H
1,088	CH ₃	H	4-fluorofenilo	H
1,089	CH ₃	H	4-clorofenilo	H
1,090	CH ₃	H	4-bromofenilo	H
1,091	CH ₃	H	4-difluorometoxifenilo	H
1,092	CH ₃	H	2-fluoro-4-clorofenilo	H
1,093	CH ₃	H	2-cloro-4-clorofenilo	H
1,094	CH ₃	H	2-metil-4-clorofenilo	H

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,095	CH ₃	H	4-trifluorometilfenilo	H
1,096	CH ₃	H	4-nitrofenilo	H
1,097	CH ₃	H	4-metilfenilo	H
1,098	CH ₃	H	4-metilsulfonilfenilo	H
1,099	CH ₃	H	4-cianofenilo	H
1,100	CH ₂ CH ₃	H	H	H
1,101	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H
1,102	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H
1,103	CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃
1,104	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
1,105	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
1,106	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1,107	CH ₂ CH ₃	Cl	H	H
1,108	CH ₂ CH ₃	Cl	H	CH ₃
1,109	CH ₂ CH ₃	Cl	H	OCH ₃
1,110	CH ₂ CH ₃	H	Cl	H
1,111	CH ₂ CH ₃	H	H	Cl
1,112	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	H
1,113	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	Cl
1,114	CH ₂ CH ₃	H	Cl	CH ₃
1,115	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃
1,116	CH ₂ CH ₃	Br	H	H
1,117	CH ₂ CH ₃	Br	H	CH ₃
1,118	CH ₂ CH ₃	Br	H	OCH ₃
1,119	CH ₂ CH ₃	H	Br	H
1,120	CH ₂ CH ₃	H	H	Br
1,121	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Br	H
1,122	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	Br
1,123	CH ₂ CH ₃	H	Br	CH ₃
1,124	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃
1,125	CH ₂ CH ₃	CH ₃ O	H	H
1,126	CH ₂ CH ₃	CH ₃ O	H	CH ₃
1,127	CH ₂ CH ₃	CH ₃ O	H	Cl
1,128	CH ₂ CH ₃	CH ₃ O	H	Br

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,129	CH ₂ CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	H
1,130	CH ₂ CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	CH ₃
1,131	CH ₂ CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	Cl
1,132	CH ₂ CH ₃	CH ₃ CH ₂ O	H	Br
1,133	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃ O	H
1,134	CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃ O
1,135	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃ O	H
1,136	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃ O
1,137	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃ O	CH ₃
1,138	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃ O	CH ₃
1,139	CH ₂ CH ₃	-CH=CH ₂	H	CH ₃
1,140	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	-CH=CH ₂
1,141	CH ₂ CH ₃	-C.CH	H	CH ₃
1,142	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	-C.CH
1,143	CH ₂ CH ₃	-CH=CH ₂	H	-CH=CH ₂
1,144	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃
1,145	CH ₂ CH ₃	fenilo	H	CH ₃
1,146	CH ₂ CH ₃	2-fluorofenilo	H	CH ₃
1,147	CH ₂ CH ₃	2-clorofenilo	H	CH ₃
1,148	CH ₂ CH ₃	2-trifluorometilfenilo	H	CH ₃
1,149	CH ₂ CH ₃	2-nitrofenilo	H	CH ₃
1,150	CH ₂ CH ₃	2-metilfenilo	H	CH ₃
1,151	CH ₂ CH ₃	2-metilsulfonilfenilo	H	CH ₃
1,152	CH ₂ CH ₃	2-cianofenilo	H	CH ₃
1,153	CH ₂ CH ₃	3-fluorofenilo	H	CH ₃
1,154	CH ₂ CH ₃	3-clorofenilo	H	CH ₃
1,155	CH ₂ CH ₃	3-trifluorometilfenilo	H	CH ₃
1,156	CH ₂ CH ₃	3-nitrofenilo	H	CH ₃
1,157	CH ₂ CH ₃	3-metilfenilo	H	CH ₃
1,158	CH ₂ CH ₃	3-metilsulfonilfenilo	H	CH ₃
1,159	CH ₂ CH ₃	3-cianofenilo	H	CH ₃
1,160	CH ₂ CH ₃	4-fluorofenilo	H	CH ₃
1,161	CH ₂ CH ₃	4-clorofenilo	H	CH ₃
1,162	CH ₂ CH ₃	4-bromofenilo	H	CH ₃

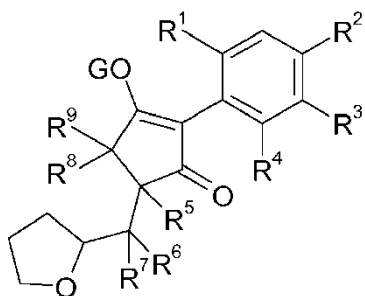
ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,163	CH ₂ CH ₃	4-difluorometoxifenilo	H	CH ₃
1,164	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-clorofenilo	H	CH ₃
1,165	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-clorofenilo	H	CH ₃
1,166	CH ₂ CH ₃	2-metil-4-clorofenilo	H	CH ₃
1,167	CH ₂ CH ₃	4-trifluorometilfenilo	H	CH ₃
1,168	CH ₂ CH ₃	4-nitrofenilo	H	CH ₃
1,169	CH ₂ CH ₃	4-metilfenilo	H	CH ₃
1,170	CH ₂ CH ₃	4-metilsulfonilfenilo	H	CH ₃
1,171	CH ₂ CH ₃	4-cianofenilo	H	CH ₃
1,172	CH ₂ CH ₃	H	fenilo	H
1,173	CH ₂ CH ₃	H	2-fluorofenilo	H
1,174	CH ₂ CH ₃	H	2-clorofenilo	H
1,175	CH ₂ CH ₃	H	2-trifluorometilfenilo	H
1,176	CH ₂ CH ₃	H	2-nitrofenilo	H
1,177	CH ₂ CH ₃	H	2-metilfenilo	H
1,178	CH ₂ CH ₃	H	2-metilsulfonilfenilo	H
1,179	CH ₂ CH ₃	H	2-cianofenilo	H
1,180	CH ₂ CH ₃	H	3-fluorofenilo	H
1,181	CH ₂ CH ₃	H	3-clorofenilo	H
1,182	CH ₂ CH ₃	H	3-trifluorometilfenilo	H
1,183	CH ₂ CH ₃	H	3-nitrofenilo	H
1,184	CH ₂ CH ₃	H	3-metilfenilo	H
1,185	CH ₂ CH ₃	H	3-metilsulfonilfenilo	H
1,186	CH ₂ CH ₃	H	3-cianofenilo	H
1,187	CH ₂ CH ₃	H	4-fluorofenilo	H
1,188	CH ₂ CH ₃	H	4-clorofenilo	H
1,189	CH ₂ CH ₃	H	4-bromofenilo	H
1,190	CH ₂ CH ₃	H	4-difluorometoxifenilo	H
1,191	CH ₂ CH ₃	H	2-fluoro-4-clorofenilo	H
1,192	CH ₂ CH ₃	H	2-cloro-4-clorofenilo	H
1,193	CH ₂ CH ₃	H	2-metil-4-clorofenilo	H
1,194	CH ₂ CH ₃	H	4-trifluorometilfenilo	H
1,195	CH ₂ CH ₃	H	4-nitrofenilo	H
1,196	CH ₂ CH ₃	H	4-metilfenilo	H

Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,197	CH ₂ CH ₃	H	4-metilsulfonilfenilo	H
1,198	CH ₂ CH ₃	H	4-cianofenilo	H
1,199	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
1,200	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
1,201	CH ₂ CH ₃	Cl	H	CH ₂ CH ₃
1,202	CH ₂ CH ₃	Br	H	CH ₂ CH ₃
1,203	CH ₂ CH ₃	NO ₂	H	CH ₂ CH ₃
1,204	CH ₂ CH ₃	CH ₃ O	H	CH ₂ CH ₃
1,205	CH ₂ CH ₃	CH ₃ S	H	CH ₂ CH ₃
1,206	CH ₂ CH ₃	CH ₃ SO ₂	H	CH ₂ CH ₃
1,207	CH ₂ CH ₃	CH ₂ =CH	H	CH ₂ CH ₃
1,208	CH ₂ CH ₃	-C.CH	H	CH ₂ CH ₃
1,209	CH ₂ CH ₃	fenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,210	CH ₂ CH ₃	2-fluorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,211	CH ₂ CH ₃	2-clorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,212	CH ₂ CH ₃	2-trifluorometilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,213	CH ₂ CH ₃	2-nitrofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,214	CH ₂ CH ₃	2-metilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,215	CH ₂ CH ₃	2-metilsulfonilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,216	CH ₂ CH ₃	2-cianofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,217	CH ₂ CH ₃	3-fluorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,218	CH ₂ CH ₃	3-clorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,219	CH ₂ CH ₃	3-trifluorometilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,220	CH ₂ CH ₃	3-nitrofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,221	CH ₂ CH ₃	3-metilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,222	CH ₂ CH ₃	3-metilsulfonilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,223	CH ₂ CH ₃	3-cianofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,224	CH ₂ CH ₃	4-fluorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,225	CH ₂ CH ₃	4-clorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,226	CH ₂ CH ₃	4-bromofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,227	CH ₂ CH ₃	4-difluorometoxifenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,228	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-clorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,229	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-clorofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,230	CH ₂ CH ₃	2-metil-4-clorofenilo	H	CH ₂ CH ₃

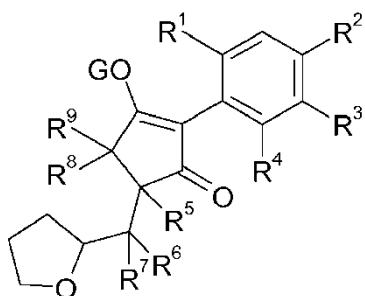
Número de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
1,231	CH ₂ CH ₃	4-trifluorometilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,232	CH ₂ CH ₃	4-nitrofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,233	CH ₂ CH ₃	4-metilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,234	CH ₂ CH ₃	4-metilsulfonilfenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,235	CH ₂ CH ₃	4-cianofenilo	H	CH ₂ CH ₃
1,236	OCH ₃	H	fenilo	H
1,237	OCH ₃	H	2-fluorofenilo	H
1,238	OCH ₃	H	2-clorofenilo	H
1,239	OCH ₃	H	2-trifluorometilfenilo	H
1,240	OCH ₃	H	2-nitrofenilo	H
1,241	OCH ₃	H	2-metilfenilo	H
1,242	OCH ₃	H	2-metilsulfonilfenilo	H
1,243	OCH ₃	H	2-cianofenilo	H
1,244	OCH ₃	H	3-fluorofenilo	H
1,245	OCH ₃	H	3-clorofenilo	H
1,246	OCH ₃	H	3-trifluorometilfenilo	H
1,247	OCH ₃	H	3-nitrofenilo	H
1,248	OCH ₃	H	3-metilfenilo	H
1,249	OCH ₃	H	3-metilsulfonilfenilo	H
1,250	OCH ₃	H	3-cianofenilo	H
1,251	OCH ₃	H	4-fluorofenilo	H
1,252	OCH ₃	H	4-clorofenilo	H
1,253	OCH ₃	H	4-bromofenilo	H
1,254	OCH ₃	H	4-difluorometoxifenilo	H
1,255	OCH ₃	H	2-fluoro-4-clorofenilo	H
1,256	OCH ₃	H	2-cloro-4-clorofenilo	H
1,257	OCH ₃	H	2-metil-4-clorofenilo	H
1,258	OCH ₃	H	4-trifluorometilfenilo	H
1,259	OCH ₃	H	4-nitrofenilo	H
1,260	OCH ₃	H	4-metilfenilo	H
1,261	OCH ₃	H	4-metilsulfonilfenilo	H
1,262	OCH ₃	H	4-cianofenilo	H

La Tabla 2 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



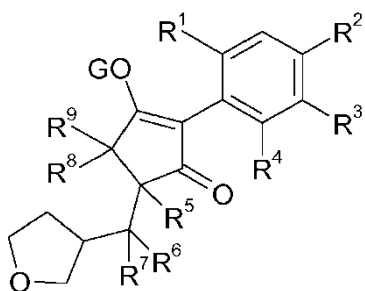
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 3 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



