

(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS  
ESPAÑA



(11) Número de publicación: **2 571 449**

(51) Int. Cl.:

<b>C07D 237/16</b>	(2006.01)	<b>C07D 471/04</b>	(2006.01)
<b>C07D 401/04</b>	(2006.01)	<b>C07D 495/10</b>	(2006.01)
<b>C07D 401/14</b>	(2006.01)	<b>A01N 43/58</b>	(2006.01)
<b>C07D 405/04</b>	(2006.01)		
<b>C07D 405/12</b>	(2006.01)		
<b>C07D 405/14</b>	(2006.01)		
<b>C07D 409/14</b>	(2006.01)		
<b>C07D 413/10</b>	(2006.01)		
<b>C07D 413/14</b>	(2006.01)		
<b>C07D 417/04</b>	(2006.01)		

(12)

## TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **03.10.2012 E 12768817 (4)**

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.02.2016 EP 2763968**

---

(54) Título: **Derivados de piridazinona herbicidas**

(30) Prioridad:

**04.10.2011 GB 201117019**

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**25.05.2016**

(73) Titular/es:

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

(72) Inventor/es:

**BHONOA, YUNAS;**  
**ELLIOTT, ALISON CLARE;**  
**GAULIER, STEVEN;**  
**LING, KENNETH;**  
**MITCHELL, GLYNN;**  
**MORRIS, JAMES ALAN;**  
**RZEPKA, PAULA ROCHA y**  
**VINER, RUSSELL COLIN**

(74) Agente/Representante:

**LEHMANN NOVO, María Isabel**

**ES 2 571 449 T3**

---

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

## DESCRIPCIÓN

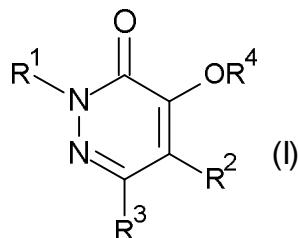
## Derivados de piridazinona herbicidas

La presente invención se refiere a derivados de piridazinona novedosos, a procesos para su preparación, a composiciones herbicidas que comprenden los derivados novedosos y a su uso para controlar malezas, en particular en cultivos de plantas útiles, o para inhibir el crecimiento vegetal.

5

El documento JP11152273 y Maes *et al.*, *Tetrahedron* 58 2002 9713-9721 describen, entre otros, ciertos derivados de piridazinona.

Por lo tanto, de acuerdo con la presente invención se proporciona un compuesto de Fórmula (I):

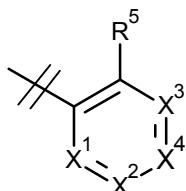


10 o una de sus sales agronómicamente aceptables,

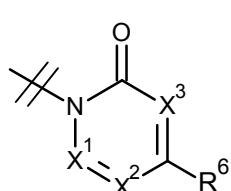
donde:-

$R^1$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, tetrahidropiranyl- y bencil-, donde el bencilo está opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>11</sup>;

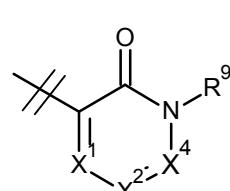
15  $R^2$  se selecciona del grupo constituido por A1, A2 y A3



(A1)



(A2)



(A3)

donde

$X^1$  es N o CR<sup>7</sup>;

$X^2$  es N o CR<sup>8</sup>;

20  $X^3$  es N o CR<sup>9</sup>;

$X^4$  es N o CR<sup>6</sup>;

$R^3$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halo, nitro, amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>);

25

$R^4$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonil-, arilcarbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonil-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>carbonil- y aril-S(O)<sub>p</sub>-, donde dichos grupos arilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>11</sup>;

30  $R^5$  se selecciona del grupo constituido por hidroxilo, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, aril-S(O)<sub>p</sub>-, heterociclico, heterociclico-S(O)<sub>p</sub>-, ariloxi-, aril-(alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, aril-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterociclico-, heterociclico-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterociclico-

5 C<sub>3</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, hidroxcarbonilo, hidroxcarbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>amino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>(alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>(aminoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, ciano y nitro, donde dichos heterociclos son heterociclos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno independientemente seleccionado del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>, fenilo, ciano y nitro;

R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, aril-S(O)<sub>p</sub>-, heterociclico, heterocicil-S(O)<sub>p</sub>-, ariloxi-, aril-(alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, aril-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterociclioxi-, heterocicil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, hidroxicarbonilo, hidroxicarbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(aminoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, ciano y nitro, donde dichos heterociclicos son heterociclicos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno independientemente seleccionado del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitro;

$R^7$  y  $R^8$  se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquenil C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquinil C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)- y (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-;

30 y donde R<sup>5</sup> y R<sup>9</sup> pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos de nitrógeno y/u oxígeno, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos R<sup>12</sup>; o

R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos seleccionados del grupo constituido por nitrógeno, oxígeno y S(O)<sub>2</sub>, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos R<sup>12</sup>, o

$R^6$  y  $R^8$  pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos de nitrógeno, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos  $R^{13}$ , y

R<sup>11</sup> se selecciona del grupo constituido por halo-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

40 R<sup>12</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, halo-, oxi-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub><sup>-</sup>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

R<sup>13</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, halo-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, morfolinil- y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; y

$p = 0, 1 \text{ o } 2$ :

45 y donde el compuesto de Fórmula (I) no es ácido 2-(1-bencil-5-hidroxi-6-oxo-1,6-dihidropiridazin-4-il) benzoico.

Los grupos alquilo con una longitud de cadena comprendida entre 1 y 6 átomos de carbono incluyen, por ejemplo, metilo ( $\text{Me}$ ,  $\text{CH}_3$ ), etilo ( $\text{Et}$ ,  $\text{C}_2\text{H}_5$ ), *n*-propilo, isopropilo ( $i\text{-Pr}$ ), *n*-butilo ( $n\text{-Bu}$ ), isobutilo ( $i\text{-Bu}$ ), sec-butilo y *tert*-butilo ( $t\text{-Bu}$ ).

Los grupos alquenilo con una longitud de cadena comprendida entre 2 y 6 átomos de carbono incluyen, por ejemplo, -CH=CH<sub>2</sub> (vinilo) y -CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub> (alilo).

Los grupos alquinilo con una longitud de cadena comprendida entre 2 y 6 átomos de carbono incluyen, por ejemplo,  $-\text{C}\equiv\text{CH}$  (etinilo) y  $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$  (propargilo).

Los grupos cicloalquilo incluyen c-propilo (c-Pr), c-butilo (c-Bu), c-pentilo y c-hexilo.

Halógeno (halo) abarca flúor, cloro, bromo o yodo. Lo mismo se aplica correspondientemente a halógeno en el contexto de otras definiciones, tales como haloalquilo o halofenilo.

Los grupos haloalquilo con una longitud de cadena comprendida entre 1 y 6 átomos de carbono son, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-

5 cloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1-difluoro-2,2,2-tricloroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoroetilo y 2,2,2-tricloroetilo, heptafluoro-*n*-propilo y perfluoro-*n*-hexilo.

Los radicales haloalquenilo incluyen grupos alquenilo sustituidos una o más veces con halógeno, siendo el halógeno flúor, cloro, bromo o yodo y especialmente flúor o cloro, por ejemplo, 2,2-difluoro-1-metilvinilo, 3-fluoropropenilo, 3-

10 cloropropenilo, 3-bromopropenilo, 2,3,3-trifluoropropenilo, 2,3,3-tricloropropenilo y 4,4,4-trifluorobut-2-en-1-ilo. Los radicales alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> preferidos sustituidos una, dos o tres veces con halógeno son aquellos con una longitud de cadena comprendida entre 2 y 5 átomos de carbono.