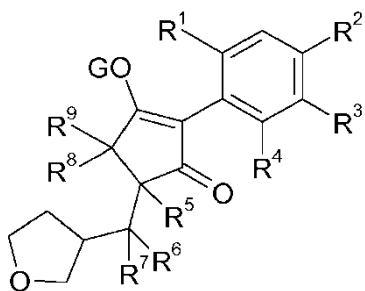
- 5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 4 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

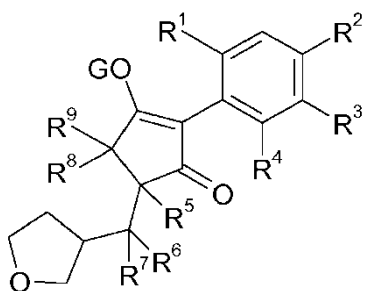
La Tabla 5 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

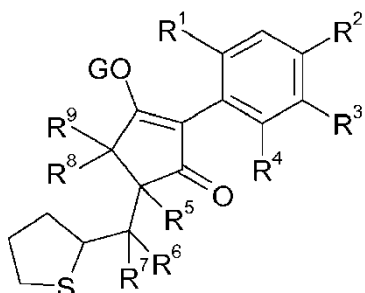
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 6 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



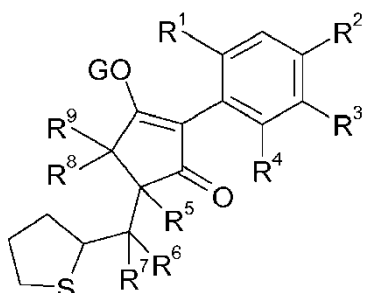
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 7 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



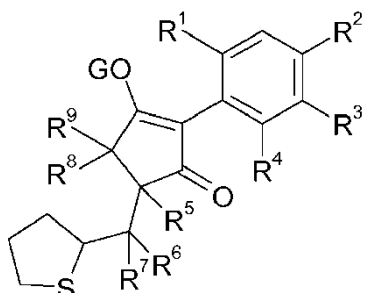
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 8 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

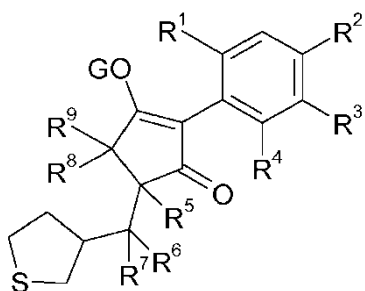
La Tabla 9 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

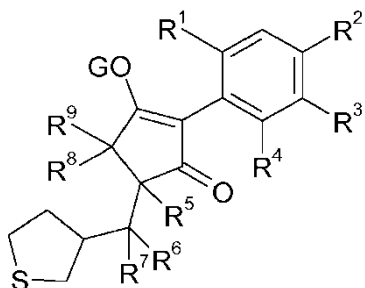
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 10 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



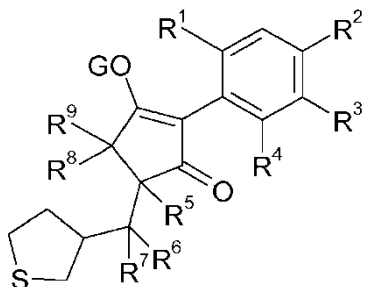
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 11 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



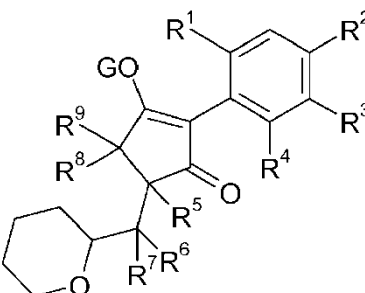
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 12 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



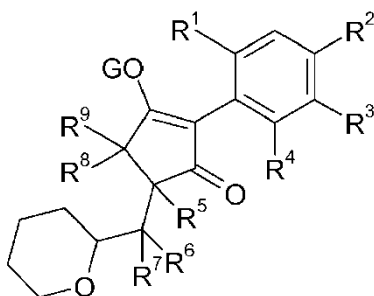
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 13 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



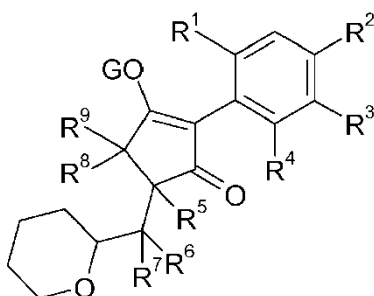
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 14 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



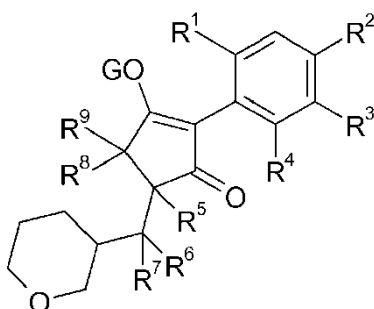
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 15 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



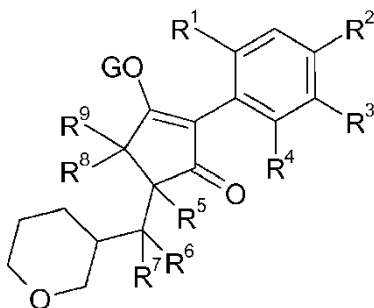
- 5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 16 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

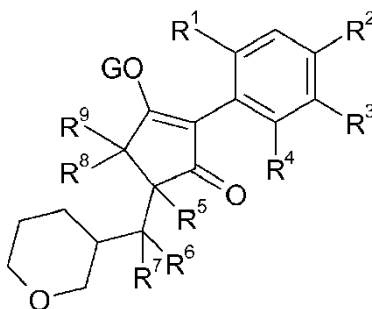
La Tabla 17 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

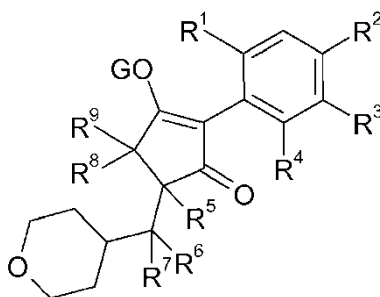
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 18 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



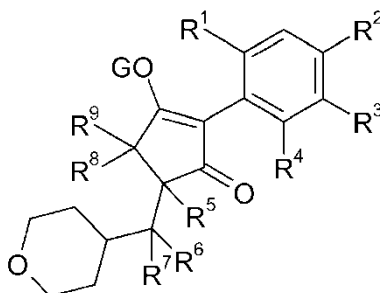
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 19 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



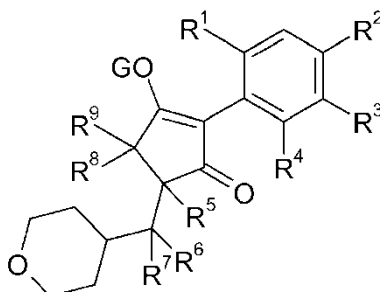
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 20 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

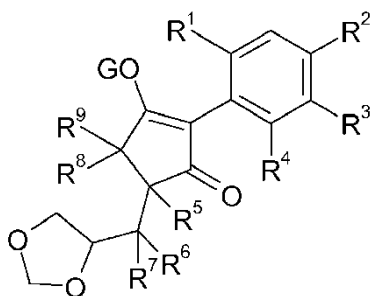
La Tabla 21 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

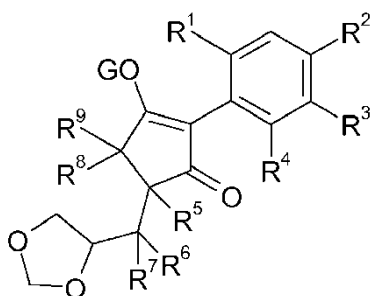
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 22 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



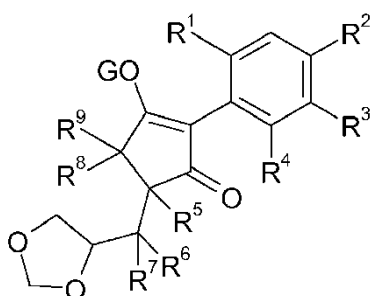
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 23 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



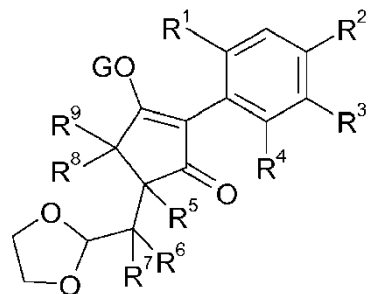
- 5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 24 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



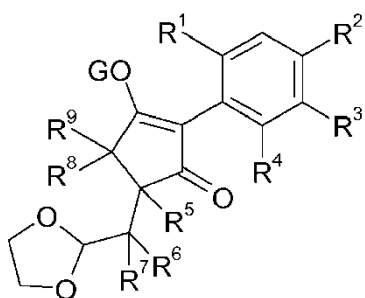
en los que G y R⁵, R⁸ and R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

- 10 La Tabla 25 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



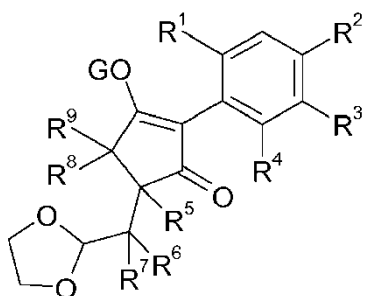
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 26 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



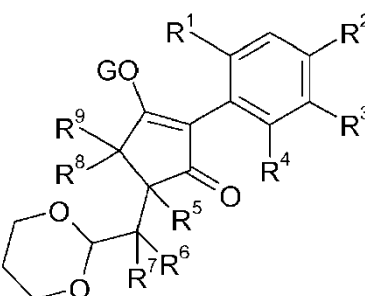
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 27 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



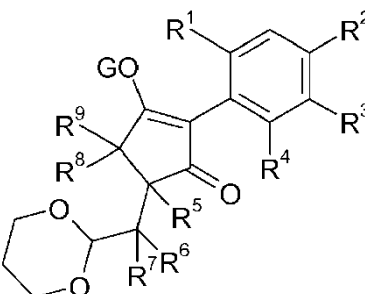
- 5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 28 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ and R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

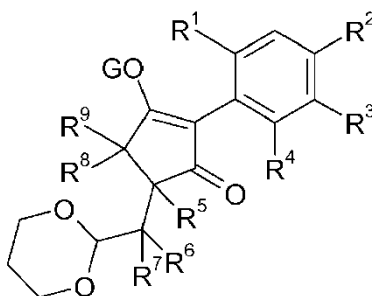
La Tabla 29 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

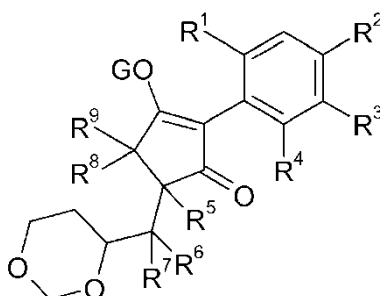
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ and R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 30 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R^5 , R^8 and R^9 son hidrógeno, R^6 y R^7 son metilo y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

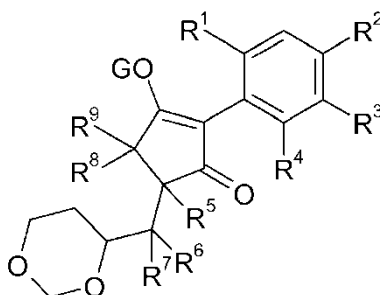
La Tabla 31 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



5

en los que G, R^5 , R^6 , R^7 , R^8 and R^9 son todos hidrógeno, y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

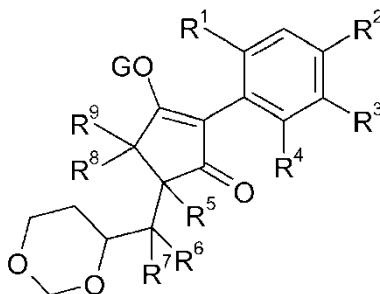
La Tabla 32 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R^5 , R^6 , R^8 and R^9 son hidrógeno, R^7 es metilo y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

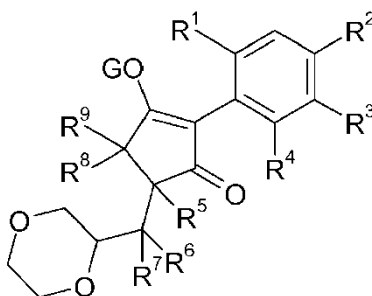
10

La Tabla 33 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



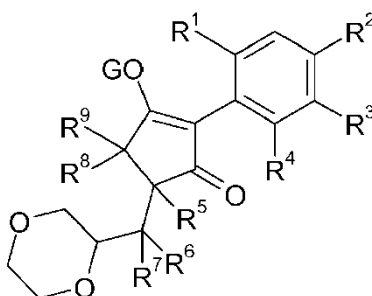
en los que G y R^5 , R^8 y R^9 son hidrógeno, R^6 y R^7 son metilo y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 34 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



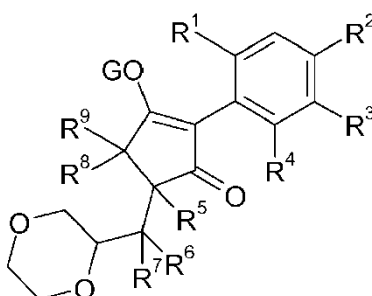
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 35 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



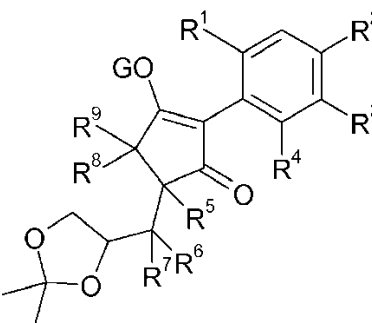
- 5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 36 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

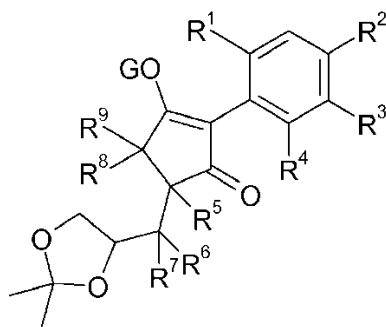
La Tabla 37 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



10

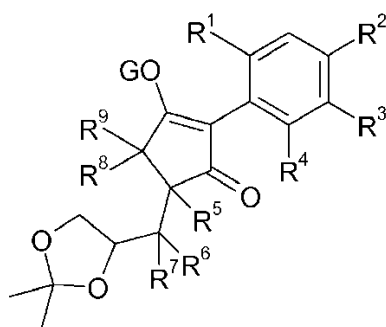
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 38 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



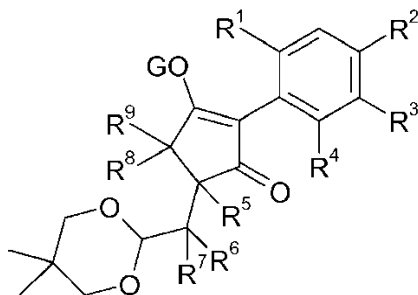
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 39 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



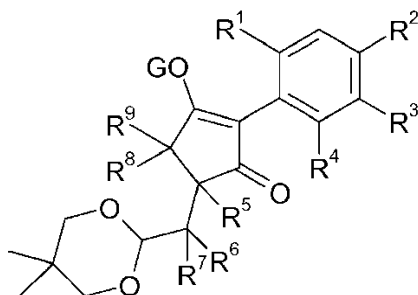
5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 40 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

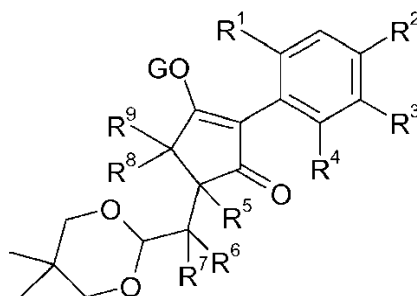
La Tabla 41 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

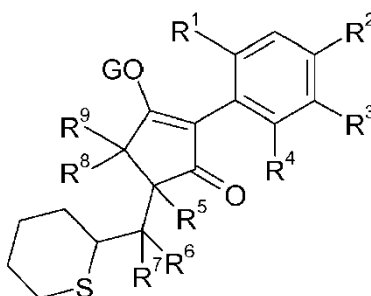
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 42 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



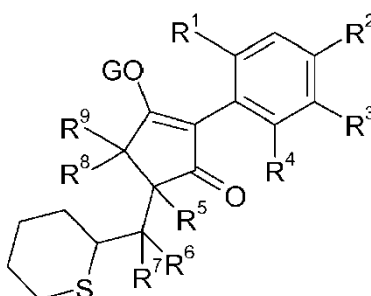
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 43 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



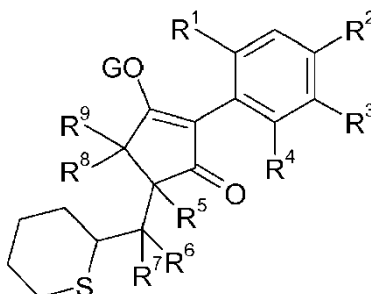
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 44 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

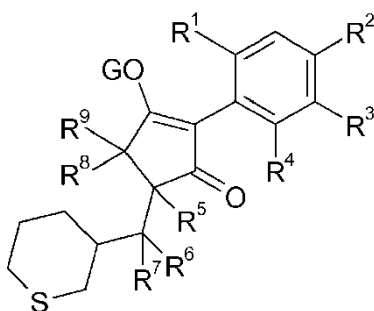
La Tabla 45 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

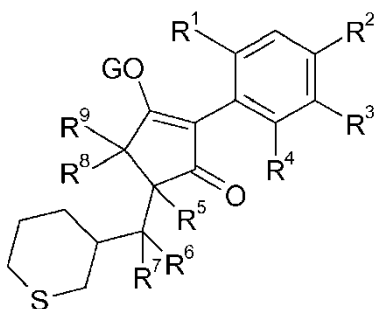
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 46 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



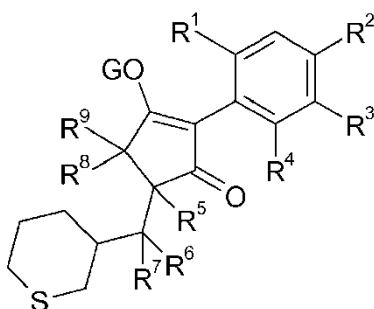
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 47 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



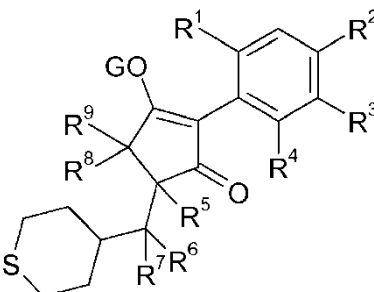
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 48 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

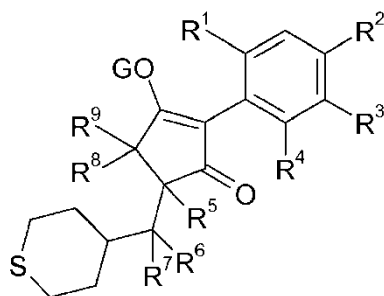
La Tabla 49 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



10

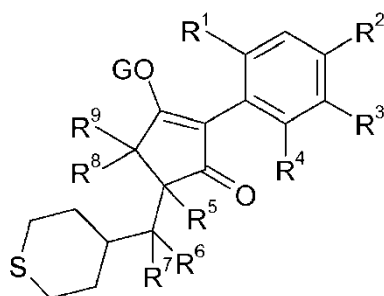
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 50 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



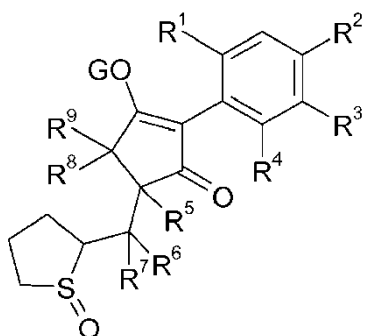
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 51 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



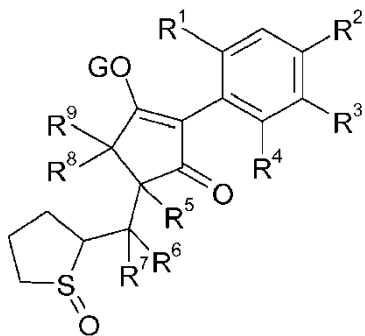
- 5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 52 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

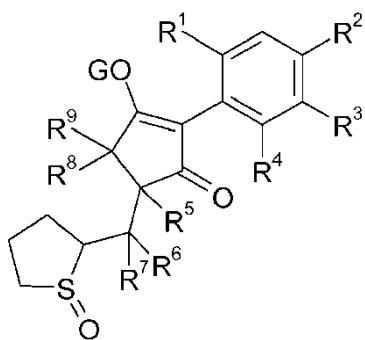
La Tabla 53 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

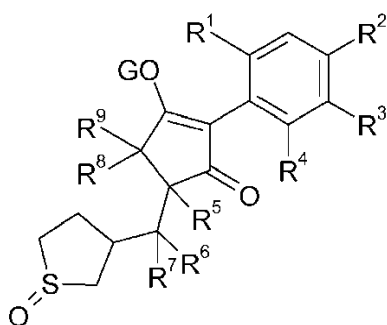
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 54 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



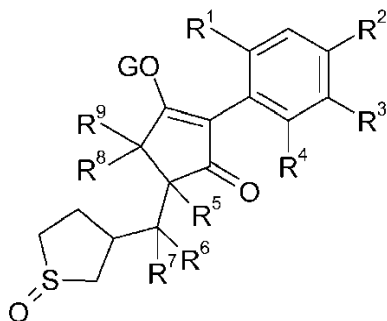
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 55 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



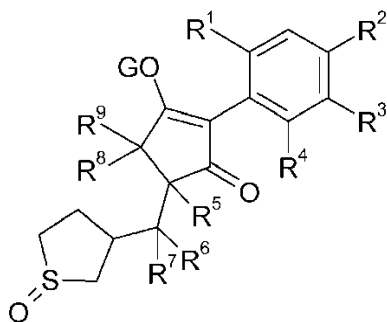
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 56 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

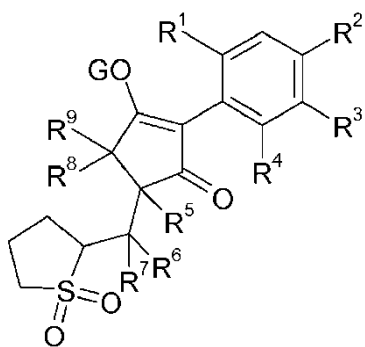
La Tabla 57 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

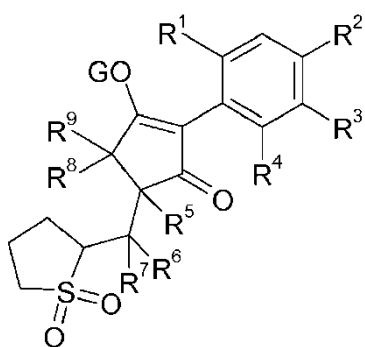
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 58 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



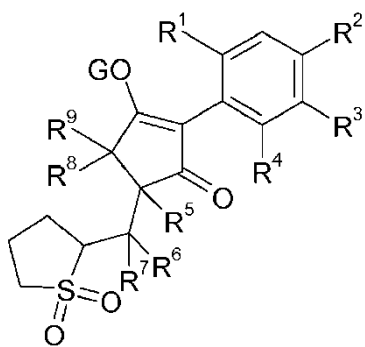
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 59 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



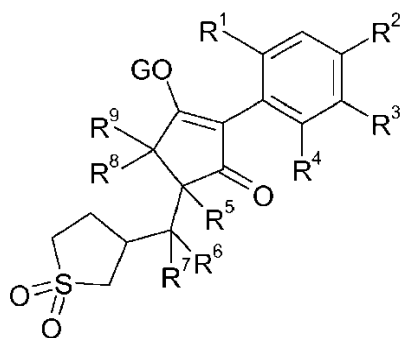
- 5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 60 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