Los grupos alcoxi tienen preferentemente una longitud de cadena comprendida entre 1 y 6 átomos de carbono. Alcoxi equivale, por ejemplo, a metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, *n*-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi o *tert*-butoxi, o un isómero de pentiloxi o hexiloxi, preferentemente metoxi y etoxi. Alquilcarbonilo equivale preferentemente a acetilo o

15 propionilo. Alcoxicarbonilo equivale, por ejemplo, a metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, *n*-butoxicarbonilo, isobutoxicarbonilo, sec-butoxicarbonilo o *tert*-butoxicarbonilo, preferentemente metoxicarbonilo, etoxicarbonilo o *tert*-butoxicarbonilo. También se debe apreciar que dos

20 sustituyentes alcoxi presentes en el mismo átomo de carbono pueden unirse para formar un grupo espiránico. Por lo tanto, los grupos metilo presentes en dos sustituyentes metoxi pueden unirse para formar un sustituyente 1,3-

dioxolano espiránico, por ejemplo. Este tipo de posibilidad queda contemplada por el alcance de la presente invención.

Haloalcoxi equivale, por ejemplo, a fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2,2-difluoroetoxi o 2,2,2-tricloroetoxi, preferentemente difluorometoxi, 2-cloroetoxi o trifluorometoxi.

25 Los grupos alquiltio (alquil-S-) tienen preferentemente una longitud de cadena comprendida entre 1 y 6 átomos de carbono. Alquiltio equivale, por ejemplo, a metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, *n*-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio o *tert*-butiltio, preferentemente metiltio o etiltio.

Alquilsulfinilo (alquil-SO-) equivale, por ejemplo, a metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, isopropilsulfinilo, *n*-butilsulfinilo, isobutilsulfinilo, sec-butilsulfinilo o *tert*-butilsulfinilo, preferentemente metilsulfinilo o etilsulfinilo.

30 Alquilsulfonilo (alquil-S(O)<sub>2</sub>) equivale, por ejemplo, a metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, *n*-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, sec-butilsulfonilo o *tert*-butilsulfonilo, preferentemente metilsulfonilo o etilsulfonilo.

Alquilamino (alquil-NH-) equivale, por ejemplo, a metilamino, etilamino, *n*-propilamino, isopropilamino o un isómero de butilamino. Dialquilamino ((alquil)<sub>2</sub>-N-) equivale, por ejemplo, a dimetilamino, metiletilamino, dietilamino, *n*-propilmethylamino, dibutilamino o diisopropilamino. Se da preferencia a los grupos alquilamino con una longitud de cadena comprendida entre 1 y 4 átomos de carbono.

Cicloalquilamino- o dicicloalquilamino- equivale, por ejemplo, a ciclohexilamino o diciclopropilamino.

Los grupos alcoxialquilo contienen preferentemente de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxialquilo equivale, por ejemplo, a metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, *n*-propoximetilo, *n*-propoxietilo, isopropoximetilo o isopropoxietilo.

40 Los grupos alquiltioalquilo (alquil-S-alquilo) contienen preferentemente de 1 a 6 átomos de carbono. Alquiltioalquilo equivale, por ejemplo, a metiltiometilo, metiltioetilo, etiliometilo, etiltioetilo, *n*-propiltiometilo, *n*-propiltioetilo, isopropiltiometilo, isopropiltioetilo, butiltiometilo, butiltioetilo o butiltiobutilo.

Los grupos cicloalquilo contienen preferentemente de 3 a 6 átomos de carbono en el anillo y pueden estar sustituidos con uno o más grupos metilo; preferentemente no están sustituidos, por ejemplo, ciclopropilo (c-Pr), ciclobutilo (c-Bu), ciclopentilo (c-pentilo) o ciclohexilo (c-hexilo).

45 Arilo incluye bencilo, fenilo, incluido el fenilo que forma parte de un sustituyente tal como fenoxy, bencilo, benciloxi, benzoílo, feniltio, fenilalquilo, fenoxyalquilo o tosilo, y puede estar en una forma mono- o polisustituida, en cuyo caso los sustituyentes pueden estar en las posiciones *ortho*, *meta* y/o *para*, según se deseé. El término también incluye, por ejemplo, naftalenilo.

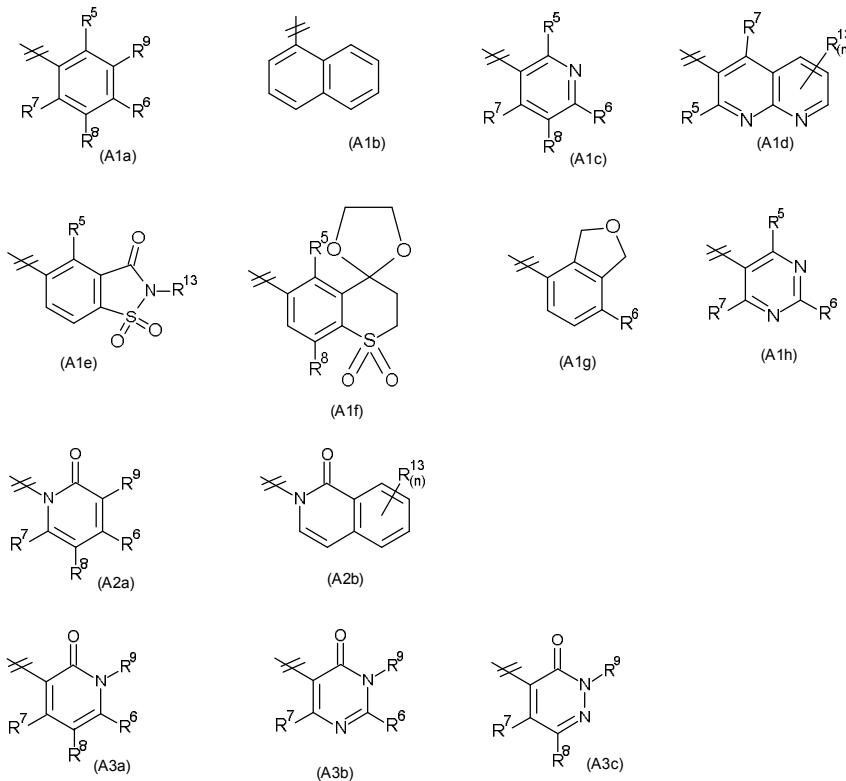
Heterociclico incluye, por ejemplo, morfolinilo, tetrahidrofurilo y heteroarilo.

50 Heteroarilo, incluido el heteroarilo que forma parte de un sustituyente tal como heteroariloxi, equivale, por ejemplo, a un heteroarilo de cinco a diez miembros (preferentemente cinco o seis) que contiene de uno a tres heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre. Por lo tanto, el término heteroarilo incluye, por ejemplo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indolilo, isobenzofuranilo, furanilo, tiofenilo, tiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, isotiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridonilo,

triazolilo, naftiridinilo y naftiridinonilo. El componente heteroarilo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido según se ha definido previamente.