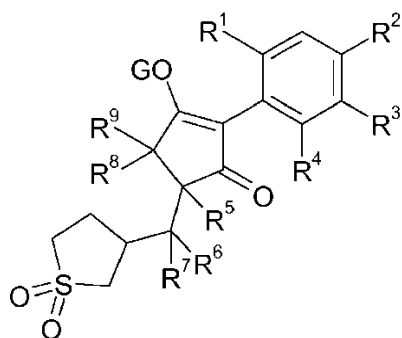
La Tabla 61 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



10

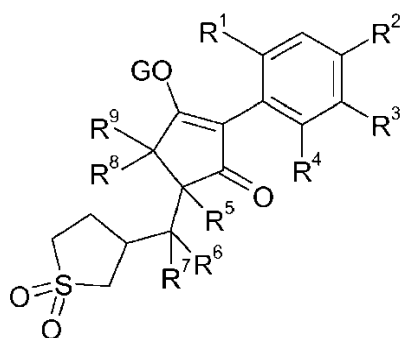
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 62 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



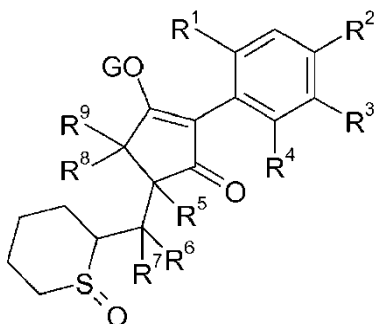
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 63 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



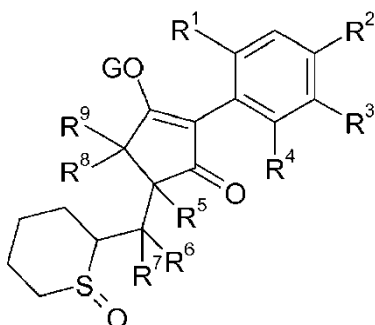
5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 64 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

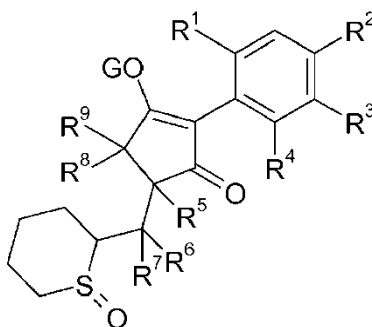
La Tabla 65 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

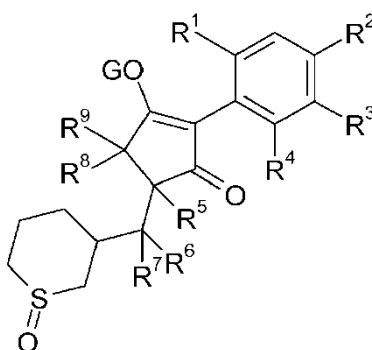
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 66 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



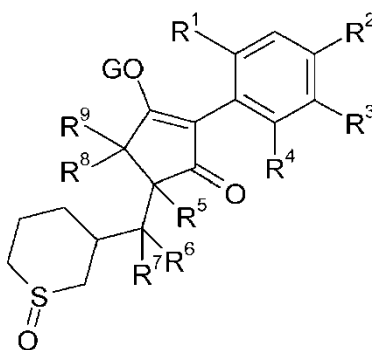
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 67 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



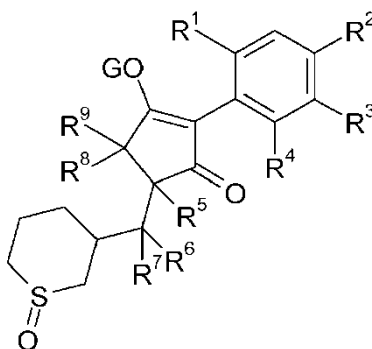
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 68 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

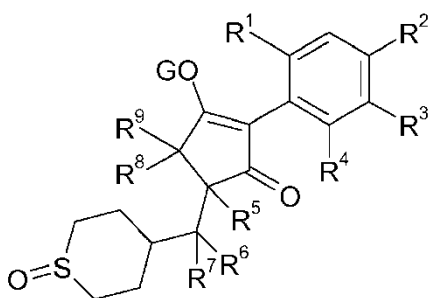
La Tabla 69 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

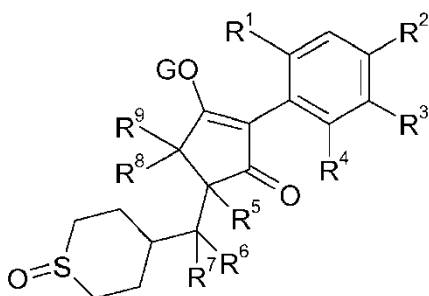
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 70 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



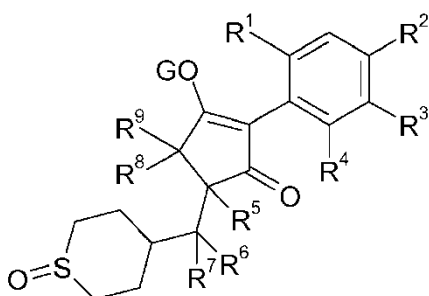
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 71 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



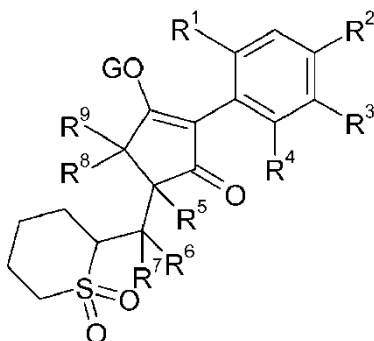
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 72 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

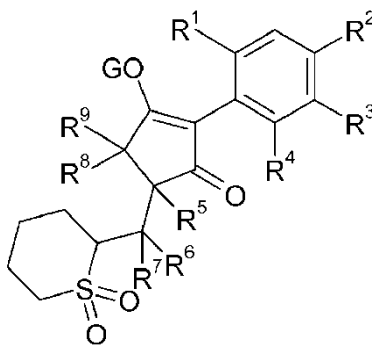
La Tabla 73 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



10

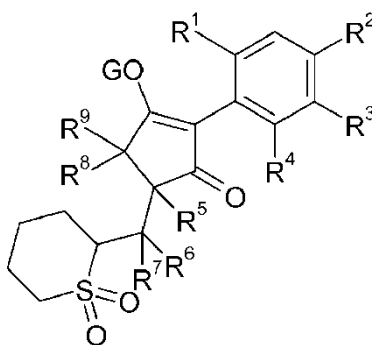
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 74 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



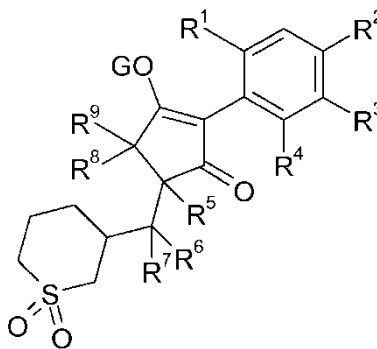
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 75 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



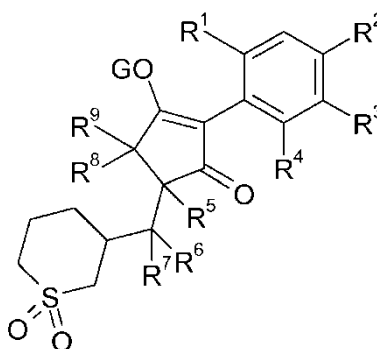
- 5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 76 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



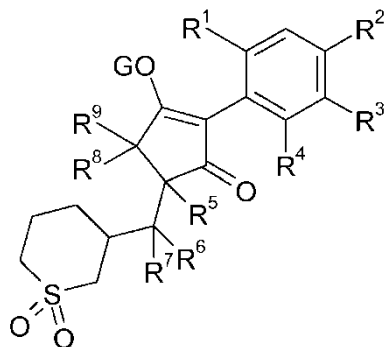
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 77 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



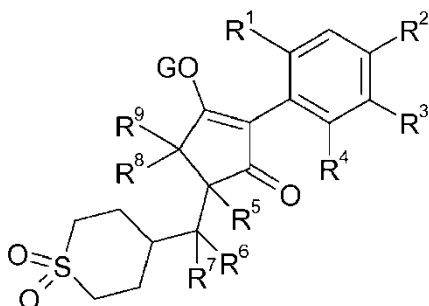
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 78 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R^5 , R^8 y R^9 son hidrógeno, R^6 y R^7 son metilo y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

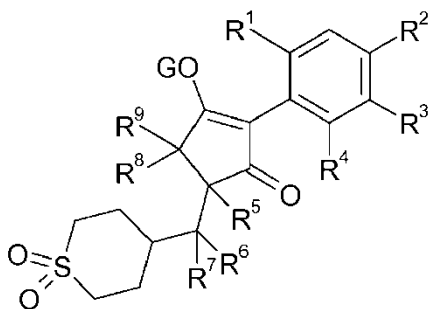
La Tabla 79 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



5

en los que G, R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son todos hidrógeno, y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

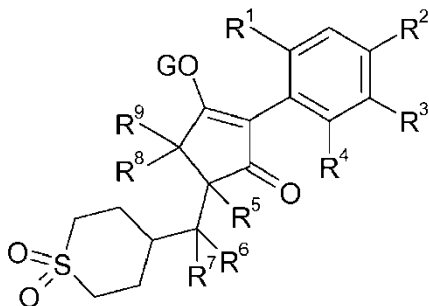
La Tabla 80 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R^5 , R^6 , R^8 y R^9 son hidrógeno, R^7 es metilo y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

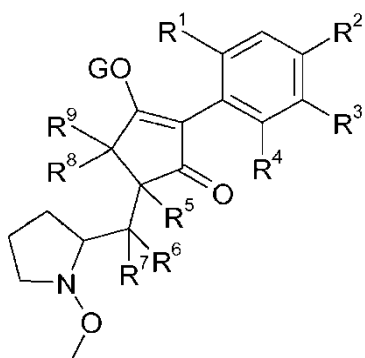
10

La Tabla 81 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



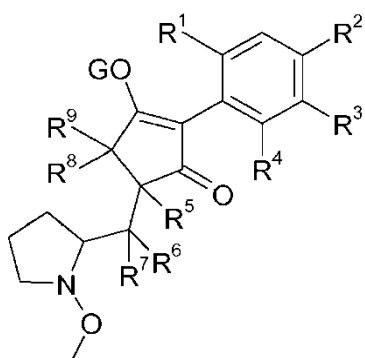
en los que G y R^5 , R^8 y R^9 son hidrógeno, R^6 y R^7 son metilo y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 82 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



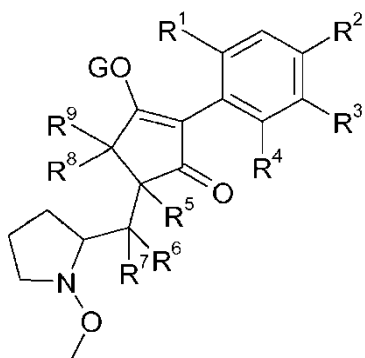
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 83 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



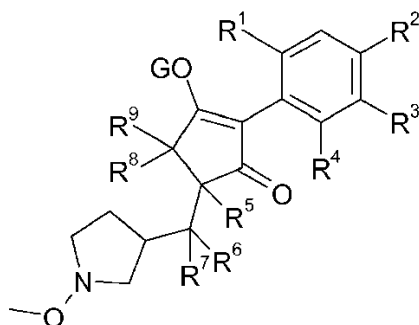
5 en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 84 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



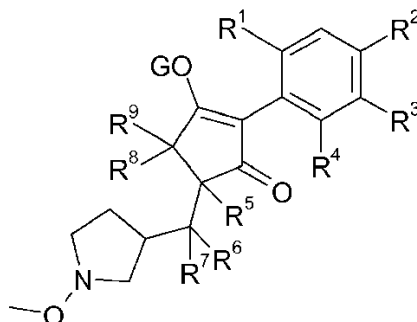
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 85 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



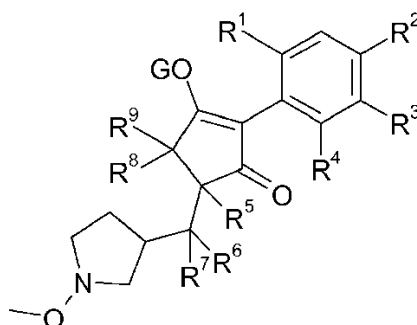
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 86 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

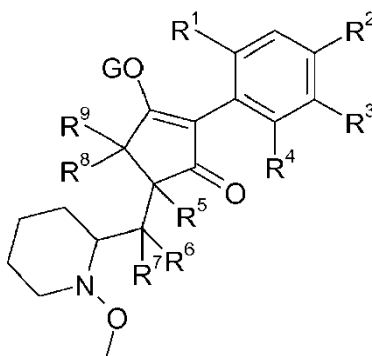
La Tabla 87 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



5

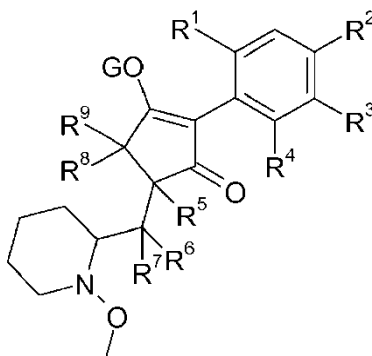
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 88 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



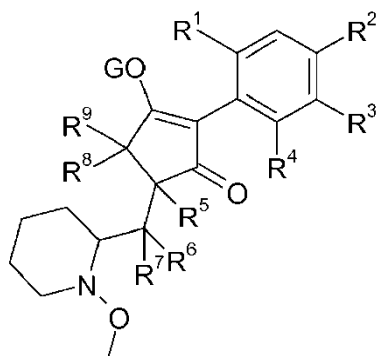
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

10 La Tabla 89 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



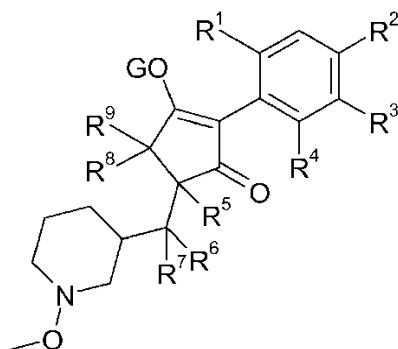
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 90 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

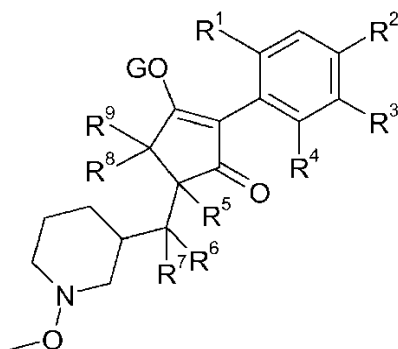
La Tabla 91 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



5

en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

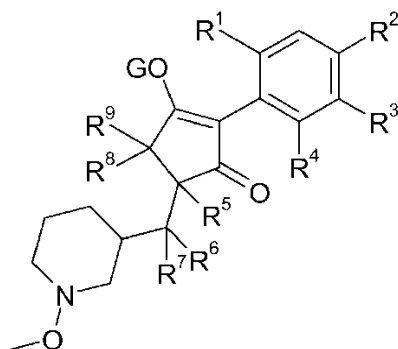
La Tabla 92 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

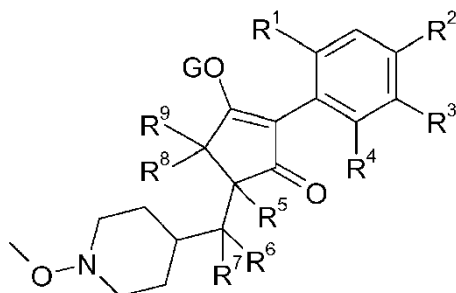
10

La Tabla 93 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



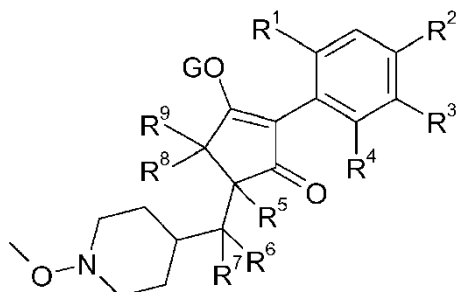
en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 94 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



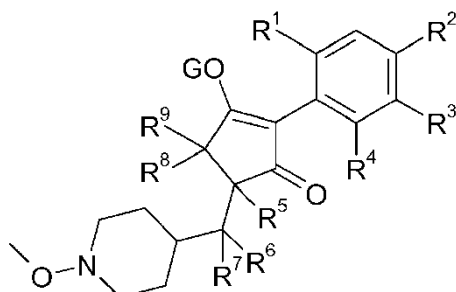
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

5 La Tabla 95 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



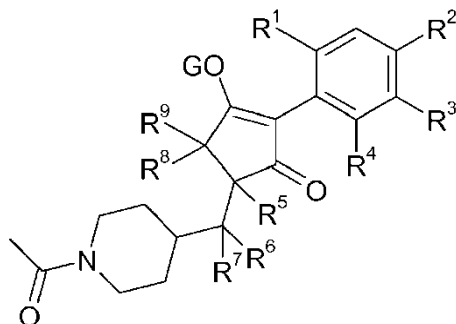
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 96 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



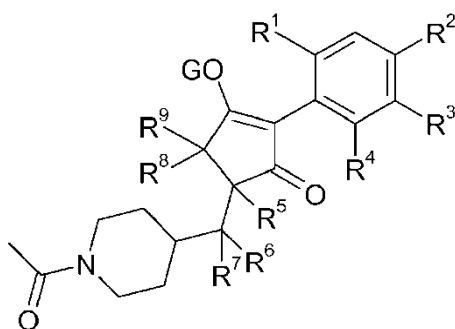
10 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 97 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



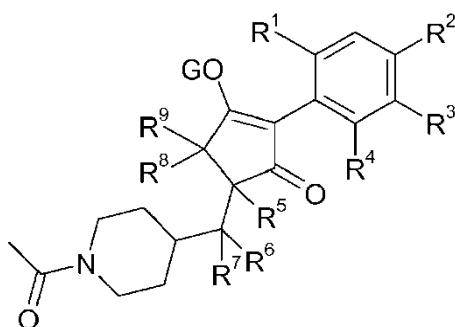
en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 98 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



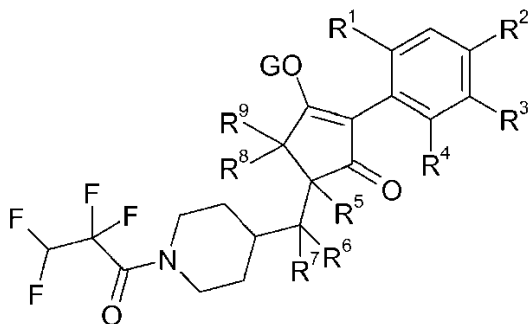
en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 99 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



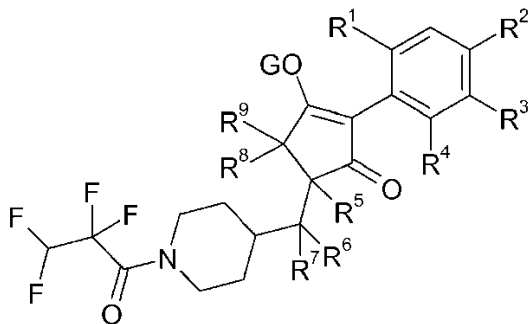
5 en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 100 cubre 262 compuestos del siguiente tipo:



en los que G, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son todos hidrógeno, y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

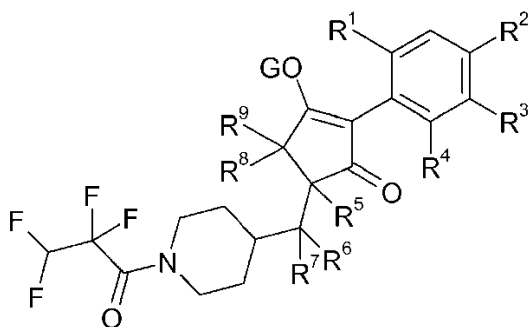
La Tabla 101 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



10

en los que G, R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁷ es metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

La Tabla 102 cubre 262 compuestos del siguiente tipo



en los que G y R⁵, R⁸ y R⁹ son hidrógeno, R⁶ y R⁷ son metilo y R¹, R², R³ y R⁴ son como se describen en la Tabla 1.

Ejemplos biológicos

Ejemplo A

- 5 Se sembraron en macetas semillas de una variedad de especies de ensayo en suelo estándar. Después de cultivar durante un día (pre-emergencia) o después de 10 días de cultivo (post-emergencia) en condiciones controladas en un invernadero, las plantas se pulverizaron con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del ingrediente activo de calidad técnica en 0,6 ml de acetona y 45 ml de disolución de formulación que contiene 10,6% de Emulsogen EL (nº de registro 61791-12-6), 42,2% de N-metilpirrolidona, 42,2% de éter monometílico de dipropilenglicol (nº de registro 34590-94-8) y 0,2% de X-77 (nº de registro 11097-66-8). A continuación, las plantas a ensayar se hicieron crecer en un invernadero en condiciones óptimas; el ensayo se evaluó 14 o 15 días después para la post-emergencia y 19 o 20 días para la pre-emergencia (100 = daño total a la planta; 0 = ningún daño a la planta).

Plantas de ensayo:

- 15 *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Avena fatua* (AVEFA), *Lolium perenne* (LOLPE), *Setaria faberi* (SETFA), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG)

Actividad pre-emergencia

Número de compuesto	Tasa g/ha	ALOMI	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T1	500	100	90	100	70	100	80
T2	500	70	10	90	70	80	70

Actividad post-emergencia

Número de compuesto	Tasa g/ha	ALOMI	AVEFA	LOLPE	SETFA	DIGSA	ECHCG
T1	125	100	90	100	70	100	100
T2	125	80	40	20	100	100	100
T4	250	100	90	100	90	90	100
T5	250	100	80	100	30	50	80
T8	250	100	90	100	100	80	100
P5	250	100	100	100	80	70	100

Ejemplo B

- 25 Se sembraron en macetas semillas de una variedad de especies de ensayo en suelo estándar. Después de cultivar durante un día (pre-emergencia) o después de 8 días de cultivo (post-emergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizaron con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del ingrediente activo de calidad técnica en una disolución de acetona/agua (50:50) que contenía 0,5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxietilenado, nº de registro de CAS 9005-64-5).

ES 2 553 418 T3

A continuación, las plantas a ensayar se hicieron crecer en un invernadero en condiciones controladas (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se regaron dos veces al día. El ensayo se evaluó después de 13 días pre- y post-emergencia (100 = daño total a la planta; 0 = ningún daño a la planta).