5 Preferentemente, R<sup>1</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) y (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>). En una realización más preferida, R<sup>1</sup> se selecciona del grupo constituido por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, ciclopropilo, difluorometilo, ciclopripilmetil-, vinilo y propargilo, siendo el metilo particularmente preferido.

Preferentemente, R<sup>2</sup> se selecciona del grupo constituido por A1a, A1b, A1c, A1d, A1e, A1f, A1g, A1h, A2a, A2b, A3a, A3b y A3b:



10 donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> y R<sup>13</sup> son como se han definido previamente y n es 0, 1, 2 o 3.

Más preferentemente, R<sup>2</sup> se selecciona del grupo constituido por fenilo (p. ej., A1a), 3-piridilo (p. ej., A1c), N-piridonilo (p. ej., A2a) y [1,8]naftiridinilo unido por la posición 3 (p. ej., A1d). Incluso más preferentemente, R<sup>2</sup> es fenilo (p. ej., A1a).

15 Preferentemente, R<sup>3</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>. Más preferentemente, R<sup>3</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halo y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, siendo el hidrógeno o el metilo los más preferidos.

R<sup>4</sup> es preferentemente hidrógeno.

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son ambos preferentemente hidrógeno.

20 R<sup>5</sup> se selecciona preferentemente del grupo constituido por hidroxilo, halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, arilo, ariloxi, heterociclico, heterociclico-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-, ciano y nitro, donde dichos heterociclos son heterociclos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, ciano y nitro.

Los términos "arilo" y "heterociclico" se han definido anteriormente de forma más detallada. Sin embargo, en el contexto de R<sup>5</sup>, se prefieren particularmente fenilo, bencilo, isoxazolinilo, pirimidinilo, morfolinilo, furilo y tiofenilo.

- Más preferentemente, R<sup>5</sup> se selecciona del grupo constituido por cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, 2-fluoroetil-, metoxietoximetil-, trifluorometoximetil-, metil-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, isoxazolinilo, morfolinilo, metil-S(O)<sub>p</sub>-dimetilamino-, ciano y nitro, donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por cloro, metilo y trifluorometilo. Aún más preferentemente, R<sup>5</sup> se selecciona del grupo constituido por metilo, metil-S(O)<sub>2</sub>- y trifluorometilo.

Preferentemente, R<sup>6</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, nitro y fenilo, donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitro. Más preferentemente, R<sup>6</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>.

- 15 Preferentemente, R<sup>7</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno y (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>).

Preferentemente, R<sup>8</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno y (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>).

Preferentemente, R<sup>9</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, nitro y fenilo, donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitro. Más preferentemente, R<sup>9</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>.

- 25 Los compuestos de Fórmula I pueden contener centros asimétricos y pueden estar presentes como un único enantiómero, pares de enantiómeros en cualquier proporción o, cuando haya más de un centro asimétrico presente, pueden contener diastereoisómeros en todas las proporciones posibles. Normalmente, uno de los enantiómeros presenta una actividad biológica mejorada en comparación con las otras posibilidades.

De forma análoga, cuando haya alquenos disustituidos, estos pueden estar presentes en forma *E* o *Z*, o como mezclas de ambas en cualquier proporción.

- 30 Además, los compuestos de Fórmula I pueden estar en equilibrio con formas tautoméricas de tipo hidroxilo alternativas. Debe apreciarse que todas las formas tautoméricas (un único tautómero o sus mezclas), mezclas racémicas e isómeros únicos quedan incluidos dentro del alcance de la presente invención.

La presente invención también incluye sales agronómicamente aceptables que los compuestos de Fórmula I puedan formar con aminas (por ejemplo, amoniaco, dimetilamina y trietilamina), bases de metales alcalinos y metales alcalinotérreos o bases de amonio cuaternario. Entre los hidróxidos, óxidos, alcóxidos, hidrogenocarbonatos y carbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos empleados como formadores de sales, cabe destacar los hidróxidos, alcóxidos, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero especialmente los de sodio, magnesio y calcio. También se puede usar la sal de trimetilsulfonio correspondiente.

- 40 Los compuestos de Fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden emplearse como herbicidas por sí solos, pero generalmente se formulan en composiciones herbicidas usando adyuvantes de formulación, tales como portadores, disolventes y agentes tensioactivos (AT). Por lo tanto, la presente invención proporciona además una composición herbicida que comprende un compuesto herbicida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores y un adyuvante de formulación aceptable en agricultura. La composición puede estar en forma de concentrados que se diluyen antes de usarlos, aunque también se pueden preparar composiciones listas para usar. La dilución final se suele llevar a cabo con agua, pero se puede hacer, en lugar de con agua o además de con esta, con, por ejemplo, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

45

Las composiciones herbicidas generalmente comprenden entre un 0.1 y un 99% en peso, especialmente entre un 0.1 y un 95% en peso, de compuestos de Fórmula I, y entre un 1 y un 99.9% en peso de un adyuvante de formulación que incluye preferentemente entre un 0 y un 25% en peso de una sustancia tensioactiva.

- 50 Las composiciones se pueden seleccionar entre varios tipos de formulaciones, muchas de las cuales se describen en el Manual sobre la elaboración y el empleo de las especificaciones de la FAO para los productos destinados a la protección de plantas, 5.<sup>a</sup> edición, 1999. Estas incluyen polvos espolvoreables (PE), polvos solubles (PS), gránulos solubles en agua (GS), gránulos dispersables en agua (GD), polvos humectables (PH), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (LAc), líquidos de volumen ultrabajo (LU), concentrados emulsionables (CE), concentrados dispersables (CD), emulsiones (tanto de aceite en agua (EAg) como de agua en aceite (EAc)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (CS), aerosoles, suspensiones

de cápsulas (SC) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo de formulación seleccionado en cada caso dependerá del fin particular deseado, y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de Fórmula (I).

- 5 Los polvos espolvoreables (PE) se pueden preparar mezclando un compuesto de Fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo, arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kieselguhr, creta, diatomita, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros portadores sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo la mezcla mecánicamente hasta obtener un polvo fino.
- 10 Los polvos solubles (PS) se pueden preparar mezclando un compuesto de Fórmula (I) con una o más sales inorgánicas hidrosolubles (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos hidrosolubles (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes, para mejorar su dispersabilidad/solubilidad en agua. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos solubles en agua (GS).
- 15 Los polvos humectables (PH) se pueden preparar mezclando un compuesto de Fórmula (I) con uno o más portadores o diluyentes sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión, para facilitar la dispersión en líquidos. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (GD).
- 20 Los gránulos (GR) se pueden formar tanto granulando una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y uno o más portadores o diluyentes sólidos en polvo, como a partir de gránulos preformados que no contengan el compuesto de Fórmula (I) absorbiendo dicho compuesto de Fórmula (I) (o una solución de este en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como pumita, arcillas de atapulgita, tierra de fuller, kieselguhr, diatomita o marlos de maíz molidos) o adsorbiendo un compuesto de Fórmula (I) (o una solución de este en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos) y secando cuando sea necesario. Los agentes que se emplean habitualmente para facilitar la absorción o adsorción incluyen disolventes (tales como alcoholes, éteres, cetonas, ésteres y disolventes de petróleo aromáticos y alifáticos) y agentes aglutinantes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir uno o más aditivos diferentes en los gránulos (por ejemplo, un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).
- 25 Los concentrados dispersables (CD) se pueden preparar disolviendo un compuesto de Fórmula (I) en agua o un disolvente orgánico tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo, para mejorar la dilución en agua o prevenir la cristalización en un tanque de pulverización).
- 30 Los concentrados emulsionables (CE) o las emulsiones de aceite en agua (EAg) se pueden preparar disolviendo un compuesto de Fórmula (I) en un disolvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes, o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para emplear en CE incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo, SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca comercial registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol benzílico, alcohol furfurílico o butanol), *N*-alquilpirrolidonas (tales como *N*-metilpirrolidona o *N*-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de un ácido graso C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>) e hidrocarburos clorados. Un producto CE se puede emulsionar espontáneamente al añadir agua para producir una emulsión con suficiente estabilidad para poder aplicarla por pulverización con un equipo adecuado.
- 35 La preparación de una EAg implica obtener un compuesto de Fórmula (I), ya sea como un líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable, normalmente inferior a 70 °C) o en solución (disolviéndolo en un disolvente adecuado), y a continuación emulsionar el líquido o la solución resultantes en agua que contenga uno o más AT, con un cizallamiento elevado, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para emplear en EAg incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que presenten una solubilidad baja en agua.
- 40 Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más AT, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Hay un compuesto de Fórmula (I) presente inicialmente en el agua o en la mezcla de disolventes/AT. Los disolventes adecuados para emplear en ME incluyen los descritos previamente en la presente para emplear en CE o en EAg.
- 45 Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (se puede determinar qué sistema está presente mediante medidas de conductividad) y puede ser adecuada para mezclar pesticidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME se puede diluir en agua, en cuyo caso se puede mantener como una microemulsión o puede formar una emulsión de aceite en agua convencional.