Plantas de ensayo:

- 5 *Lolium perenne* (LOLPE), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Avena fatua* (AVEFA)

Actividad pre-emergencia

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T3	250	60	50	20	50
T4	250	100	100	100	90
T5	250	100	100	100	80
T7	250	80	70	100	50
T8	250	100	100	100	100
T9	250	60	20	20	0
T10	250	90	70	70	40
T11	250	70	30	20	0
T12	250	100	100	100	100
T13	250	30	30	10	0
T14	250	100	100	100	100
T15	250	100	70	100	100
T16	250	100	100	100	80
T17	250	100	100	100	100
T18	250	100	100	100	70
T21	250	100	100	90	70
T22	250	100	100	100	90
T23	250	100	100	100	100
T24	250	100	100	100	90
T26	250	100	70	100	60
T27	250	100	90	80	60
T29	250	100	70	90	50
T30	250	90	60	80	30
T31	250	90	80	80	90
T32	250	100	70	100	90
T33	250	90	60	90	50
T34	250	90	70	100	70
T35	250	70	30	40	10
T36	250	90	90	100	90

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T37	250	100	100	100	90
T38	250	70	90	100	40
T39	250	100	100	100	100
T40	250	100	100	100	80
T41	250	90	70	100	90
T42	250	0	0	20	0
T43	250	100	80	100	100
T44	250	100	90	60	20
T46	250	10	50	10	10
T47	250	60	20	40	50
T48	250	90	90	100	90
T50	250	100	100	100	100
T51	250	100	80	80	90
T52	250	100	100	80	80
T53	250	40	30	0	0
T54	250	100	80	100	50
T55	250	100	80	90	60
T58	250	100	90	100	90
T59	250	100	90	100	90
T60	250	10	10	0	0
T61	250	90	70	90	80
T62	250	100	80	100	70
T63	250	100	70	100	90
T64	250	100	50	100	90
T65	250	80	70	100	80
T66	250	80	90	100	80
T67	250	100	90	100	90
T68	250	90	30	50	40
T69	250	10	0	20	10
T70	250	70	20	60	70
T71	250	30	20	10	20
T72	250	60	30	80	20
T73	250	80	40	80	80
T74	250	30	30	50	20

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T75	250	80	30	70	70
T76	250	60	30	60	20
T77	250	0	0	0	0
T78	250	30	20	30	0
T79	250	90	60	60	20
T80	250	100	70	70	70
T81	250	80	80	60	80
T82	250	90	50	60	50
T83	250	90	60	90	70
T84	250	90	50	60	50
T85	250	60	60	30	20
T86	250	100	60	50	30
T87	250	100	90	60	90
T88	250	100	90	80	90
T89	250	70	50	60	10
T90	250	60	40	50	60
T91	250	70	20	60	40
T92	250	30	30	40	10
T93	250	90	60	90	60
T94	250	90	90	80	90
T95	250	100	90	60	90
T96	250	60	20	20	10
T97	250	70	30	60	30
T98	250	90	70	90	80
T99	250	60	20	60	30
T100	250	90	60	70	60
T101	250	50	20	50	30
T102	250	70	50	50	30
T103	250	30	30	10	20
T104	250	70	60	90	60
T105	250	60	20	40	30
T106	250	20	20	20	30
T107	250	70	80	70	60
T108	250	50	10	60	40

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T109	250	0	0	0	0
T110	250	50	30	70	30
T111	250	90	40	80	40
T112	250	50	40	30	20
T113	250	70	60	90	70
T114	250	40	50	60	20
T118	250	40	40	30	20
T119	250	80	40	100	30
T120	250	20	30	30	10
T121	250	80	30	90	60
T122	250	50	20	70	20
T123	250	60	60	60	60
T124	250	20	20	30	10
T126	250	60	30	50	40
T128	250	50	70	60	40
T130	250	100	70	30	10
T131	250	90	70	100	70
T132	250	70	20	90	70
T135	250	40	0	60	30
T138	250	90	80	90	70
T139	250	80	70	90	60
T140	250	70	60	90	50
T141	250	80	80	80	80
T142	250	70	90	90	80
T143	250	100	80	100	50
T144	250	70	80	90	70
T145	250	50	60	20	30
T146	250	90	70	70	50
T147	250	30	50	40	10
T148	250	50	70	30	40
T149	250	20	30	30	10
T151	250	30	20	40	10
T156	250	100	80	100	70
T157	250	10	10	40	0

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T158	250	90	80	100	70
T159	250	70	50	100	30
T160	250	90	30	70	40
T161	250	90	30	100	60
T162	250	70	40	50	50
T163	250	80	50	60	60
P5	250	100	100	100	80
P7	250	100	100	100	90
P9	250	40	30	20	0
P11	250	100	100	100	100
P13	250	100	100	100	90
P14	250	100	100	100	80
P15	250	100	100	100	90
P16	250	100	100	100	90
P17	250	100	100	90	90
P18	250	100	100	90	80
P20	250	100	100	80	90
P23	250	100	100	100	80
P24	250	100	100	90	90
P25	250	90	100	90	80
P26	250	100	100	90	80
P27	250	100	100	80	80
P28	250	100	70	20	30
P29	250	90	50	0	20
P30	250	100	100	80	90
P31	250	100	100	100	90
P34	250	100	90	100	90
P37	250	100	100	70	70
P42	250	40	30	30	0
P43	250	100	100	100	100
P44	250	100	100	100	90
P45	250	100	100	100	100
P46	250	90	70	100	60
P47	250	60	30	60	50

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
P48	250	80	70	40	60
P49	250	100	80	100	60
P50	250	100	100	100	100
P51	250	100	100	100	100
P53	250	100	60	90	70
P54	250	100	80	100	70
P55	250	100	100	100	90
P56	250	100	100	100	90
P57	250	60	50	30	70
P58	250	80	70	80	70
P59	250	80	50	70	30
P60	250	80	30	50	0
P61	250	90	50	80	30
P63	250	70	50	70	40
P64	250	80	70	80	70
P65	250	90	60	80	60
P67	250	100	80	90	90
P68	250	100	90	100	90
P71	250	100	90	100	100

Actividad post-emergencia

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T3	250	70	40	70	70
T4	250	100	100	100	100
T5	250	100	100	100	90
T6	250	10	20	10	0
T7	250	80	100	90	90
T8	250	100	100	100	100
T9	250	80	60	80	30
T10	250	70	70	80	80
T11	250	50	60	70	30
T12	250	100	100	100	100
T13	250	30	10	40	0
T14	250	100	100	100	100

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T15	250	100	100	100	100
T16	250	100	100	100	100
T17	250	100	90	100	100
T18	250	100	80	90	70
T21	250	90	90	80	90
T22	250	100	90	100	100
T23	250	100	90	100	100
T24	250	100	90	100	100
T26	250	80	60	60	70
T27	250	80	70	80	70
T29	250	90	70	80	60
T30	250	80	80	80	70
T31	250	70	90	80	90
T32	250	90	90	90	90
T33	250	60	60	60	70
T34	250	90	90	100	100
T35	250	70	70	70	60
T36	250	80	80	90	90
T37	250	100	90	100	100
T38	250	100	100	100	100
T39	250	100	90	100	100
T40	250	100	80	100	90
T41	250	100	100	100	100
T42	250	20	0	30	0
T43	250	100	90	80	90
T44	250	70	60	80	40
T46	250	40	60	60	50
T47	250	30	30	60	50
T48	250	70	90	100	90
T50	250	100	100	100	100
T51	250	60	70	70	80
T52	250	90	90	100	80
T54	250	70	80	80	80
T55	250	60	70	70	50

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T58	250	90	100	100	90
T59	250	100	90	90	100
T60	250	20	30	10	10
T61	250	90	90	100	100
T62	250	90	90	100	100
T63	250	90	90	90	100
T64	250	90	90	100	100
T65	250	90	90	100	100
T66	250	60	90	100	90
T67	250	100	90	100	100
T68	250	90	60	90	90
T69	250	30	30	20	30
T70	250	80	70	80	100
T71	250	40	30	70	80
T72	250	80	50	90	80
T73	250	80	90	90	100
T74	250	40	70	100	90
T75	250	100	90	90	100
T76	250	40	90	90	100
T77	250	40	30	20	40
T78	250	50	40	70	40
T79	250	60	60	70	80
T80	250	90	90	80	100
T81	250	90	90	80	100
T82	250	90	90	80	100
T83	250	90	80	70	100
T84	250	100	90	90	100
T85	250	90	90	80	90
T86	250	70	40	80	80
T87	250	90	70	70	90
T88	250	90	90	90	100
T89	250	40	30	40	20
T90	250	80	70	80	100
T91	250	50	40	50	90

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T92	250	20	30	40	60
T93	250	70	60	60	70
T94	250	90	100	90	100
T95	250	100	90	70	100
T96	250	60	60	40	40
T97	250	60	70	80	70
T98	250	100	100	90	100
T99	250	50	70	90	90
T100	250	80	90	60	90
T101	250	40	40	20	40
T102	250	80	90	40	90
T103	250	50	50	30	60
T104	250	80	70	70	90
T105	250	50	30	30	40
T106	250	30	40	30	10
T107	250	90	70	60	90
T108	250	70	70	40	70
T110	250	50	30	40	80
T111	250	80	80	70	90
T112	250	30	40	30	30
T113	250	100	90	70	100
T114	250	50	40	30	40
T116	250	90	60	50	90
T118	250	30	60	40	80
T119	250	90	90	90	80
T120	250	30	30	10	20
T121	250	90	80	80	100
T122	250	80	60	70	30
T123	250	70	80	60	90
T124	250	20	30	20	30
T126	250	70	50	60	70
T127	250	20	20	20	10
T128	250	50	40	50	90
T130	250	90	60	60	70

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
T131	250	100	90	90	90
T132	250	70	70	100	80
T133	250	0	20	90	30
T135	250	70	80	90	80
T136	250	30	50	60	70
T138	250	90	90	70	90
T139	250	90	90	100	90
T140	250	90	90	90	60
T141	250	70	80	60	90
T142	250	70	90	60	90
T143	250	60	60	60	80
T144	250	80	80	80	90
T145	250	40	60	30	50
T146	250	80	80	70	90
T147	250	40	60	50	70
T148	250	70	80	60	100
T149	250	40	30	20	40
T151	250	20	30	40	10
T152	250	30	20	10	10
T153	250	20	10	10	20
T156	250	100	90	70	90
T157	250	30	30	60	50
T158	250	100	100	100	100
T159	250	100	90	100	90
T160	250	100	40	70	60
T161	250	100	70	90	90
T162	250	90	60	70	80
T163	250	100	90	90	100
P4	250	30	60	20	40
P5	250	100	100	100	90
P7	250	100	100	90	80
P9	250	40	30	50	10
P11	250	100	90	100	90
P13	250	100	90	100	90

ES 2 553 418 T3

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
P14	250	100	90	90	90
P15	250	100	100	100	90
P16	250	100	100	100	100
P17	250	100	100	100	90
P18	250	100	90	90	90
P20	250	100	100	100	90
P23	250	100	90	90	90
P24	250	100	90	90	90
P25	250	100	90	100	90
P26	250	100	100	100	90
P27	250	100	80	90	80
P28	250	100	70	60	70
P29	250	100	80	30	70
P30	250	100	100	90	100
P31	250	100	90	100	90
P34	250	100	80	60	90
P37	250	90	90	90	90
P42	250	40	60	70	70
P43	250	100	100	100	90
P44	250	100	100	100	100
P45	250	100	100	90	100
P46	250	80	90	70	90
P47	250	60	70	50	60
P48	250	90	90	90	100
P49	250	100	80	100	90
P50	250	100	100	100	100
P51	250	100	100	100	100
P53	250	20	60	70	40
P54	250	40	70	80	50
P55	250	100	90	100	100
P56	250	100	90	90	100
P57	250	60	80	70	80
P58	250	90	90	70	90
P59	250	80	90	70	80

Número de compuesto	Tasa g/ha	LOLPE	ALOMI	ECHCG	AVEFA
P60	250	70	80	40	80
P61	250	90	90	90	90
P62	250	80	70	70	70
P63	250	80	90	70	90
P64	250	90	100	90	100
P65	250	90	90	90	90
P67	250	100	100	100	100
P68	250	100	90	100	90
P69	250	40	0	80	20
P71	250	100	100	100	90

Ejemplo C

Se sembraron en macetas semillas del trigo de invierno “Hereward” en suelo estándar. Después de cultivar durante 8 días en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizaron con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del ingrediente activo de calidad técnica en una disolución de acetona/agua (50:50) que contiene 0,5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxietileno, n° de registro de CAS 9005-64-5).

Semillas del trigo de invierno variedad “Hereward” se trataron con una formulación en forma de polvo humectable del protector herbicida de cereales, cloquintocet metilo, a una tasa de 0,5 gramos por kilogramo de semilla seca antes del inicio del ensayo en el invernadero. Se sembró una semilla por maceta de plástico de 3,81 cm (1,5 pulgadas) en un suelo de marga arenoso a una profundidad de 1 cm, 8 días antes de la aplicación de los compuestos de ensayo, y se regó y se hizo crecer en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad). Las plantas se pulverizaron post-emergencia con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del ingrediente activo de calidad técnica en una disolución de acetona/agua (50:50) que contiene 0,5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxietileno, n° de registro de CAS 9005-64-5).

A continuación, las plantas a ensayar se hicieron crecer en un invernadero en condiciones controladas (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se regaron dos veces al día. El ensayo se evaluó después de 13 días pre- y post-emergencia (100 = daño total a la planta; 0 = ningún daño a la planta).

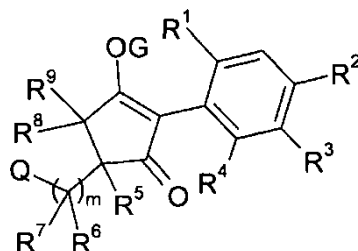
Número de compuesto	Tasa g/ha	Trigo de invierno (Hereward)	Trigo de invierno (Hereward) + cloquintocet metilo
T4	250	70	40
T5	250	80	20
T8	250	90	80
T10	250	60	20
T12	250	70	60
T14	250	80	60
T16	250	80	20
T17	250	70	50
T22	250	80	70
T37	250	80	70
T39	250	80	70

ES 2 553 418 T3

Número compuesto de	Tasa g/ha	Trigo de invierno (Hereward)	Trigo de invierno (Hereward) + cloquintocet mexilo
T40	250	60	10
T41	250	90	80
T62	250	80	70
T64	250	80	70
T66	250	50	20
T67	250	70	30
T75	250	60	50
T84	250	70	60
T88	250	70	50
T98	250	90	60
P5	250	60	30
P7	250	70	0
P11	250	80	70
P13	250	70	10
P16	250	70	0
P17	250	70	0
P20	250	40	0
P43	250	50	40
P44	250	70	40
P56	250	90	60

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I



(I)

en la que

- 5 R^1 es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, *iso*-propilo, halometilo, haloetilo, halógeno, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, halometoxi, haloetoxi, ciclopropilo o halociclopropilo,
- 10 R^2 y R^3 son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, haloalquino de C₂-C₆, alquenoil C₃-C₆-oxi, haloalquenoil C₃-C₆-oxi, alquinoil C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfinilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfinilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo;
- 15 R^4 es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alquenoil C₃-C₆-oxi, haloalquenoil C₃-C₆-oxi, alquinoil C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfinilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfonilo o ciano;
- 20 R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alquenoil C₃-C₆-oxi, haloalquenoil C₃-C₆-oxi, alquinoil C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, alcoxi C₁-C₆-sulfinilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfinilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, o bencilo o bencilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o cicloalquil C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃ en el que un grupo metilénico anular o de cadena está opcionalmente sustituido por un átomo de oxígeno o de azufre; o
- 30 R^6 y R^7 o R^8 y R^9 , junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo de 3 a 8 miembros opcionalmente sustituido, que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, de azufre o de nitrógeno; en el que los sustituyentes opcionales en el anillo están presentes cuando el anillo formado por R^6 y R^7 o R^8 y R^9 es un grupo heterociclilo sustituido, en cuyo caso el uno o más sustituyentes se seleccionan independientemente de halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, nitro y ciano, o
- 35 R^5 y R^6 forman juntos un enlace;
- 40 Q es heterociclilo de C₃-C₈ saturado o mono-insaturado que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, N y S, no sustituido o sustituido con un resto de fórmula =O, =N-R¹⁰ o alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo de C₁-C₂, cicloalquilo de C₃-C₆, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, en el que R¹⁰ es alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₂-C₈-aminocarbonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo o haloalquil C₁-C₆-sulfonilo;
- 45 m es 1, 2 o 3;

en la que R^6 o R^7 pueden tener diferentes significados cuando m es 2 o 3; y

G es hidrógeno o un metal agrícolamente aceptable, sulfonio, amonio o grupo protector;

en la que, cuando G es un grupo protector, entonces G se selecciona de los grupos alquilo de C_1-C_8 , haloalquilo de C_2-C_8 , fenil-alquilo de C_1-C_8 (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C_1-C_8 (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), alquenilo de C_3-C_8 , haloalquenilo de C_3-C_8 , alquinilo de C_3-C_8 , $C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$, $C(X^d)-N(R^c)-R^d$, $-SO_2-R^e$, $-P(X^e)(R^f)-R^g$ y $CH_2-X^f-R^h$; en los que:

X^a , X^b , X^c , X^d , X^e y X^f son independientemente entre sí oxígeno o azufre;

R^a es H, alquilo de C_1-C_{18} , alquenilo de C_2-C_{18} , alquinilo de C_2-C_{18} , haloalquilo de C_1-C_{10} , cianoalquilo de C_1-C_{10} , nitroalquilo de C_1-C_{10} , aminoalquilo de C_1-C_{10} , alquil C_1-C_5 -amino-alquilo de C_1-C_5 , dialquil C_2-C_8 -amino-alquilo de C_1-C_5 , cicloalquil C_3-C_7 -alquilo de C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 -alquilo de C_1-C_5 , alquenil C_3-C_5 -oxi-alquilo de C_1-C_5 , alquinil C_3-C_5 -oxi-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -tio-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -sulfinil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -sulfonil-alquilo de C_1-C_5 , alquiliden C_2-C_8 -aminoxi-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -carbonil-alquilo de C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 -carbonil-alquilo de C_1-C_5 , aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , dialquil C_2-C_8 -aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -carbonil-amino-alquilo de C_1-C_5 , *N*-alquil C_1-C_5 -carbonil-*N*-alquil C_1-C_5 -amino-alquilo de C_1-C_5 , trialquil C_3-C_6 -siliil-alquilo de C_1-C_5 , fenil-alquilo de C_1-C_5 (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C_1-C_5 (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C_2-C_5 , cicloalquilo de C_3-C_8 ; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro;

R^b es alquilo de C_1-C_{18} , alquenilo de C_3-C_{18} , alquinilo de C_3-C_{18} , haloalquilo de C_2-C_{10} , cianoalquilo de C_1-C_{10} , nitroalquilo de C_1-C_{10} , aminoalquilo de C_2-C_{10} , alquil C_1-C_5 -amino-alquilo de C_1-C_5 , dialquil C_2-C_8 -amino-alquilo de C_1-C_5 , cicloalquil C_3-C_7 -alquilo de C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 -alquilo de C_1-C_5 , alquenil C_3-C_5 -oxi-alquilo de C_1-C_5 , alquinil C_3-C_5 -oxi-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -tio-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -sulfinil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -sulfonil-alquilo de C_1-C_5 , alquiliden C_2-C_8 -aminoxi-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -carbonil-alquilo de C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 -carbonil-alquilo de C_1-C_5 , aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , dialquil C_2-C_8 -aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -carbonil-amino-alquilo de C_1-C_5 , *N*-alquil C_1-C_5 -carbonil-*N*-alquil C_1-C_5 -amino-alquilo de C_1-C_5 , trialquil C_3-C_6 -siliil-alquilo de C_1-C_5 , fenil-alquilo de C_1-C_5 (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C_1-C_5 (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C_3-C_5 , cicloalquilo de C_3-C_8 ; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro; y

R^c y R^d son, cada uno independientemente entre sí hidrógeno, alquilo de C_1-C_{10} , alquenilo de C_3-C_{10} , alquinilo de C_3-C_{10} , haloalquilo de C_2-C_{10} , cianoalquilo de C_1-C_{10} , nitroalquilo de C_1-C_{10} , aminoalquilo de C_1-C_{10} , alquil C_1-C_5 -amino-alquilo de C_1-C_5 , dialquil C_2-C_8 -amino-alquilo de C_1-C_5 , cicloalquil C_3-C_7 -alquilo de C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 -alquilo de C_1-C_5 , alquenil C_3-C_5 -oxi-alquilo de C_1-C_5 , alquinil C_3-C_5 -oxi-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -tio-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -sulfinil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -sulfonil-alquilo de C_1-C_5 , alquiliden C_2-C_8 -aminoxi-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -carbonil-alquilo de C_1-C_5 , alcoxi C_1-C_5 -carbonil-alquilo de C_1-C_5 , aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , dialquil C_2-C_8 -aminocarbonil-alquilo de C_1-C_5 , alquil C_1-C_5 -carbonil-amino-alquilo de C_1-C_5 , *N*-alquil C_1-C_5 -carbonil-*N*-alquil C_1-C_5 -amino-alquilo de C_1-C_5 , trialquil C_3-C_6 -siliil-alquilo de C_1-C_5 , fenil-alquilo de C_1-C_5 (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), heteroaril-alquilo de C_1-C_5 (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, alquil C_1-C_3 -sulfinilo, alquil C_1-C_3 -sulfonilo, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo de C_2-C_5 , cicloalquilo de C_3-C_8 ; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro; heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro; diheteroarilamino o diheteroarilamino

5

o R^c y R^d se pueden unir para formar un anillo de 3 a 7 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O o S; y

30

55

60

C₆-sílil-alquilo de C₁-C₅, fenil-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroaril-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), fenoxi-alquilo de C₁-C₅ (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxi-alquilo de C₁-C₅ (en el que el heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo, alquil C₁-C₃-sulfonilo, halógeno, ciano o con nitro), haloalqueno de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₈; fenilo o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno o con nitro; o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno, ciano o con nitro;

y en los que:

el termino "heteroarilo" significa un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o en dos anillos condensados.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que:

los grupos haloalquilo son CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, FCH₂, ClCH₂, BrCH₂, CH₃CHF, CF₃CH₂ o CHF₂CH₂;

el termino "heteroarilo" significa un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o en dos anillos condensados; en el que un único anillo contiene hasta tres heteroátomos escogidos de nitrógeno, oxígeno y azufre, y un sistema bicíclico contiene hasta cuatro heteroátomos escogidos de nitrógeno, oxígeno y azufre; y

el término "heterocíclico" significa un sistema anular monocíclico o bicíclico no aromático que contiene hasta 8 átomos, incluyendo al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N.

3. Un compuesto según la reivindicación 1 o 2, en el que R¹ es metilo, etilo o metoxi.

4. Un compuesto según la reivindicación 1, 2 o 3, en el que R² y R³ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, haloalquino de C₂-C₆, fenilo, o fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno o alquil C₁-C₃-sulfinilo.

5. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que R² y R³ son independientemente hidrógeno, cloro, bromo, metilo, metoxi, etilo, etoxi, etenilo, etinilo, fenilo, o fenilo sustituido con metilo, trifluorometilo, ciano, nitro, flúor, cloro o metilsulfinilo.

6. Un compuesto según la reivindicación 1, 2 o 3, en el que R² y R³ son independientemente tienilo; tienilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; furilo; furilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; pirazolilo; pirazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; tiazolilo; tiazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; oxazolilo; oxazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; isotiazolilo; isotiazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; isoxazolilo; isoxazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; triazolilo; triazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; oxadiazolilo; oxadiazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; tiadiazolilo; tiadiazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; tetrazolilo; tetrazolilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; piridilo; piridilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; pirimidinilo; pirimidinilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; pirazinilo o pirazinilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo;

sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo; o triazinilo o triazinilo sustituido con alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo.

7. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que R³ es hidrógeno.

5 8. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, *iso*-propilo, halometilo, haloetilo, halógeno, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, halometoxi o haloetoxi.

9. Un compuesto según la reivindicación 8, en el que R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, cloro, bromo, etenilo, etinilo, metoxi o etoxi.

10. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en el que R⁵ es hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆ o haloalcoxi de C₁-C₆.

10 11. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que R⁶ y R⁷ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆ o haloalcoxi de C₁-C₆.

12. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en el que R⁸ y R⁹ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆ o haloalcoxi de C₁-C₆.