- Los concentrados en suspensión (CS) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de Fórmula (I). Los CS se pueden preparar moliendo el compuesto de Fórmula (I) sólido con un molino de bolas o de microesferas en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual sedimentan las partículas. Como alternativa, se puede moler un compuesto de Fórmula (I) en seco y añadirlo a agua, que contenga los agentes descritos previamente en la presente, para producir el producto final deseado.
- Las formulaciones de aerosoles comprenden un compuesto de Fórmula (I) y un propelente adecuado (por ejemplo, *n*-butano). También se puede disolver o dispersar un compuesto de Fórmula (I) en un medio adecuado (por ejemplo, agua o un líquido miscible en agua tal como *n*-propanol) con el fin de proporcionar composiciones para emplear en bombas de pulverización no presurizadas y activadas manualmente.
- Las suspensiones de cápsulas (SC) se pueden preparar de manera similar a la preparación de las formulaciones de tipo EAg, pero con una etapa adicional de polimerización, de manera que se obtenga una dispersión acuosa de microgotas de aceite, en la cual cada microgota de aceite está encapsulada en una cubierta polimérica y contiene un compuesto de Fórmula (I) y, opcionalmente, un portador o diluyente para este. La cubierta polimérica se puede producir tanto mediante una reacción de policondensación interfacial como mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una liberación controlada del compuesto de Fórmula (I) y se pueden emplear para el tratamiento de semillas. También se puede formular un compuesto de Fórmula (I) en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación lenta y controlada del compuesto.
- La composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición, por ejemplo, mejorando la humectación, retención o distribución en superficies; la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la recaptación o movilidad de un compuesto de Fórmula (I). Estos aditivos incluyen agentes tensioactivos (AT), aditivos de pulverización basados en aceites, por ejemplo, ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como el aceite de soya o de colza) y mezclas de estos con otros adyuvantes biopotenciadores (ingredientes que pueden propiciar o modificar la acción de un compuesto de Fórmula (I)).
- Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser AT de tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.
- Los AT de tipo catiónico adecuados incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo, bromuro de cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.
- Los AT aniónicos adecuados incluyen sales de metales alcalinos y ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos y ácido sulfúrico (por ejemplo, laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo, dodecilbencenosulfonato de sodio, dodecilbencenosulfonato de calcio, sulfonato de butilaftaleno y mezclas de diisopropil- y triisopropilaftalenosulfonato de sodio), sulfatos de éteres, sulfatos de éteres de alcoholes (por ejemplo, lauret-3-sulfato de sodio), carboxilatos de éteres (por ejemplo, lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres de tipo fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (principalmente monoésteres) o pentóxido de fósforo (principalmente diésteres), por ejemplo, la reacción entre alcohol laurílico y ácido tetrafosfórico; además, estos productos se pueden etoxilar), sulfosuccinamatos, parafina o sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos de olefinas.
- Los AT de tipo anfótero adecuados incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.
- Los AT de tipo no iónico adecuados incluyen productos de condensación de óxidos de alquíleno, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales obtenidos a partir de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros en bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo, ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.
- Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas esponjosas (tales como bentonita o atapulgita).
- La composición de la presente puede comprender además al menos un pesticida adicional. Por ejemplo, los compuestos de acuerdo con la invención pueden emplearse también combinados con otros herbicidas o reguladores del crecimiento vegetal. En una realización preferida, el pesticida adicional es un herbicida y/o un protector contra herbicidas. Son ejemplos de tales mezclas (en las cuales 'I' representa un compuesto de Fórmula I): I + acetoclor, I + acifluorfen, I + acifluorfen-sodio, I + aclonifeno, I + acroleína, I + alaclor, I + aloxidim, I + ametrina, I + amicarbazona, I + amidosulfurón, I + aminopiralida, I + amitrol, I + anilofós, I + asulam, I + atrazina, I + azafenidina, I + azimsulfurón, I + BCPC, I + beflubutamida, I + benazolina, I + bencarbazona, I + benfluralina, I + benfuresato, I + bensulfurón, I + bensulfurón-metilo, I + bensulida, I + bentazona, I + benzefendizona, I + benzobiciclogena, I + benzofenap, I + biciclopirona, I + bifenoxy, I + bilanafós, I + bispiribac, I + bispiribac-sodio, I + bórax, I + bromacilo, I +