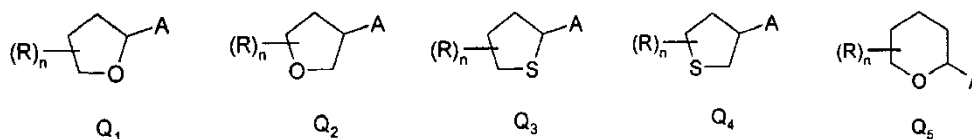
13. Un compuesto según la reivindicación 10, 11 o 12, en el que:

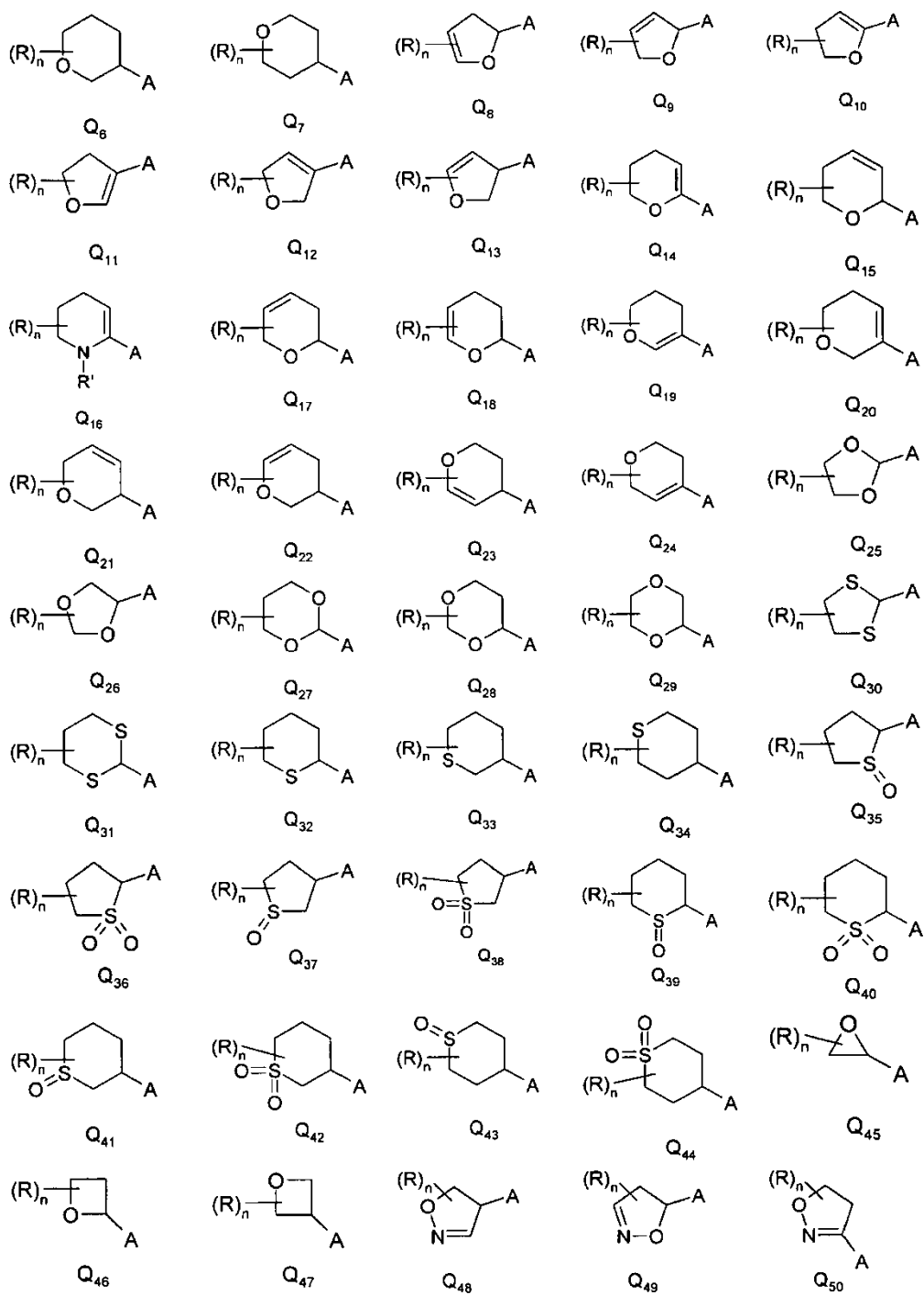
15 R⁵ es hidrógeno o metilo;

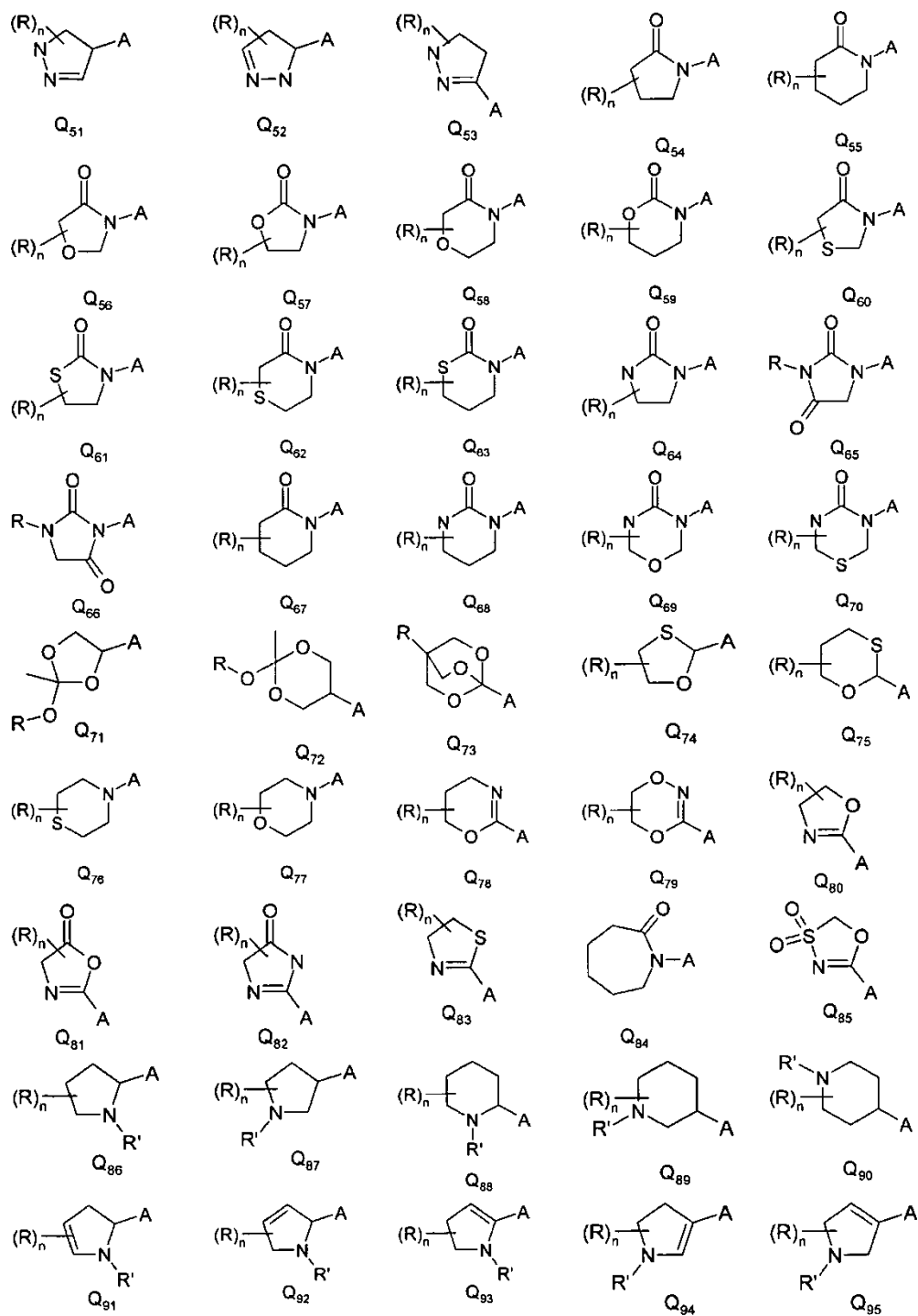
R⁶ y R⁷ son independientemente hidrógeno o metilo; y

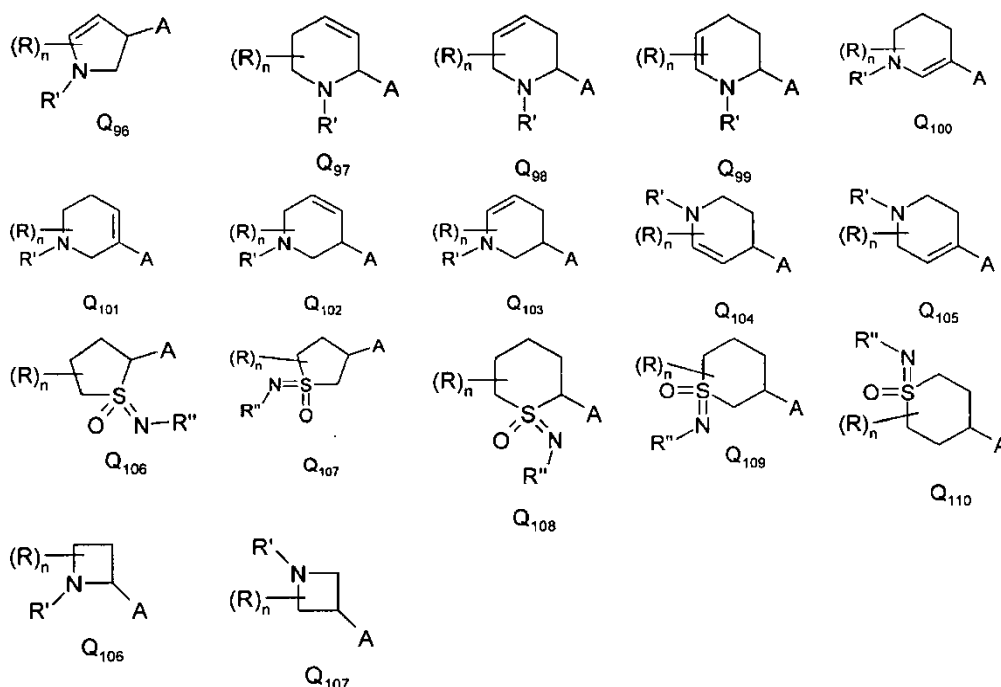
R⁸ y R⁹ son independientemente hidrógeno o metilo.

14. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, en el que Q se selecciona de aquellos de la fórmula









en las que

- 5 R es hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, haloalqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, haloalquino de C₂-C₆, alqueno C₃-C₆-oxi, haloalqueno C₃-C₆-oxi, alquino C₃-C₆-oxi, cicloalquilo de C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆-sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₆-sulfonilo, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo, o heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, ciano, nitro, halógeno, alquil C₁-C₃-tio, alquil C₁-C₃-sulfinilo o alquil C₁-C₃-sulfonilo;
- 10 R' es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₂-C₈-aminocarbonilo, aril C₆-C₁₀-sulfonilo, aril C₆-C₁₀-carbonilo, aril C₆-C₁₀-aminocarbonilo, arilalquil C₇-C₁₆-aminocarbonilo, hetaril C₁-C₉-sulfonilo, hetaril C₁-C₉-carbonilo, hetaril C₁-C₉-aminocarbonilo, hetarilalquil C₂-C₁₅-aminocarbonilo;
- 15 R'' es hidrógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, dialquil C₂-C₈-aminocarbonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo o haloalquil C₁-C₆-sulfonilo;
- n es 0, 1, 2, 3 o 4 y
- 20 A representa la posición de unión al resto $-(CR^6R^7)_m$.
15. Un compuesto según la reivindicación 14, en el que Q se selecciona de los grupos Q₁, Q₂, Q₃, Q₄, Q₅, Q₆, Q₇, Q₂₅, Q₂₆, Q₂₇, Q₂₈, Q₂₉, Q₈₆, Q₈₇, Q₈₈, Q₈₉, o Q₉₀.
16. Un compuesto según la reivindicación 15, en el que Q se selecciona de los grupos Q₁ a Q₇.
17. Un compuesto según la reivindicación 14, 15 o 16, en el que R y R' son independientemente hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ o haloalcoxi de C₁-C₄; y R'' es hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₆-carbonilo.
- 25 18. Un compuesto según la reivindicación 14, 15, 16 o 17, en el que n es 0, 1 o 2.
19. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, en el que m es 1.
20. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, en el que, cuando G es un grupo protector, entonces G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, en el que los significados de X^a, R^a, X^b, X^c y R^b son como se definen en la reivindicación 1.

21. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, en el que G es hidrógeno, un metal alcalino, o un metal alcalino-térreo.

5 22. Una composición herbicida, que, además de comprender auxiliares de la formulación, comprende una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21.

23. Una combinación que comprende un compuesto de fórmula (I), como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, y un herbicida adicional.

10 24. Un método para controlar hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, o de una composición que comprende tal compuesto, a las plantas o a su locus.

25. Un método según la reivindicación 24, en el que se usa la composición, y en el que los cultivos de plantas útiles son cereales, arroz, maíz, colza, remolacha, caña de azúcar, haba de soja, algodón, girasol, cacahuete o cultivos de plantación.