- bromobutida, I + bromoxinilo, I + butaclor, I + butamifós, I + butralina, I + butroxidim, I + butilato, I + ácido cacodílico, I + clorato de calcio, I + cafenstrol, I + carbetamida, I + carfentrazona, I + carfentrazona-etilo, I + clorflurenol, I + clorflurenol-metilo, I + cloridazona, I + clorimurón, I + clorimurón-etilo, I + ácido cloroacético, I + clorotolurón, I + clorprofam, I + clorsulfurón, I + clortal, I + clortal-dimetilo, I + cinidón-etilo, I + cinmetilina, I + cinosulfurón, I + cisaninilida, I + cletodim, I + clodinafop, I + clodinafop-propargilo, I + clomazona, I + clomeprop, I + clopiralida, I + cloransulam, I + cloransulam-metilo, I + cianazina, I + cicloato, I + ciclosulfamurón, I + cicloxicidim, I + cihalofop, I + cihalofop-butilo, I + 2,4-D, I + daimurón, I + dalapón, I + dazomet, I + 2,4-DB, I + I + desmedifam, I + dicamba, I + diclobenilo, I + diclorprop, I + diclorprop-P, I + diclofop, I + diclofop-metilo, I + diclosulam, I + difenoquat, I + metilsulfato de difenoquat, I + diflufenicán, I + diflufenzopir, I + dimefurón, I + dimepiperato, I + dimetaclor, I + dimetametrina, I + dimetenamida, I + dimetenamida-P, I + dimetipina, I + ácido dimetilarsínico, I + dinitramina, I + dinoterb, I + difenamida, I + dipropetrina, I + diquat, I + dibromuro de diquat, I + ditiopir, I + diurón, I + endotal, I + EPTC, I + esprocarb, I + etalfluralina, I + etametsulfurón-metilo, I + etefón, I + etofumesato, I + etoxifeno, I + etoxisulfurón, I + etobenzanida, I + fenoxaprop-P, I + fenoxaprop-P-etilo, I + fentrazamida, I + sulfato ferroso, I + flamprop-M, I + flazasulfurón, I + florasulam, I + fluazifop, I + fluazifop-butilo, I + fluazifop-P, I + fluazifop-P-butilo, I + fluazolato, I + flucarbazona, I + flucarbazona-sodio, I + flucetosulfurón, I + flucloralina, I + flufenacet, I + flufenpir, I + flufenpir-etilo, I + flumetralina, I + flumetsulam, I + flumiclorac, I + flumiclorac-pentilo, I + flumioxazina, I + flumipropina, I + fluometurón, I + fluoroglicofeno, I + fluoroglicofeno-etilo, I + fluoxaprop, I + flupoxam, I + flupropacilo, I + fluopropanato, I + flupirsulfurón, I + flupirsulfurón-metilo-sodio, I + flurenol, I + fluridona, I + fluoroclordiona, I + fluroxipir, I + flurtamona, I + flutiacet, I + flutiacet-metilo, I + fomesafeno, I + foramsulfurón, I + fosamina, I + glufosinato, I + glufosinato-amonio, I + glifosato, I + halosulfurón, I + halosulfurón-metilo, I + haloxyfop, I + haloxyfop-P, I + hexazinona, I + imazametabenz, I + imazametabenz-metilo, I + imazamox, I + imazapic, I + imazapir, I + imazaquina, I + imazetapir, I + imazosulfurón, I + indanofano, I + indaziflam, I + yodometano, I + yodosulfurón, I + yodosulfurón-metilo-sodio, I + ioxinilo, I + isoproturón, I + isourón, I + isoxabeno, I + isoxaclortol, I + isoxaflutol, I + isoxapirifop, I + karbutilato, I + lactofeno, I + lenacilo, I + linurón, I + mecoprop, I + mecoprop-P, I + mefenacet, I + mefluidida, I + mesosulfurón, I + mesosulfurón-metilo, I + mesotriona, I + metam, I + metamifop, I + metamitrón, I + metazaclor, I + metabenztiazurón, I + metazol, I + ácido metilarsínico, I + metildimrón, I + isotiocianato de metilo, I + metolaclor, I + S-metolaclor, I + metosulam, I + metoxurón, I + metribuzina, I + metsulfurón, I + metsulfurón-metilo, I + molinato, I + monolinurón, I + naproanilida, I + napropamida, I + naptalam, I + neburón, I + nicosulfurón, I + glifosato de n-metilo, I + ácido nonanoico, I + norflurazón, I + ácido oleico (ácidos grasos), I + orbencarb, I + ortosulfamurón, I + orizalina, I + oxadiargilo, I + oxadiazón, I + oxasulfurón, I + oxazicloromefona, I + oxifluorfeno, I + paraquat, I + dicloruro de paraquat, I + pebulato, I + pendimetalina, I + penoxsulam, I + pentaclorofenol, I + pentanoclor, I + pentoxazona, I + petoxamida, I + fenmedifam, I + picloram, I + picolinafeno, I + pinoxadeno, I + piperfós, I + pretilaclor, I + primisulfurón, I + primisulfurón-metilo, I + prodiamina, I + profoxidim, I + prohexadioncalcio, I + prometona, I + prometrina, I + propaclor, I + propanilo, I + propaqizafop, I + propazina, I + profam, I + propisoclor, I + propoxicarbazona, I + propoxicarbazona-sodio, I + propizamida, I + prosulfocarb, I + prosulfurón, I + piraclonilo, I + piraflufenó, I + piraflufenó-etilo, I + pirasulfotol, I + pirazolinato, I + pirazosulfurón, I + pirazosulfurón-etilo, I + pirazoxifeno, I + piribenzoxima, I + piributicarb, I + piridafol, I + piridato, I + piriftalida, I + piriminobac, I + piriminobac-metilo, I + pirimisulfano, I + piritobac, I + piritiobac-sodio, I + piroxasulfona, I + piroxsulam, I + quinclorac, I + quinmerac, I + quinoclamina, I + quizalofop, I + quizalofop-P, I + rimsulfurón, I + saflufenacilo, I + setoxidim, I + sidurón, I + simazina, I + simetrina, I + clorato de sodio, I + sulcotriona, I + sulfentrazona, I + sulfometurón, I + sulfometurón-metilo, I + sulfosato, I + sulfosulfurón, I + ácido sulfúrico, I + tebutiurón, I + tefuriltriona, I + tembotriona, I + tepraloxidim, I + terbacilo, I + terbumetón, I + terbutilazina, I + terbutrina, I + tenilclor, I + tiazopir, I + tifensulfurón, I + tiencarbazona, I + tifensulfurón-metilo, I + tiobencarb, I + topramezona, I + tralcoxdim, I + trialato, I + triasulfurón, I + triaziflam, I + tribenurón, I + tribenurón-metilo, I + triclopir, I + trietazina, I + trifloxisulfurón, I + trifloxisulfurón-sodio, I + trifluralina, I + triflusulfurón, I + triflusulfurón-metilo, I + trihidroxitriazina, I + trinexapac-etilo, I + tritosulfurón, 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 (N.<sup>o</sup> de reg. CAS 353292-31-6). Los compuestos de la presente invención también se pueden combinar con compuestos herbicidas descritos en WO06/024820 y/o WO07/096576.
- Los componentes de las mezclas que acompañan al compuesto de Fórmula I también pueden estar en forma de ésteres o sales, tal como se menciona, p. ej., en *The Pesticide Manual*, decimocuarta edición, Consejo Británico para la Protección de Cultivos, 2006.
- El compuesto de Fórmula I también puede emplearse en mezclas con otros agentes agroquímicos tales como fungicidas, nematicidas o insecticidas, ejemplos de los cuales se proporcionan en *The Pesticide Manual*.
- La proporción en la mezcla del compuesto de Fórmula I respecto al componente de la mezcla que lo acompaña está comprendida preferentemente entre 1: 100 y 1000:1.
- Las mezclas se pueden emplear convenientemente en las formulaciones mencionadas previamente (en cuyo caso el "principio activo" se refiere a la mezcla respectiva del compuesto de Fórmula I con el componente de la mezcla que lo acompaña).
- Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención también pueden emplearse combinados con uno o más protectores. Asimismo, también pueden emplearse mezclas de un compuesto de Fórmula I de acuerdo con la invención con uno o más herbicidas adicionales combinados con uno o más protectores. Los protectores pueden ser AD 67 (MON 4660), benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciprosulfamida (N.<sup>o</sup> de reg. CAS 221667-31-8), diclormida,

fenclorazol-etilo, fenclorim, fluxofenim, furilazol y el isómero R correspondiente, isoxadifeno-etilo, mefenpir-dietilo, oxabetrinilo, *N*-isopropil-4-(2-metoxibenzoilsulfamoyl)benzamida (N.<sup>o</sup> de reg. CAS 221668-34-4). Otras posibilidades incluyen los compuestos protectores descritos, por ejemplo, en EP0365484, p. ej., *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida.

- 5 Se prefieren particularmente las mezclas de un compuesto de Fórmula I con ciprosulfamida, isoxadifeno-etilo, cloquintocet-mexilo y/o *N*-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida.

Los protectores del compuesto de Fórmula I también pueden estar en forma de ésteres o sales, tal como se menciona, p. ej., en *The Pesticide Manual*, 14.<sup>a</sup> edición (BCPC), 2006. La referencia a cloquintocet-mexilo también se aplica a una sal de litio, sodio, potasio, calcio, magnesio, aluminio, hierro, amonio, amonio cuaternario, sulfonio o fosfonio de este, tal como se describe en WO 02/34048, y la referencia a fenclorazol-etilo también se aplica a fenclorazol, etc.

Preferentemente, la proporción en la mezcla del compuesto de Fórmula I respecto al protector está comprendida entre 100:1 y 1:10, especialmente entre 20:1 y 1:1.

- 15 Las mezclas se pueden emplear convenientemente en las formulaciones mencionadas previamente (en cuyo caso el "principio activo" se refiere a la mezcla respectiva del compuesto de Fórmula I con el protector).

La presente invención proporciona además un método para controlar selectivamente malezas en un emplazamiento que comprende plantas de cultivo y malezas, donde el método comprende aplicar al emplazamiento una cantidad de una composición de acuerdo con la presente invención que controle las malezas. "Controlar" significa eliminar, reducir o ralentizar el crecimiento, o prevenir o reducir la germinación. Generalmente, las plantas que se han de controlar son plantas no deseadas (malezas). "Emplazamiento" significa el área en la cual las plantas están creciendo o crecerán.

25 Las tasas de aplicación de los compuestos de Fórmula I pueden variar dentro de límites amplios y dependen de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (pre- o posemergencia, revestimiento de semillas, aplicación a los surcos de las semillas, aplicación que no sea de labranza, etc.), la planta de cultivo, la maleza o las malezas que se deseen controlar, las condiciones climáticas dominantes y otros factores determinados por el método de aplicación, el tiempo de aplicación y el cultivo deseado. Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención se aplican generalmente con una tasa comprendida entre 10 y 2000 g/ha, especialmente entre 50 y 1000 g/ha.

30 La aplicación se realiza generalmente pulverizando la composición, normalmente con un pulverizador montado en un tractor para áreas grandes, pero también se pueden emplear otros métodos tales como espolvoreo (para polvos), goteo o empapado.

Las plantas útiles en las cuales se puede emplear la composición de acuerdo con la invención incluyen cultivos tales como cereales, por ejemplo, cebada y trigo, algodón, colza oleaginosa, girasol, maíz, arroz, soya, remolacha azucarera, caña de azúcar y pasto. Se prefiere particularmente el maíz.

- 35 Las plantas de cultivo también pueden incluir árboles, tales como árboles frutales, palmeras, cocoteros u otros frutos secos. También se incluyen vides tales como uvas, arbustos frutales, plantas frutales y hortalizas.

40 Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye aquellos cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (p. ej., inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO, ACCasa y HPPD) mediante métodos convencionales de cultivo selectivo o mediante ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que ha sido modificado para que sea tolerante a imidazolinonas, p. ej., imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo es la colza de verano Clearfield® (canola). Los ejemplos de cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen, p. ej., las variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®.

45 En una realización preferida, la planta de cultivo se modifica para que sea tolerante a inhibidores de HPPD mediante ingeniería genética. Por ejemplo, WO0246387 describe métodos de modificación de plantas de cultivo para que sean tolerantes a inhibidores de HPPD. Por lo tanto, en una realización incluso más preferida, la planta de cultivo es transgénica respecto a un polinucleótido que comprende una secuencia de ADN que codifica una enzima HPPD resistente a inhibidores de HPPD derivada de una bacteria, más particularmente de *Pseudomonas fluorescens* o *Shewanella colwelliana*, o de una planta, más particularmente, derivada de una planta monocotiledónea o, aún más particularmente, de una especie de cebada, maíz, trigo, arroz, *Brachiaria*, *Chenchrus*, *Lolium*, *Festuca*, *Setaria*, *Eleusine*, *Sorghum* o *Avena*.

50 Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye aquellos cultivos que han sido modificados para que sean resistentes a insectos perjudiciales mediante métodos de ingeniería genética, por ejemplo, maíz Bt (resistente al gusano barrenador del maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo del algodón) y también papas Bt (resistentes al escarabajo de Colorado). Algunos ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína producida de forma natural por la bacteria del suelo *Bacillus*

*thuringiensis*. En los documentos EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427 529 se describen ejemplos de toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas. Algunos ejemplos de plantas transgénicas que comprenden uno o más genes que codifican una resistencia a insecticidas y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard®

5 (algodón), NewLeaf® (papas), NatureGard® y Protexcta®. Tanto los cultivos de plantas como el material de las semillas de estas pueden ser resistentes a herbicidas y, al mismo tiempo, a insectos que se alimentan de ellos (eventos transgénicos "combinados"). Por ejemplo, la semilla puede ser capaz de expresar una proteína Cry3 insecticida y a la vez ser tolerante al glifosato.

10 Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye aquellos cultivos que se obtienen mediante métodos convencionales de cultivo selectivo o ingeniería genética y que contienen los denominados rasgos externos (p. ej., una estabilidad de almacenamiento mejorada, mayor valor nutricional y mejor sabor).

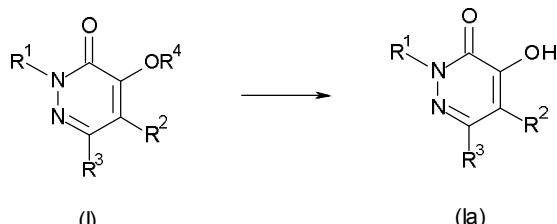
Otras plantas útiles incluyen pasto, por ejemplo, en campos de golf, praderas, parques y arces, o cultivado comercialmente para el césped, y plantas ornamentales tales como flores o arbustos.

15 Las composiciones se pueden emplear para controlar plantas no deseadas (colectivamente, "malezas"). Las malezas que se han de controlar pueden ser especies monocotiledóneas, por ejemplo, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* y *Sorghum*, y especies dicotiledóneas, por ejemplo, *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Conyza*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* y *Xanthium*. Las malezas también pueden incluir plantas que pueden considerarse plantas de cultivo pero que crecen en un área que no es de cultivo ("escapes") o que emergen de una semilla remanente de una plantación previa de un cultivo diferente ("voluntarios"). Tales voluntarios o escapes pueden ser tolerantes a otros herbicidas determinados.

20 Los compuestos de la presente invención pueden prepararse empleando los siguientes métodos.

25 Los compuestos de fórmula (1a) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (I) tal como se muestra en el esquema de reacción 1.

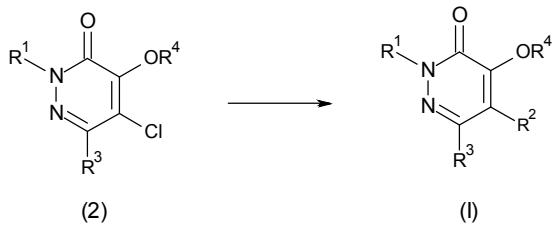
#### Esquema de reacción 1



30 Los compuestos de fórmula (1a), en los que R<sup>4</sup> es hidrógeno, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula I, en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, por calentamiento con morfolina (Nagashima, Hiromu *et al.* *Heterocycles*, 26(1), 1-4; 1987);

Los compuestos de fórmula (I) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (2) tal como se muestra en el esquema de reacción 2.

#### Esquema de reacción 2

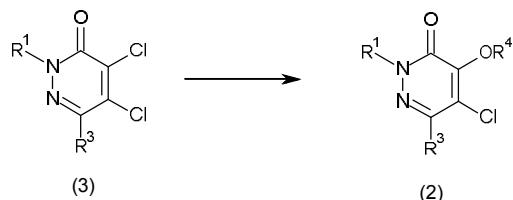


35 Los compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, y en los que R<sup>2</sup> es arilo o heteroarilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (2) por reacción con un metal o derivado metaloide Y-M adecuado (p. ej., un ácido o éster borónico, un derivado de trialquilestaño, un derivado de zinc o un reactivo de Grignard) en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como fosfato de potasio o fluoruro de cesio), una fuente de metal (p. ej., una fuente de paladio, tal como Pd(OAc)<sub>2</sub>) y opcionalmente un ligando para el metal (p. ej., un ligando de tipo fosfina) en un disolvente adecuado (p. ej., un único disolvente, tal como dimetilformamida, o un sistema de disolventes mezclados tal como una mezcla de dimetoxietano y agua o tolueno y agua). El catalizador metálico y los ligandos también se pueden añadir como un único complejo preformado (p. ej.,

un complejo de paladio/fosfina, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio o el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y diclorometano).

Los compuestos de fórmula (2) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (3) tal como se muestra en el esquema de reacción 3.

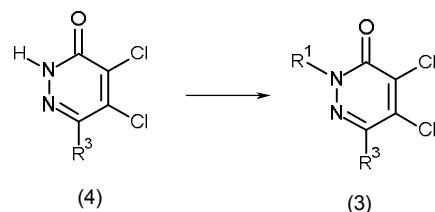
## 5 Esquema de reacción 3



Los compuestos de fórmula (2), en los que  $R^4$  es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (3) por reacción con un alcóxido metálico adecuado, por ejemplo, metóxido de sodio, en un disolvente adecuado tal como dioxano.

- 10 Los compuestos de fórmula (3) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (4) tal como se muestra en el esquema de reacción 4.

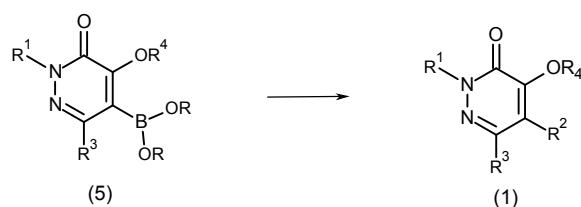
## **Esquema de reacción 4**



- 15 Los compuestos de fórmula (3) se pueden preparar a partir del compuesto de fórmula (4) (4,5-dicloro-1*H*-piridazin-6-ona – se puede adquirir de proveedores comerciales) por reacción con un agente alquilante  $R^1-X$  adecuado, donde  $X$  es un grupo saliente tal como un haluro, por ejemplo, yoduro de metilo, en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como carbonato de potasio) en un disolvente adecuado tal como *N,N*-dimetilformamida.

Como alternativa, los compuestos de fórmula (1) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (5) tal como se muestra en el esquema de reacción 5.

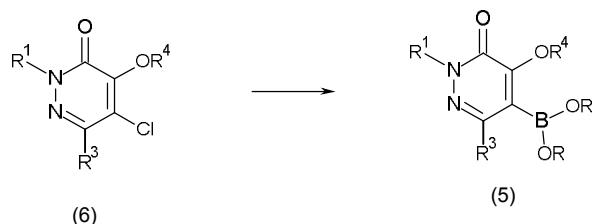
- 20 Esquema de reacción 5



- Los compuestos de fórmula (1), en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, y en los que R<sup>2</sup> es arilo o heteroarilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (5) por reacción con un agente alquilante R<sup>2</sup>-X adecuado en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como fosfato de potasio o fluoruro de cesio), una fuente de metal (p. ej., una fuente de paladio, tal como Pd(OAc)<sub>2</sub>) y opcionalmente un ligando para el metal (p. ej., un ligando de tipo fosfina) en un disolvente adecuado (p. ej., un único disolvente, tal como dimetilformamida, o un sistema de disolventes mezclados tal como una mezcla de dimetoxietano y agua o tolueno y agua). El catalizador metálico y los ligandos también se pueden añadir como un único complejo preformado (p. ej., un complejo de paladio/fosfina, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio o el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y diclorometano).

Los compuestos de fórmula (5) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (6) tal como se muestra en el esquema de reacción 6.

## **Esquema de reacción 6**

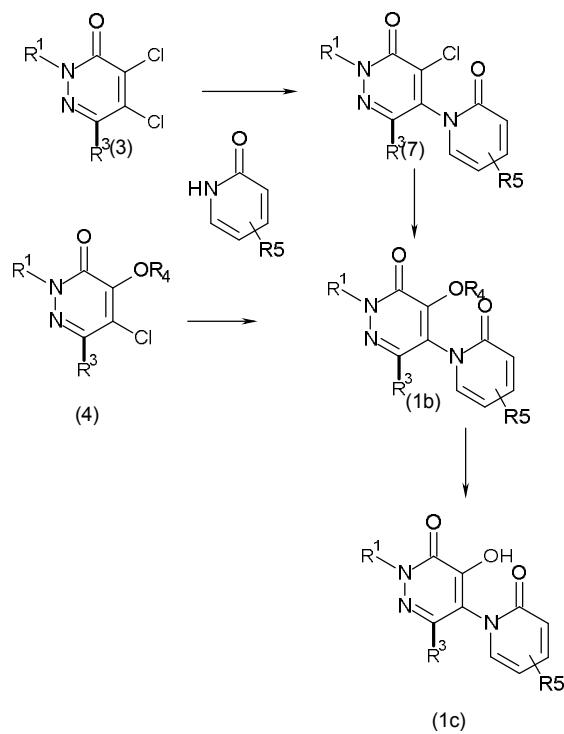


Los compuestos de fórmula (5), en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (6) por reacción con un ácido o éster borónico adecuado, por ejemplo, bis(pinacolato)diboro en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como fosfato de potasio o fluoruro de cesio), una fuente de metal (p. ej., una fuente de paladio, tal como Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub> o Pd(OAc)<sub>2</sub>) y opcionalmente un ligando para el metal (p. ej., un ligando de tipo fosfina tal como triciclohexilfosfina) en un disolvente adecuado (p. ej., un único disolvente, tal como dioxano, o un sistema de disolventes mezclados tal como una mezcla de dimetoxietano y agua o tolueno y agua). El catalizador metálico y los ligandos también se pueden añadir como un único complejo preformado (p. ej., un complejo de paladio/fosfina, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio o el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y diclorometano).

En la técnica existe constancia de reacciones análogas, p. ej., *Tetrahedron*, 57(49), 9813-9816; 2001.

Como alternativa, los compuestos de fórmula (1c), en los que R<sup>2</sup> es un heterociclo enlazado mediante un nitrógeno, por ejemplo, indol o piridona, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (3) o (4) tal como se muestra en el esquema de reacción 7.

15 Esquema de reacción 7

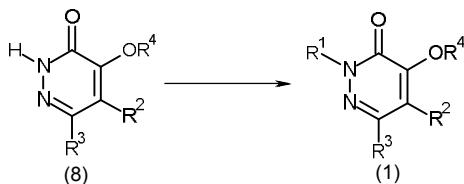


Los compuestos de fórmula (7) y (1b) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (3) y (4), respectivamente, por reacción con un heterociclo que contenga nitrógeno, tal como un indol o una piridona, en presencia de una base adecuada y en un disolvente adecuado.

20 Los compuestos de fórmula (1b), en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (7) tal como se describe en el esquema de reacción 3 y los compuestos de fórmula (1c) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (1b) tal como se describe en el esquema de reacción 1. Como alternativa, los compuestos de fórmula (1c) se pueden preparar directamente a partir de compuestos de fórmula (7) por reacción con un hidróxido metálico adecuado, tal como hidróxido de potasio, en un disolvente adecuado tal como metanol acuoso.

25

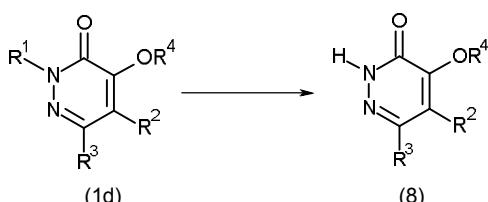
Los compuestos de fórmula (1) también se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (8) tal como se muestra en el esquema de reacción 8.

**Esquema de reacción 8**

Los compuestos de fórmula (1), en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (8) por reacción con un alcohol R<sup>1</sup>OH adecuado, en un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano, en presencia de un aditivo adecuado tal como trifenilfosfina, y un azodicarboxilato tal como azodicarboxilato dietílico (DEAD) o azodicarboxilato diisopropílico (DIAD).

5

Los compuestos de fórmula (8) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (1d) tal como se muestra en el esquema de reacción 9.

**Esquema de reacción 9**

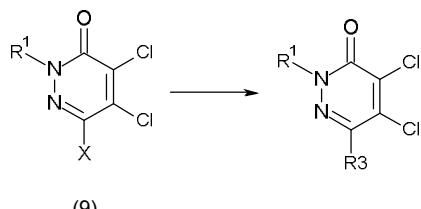
10

Los compuestos de fórmula (8) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (1d), en los que R<sup>1</sup> es un grupo protector que se puede eliminar tal como p-metoxibencilo, por reacción con un agente oxidante adecuado tal como nitrato de cerio y amonio, en un disolvente adecuado tal como acetonitrilo acuoso.

15

Los compuestos de fórmula (1d), en los que R<sup>1</sup> es un grupo protector que se puede eliminar tal como p-metoxibencilo, se pueden preparar a partir del compuesto (4) (4,5-dicloro-1*H*-piridazin-6-ona), que se puede adquirir de proveedores comerciales, mediante un método análogo al de los esquemas 2-4.

Los compuestos de fórmula (3) también se pueden preparar a partir de compuestos (9) tal como se muestra en el esquema de reacción 10.

**Esquema de reacción 10**

20

Los compuestos de fórmula (3), en los que R<sup>3</sup> es, por ejemplo, alquilo, alkenilo o alquinilo, también se pueden preparar a partir de compuestos (9), en los que X es un grupo saliente adecuado tal como bromuro, por reacción con un metal o derivado metaloide Y-M adecuado (p. ej., un ácido o éster borónico, un derivado de trialquilestaño, un derivado de zinc o un reactivo de Grignard) en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como fosfato de potasio o fluoruro de cesio), una fuente de metal (p. ej., una fuente de paladio, tal como Pd(OAc)<sub>2</sub>) y opcionalmente un ligando para el metal (p. ej., un ligando de tipo fosfina) en un disolvente adecuado (p. ej., un único disolvente, tal como dioxano, o un sistema de disolventes mezclados tal como una mezcla de dimetoxietano y agua o tolueno y agua). El catalizador metálico y los ligandos también se pueden añadir como un único complejo preformado (p. ej., un complejo de paladio/fosfina, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio o el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y diclorometano).

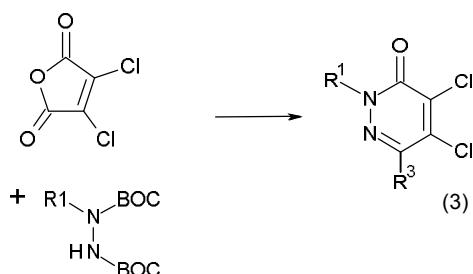
25

Los compuestos de fórmula (9) se pueden preparar mediante métodos conocidos.

30

Los compuestos de fórmula (3) también se pueden preparar tal como se muestra en el esquema de reacción 11.

**Esquema de reacción 11**

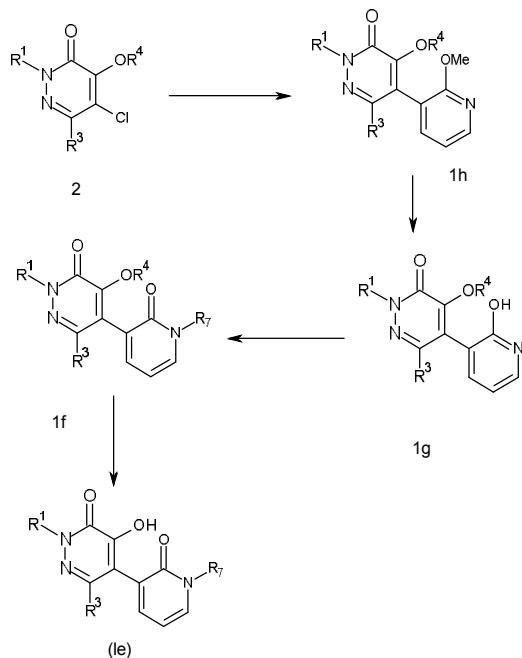


Los compuestos de fórmula (3), en los que R<sup>3</sup> es hidrógeno, se pueden preparar por reacción de 3,4-dicloro-2,5-furandiona o 3,4-dibromo-2,5-furandiona con una hidrazina protegida de forma adecuada en un disolvente adecuado tal como ácido clorhídrico acuoso.

- 5 Se describen reacciones análogas, p. ej., en *Angewandte Chemie* (1965), 77(7), 282-90; *Synthetic Communications* (2006), 36(18), 2719-2726.

Los compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> es una piridona enlazada mediante C, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 2 tal como se muestra en el esquema de reacción 12.

#### Esquema de reacción 12



- 10 Los compuestos de fórmula 1h, en los que R<sup>4</sup> es un alquilo inferior, por ejemplo, metilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 2 por reacción con un metal o derivado metaloide de 2-metoxipiridina adecuado (p. ej., un ácido o éster borónico, un derivado de trialquilestaño, un derivado de zinc o un reactivo de Grignard) en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como fosfato de potasio o fluoruro de cesio), una fuente de metal (p. ej., una fuente de paladio, tal como Pd(OAc)<sub>2</sub>) y opcionalmente un ligando para el metal (p. ej., un ligando de tipo fosfina) en un disolvente adecuado (p. ej., un único disolvente, tal como dimetilformamida, o un sistema de disolventes mezclados tal como una mezcla de dimetoxietano y agua o tolueno y agua). El catalizador metálico y los ligandos también se pueden añadir como un único complejo preformado (p. ej., un complejo de paladio/fosfina, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio o el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y diclorometano).

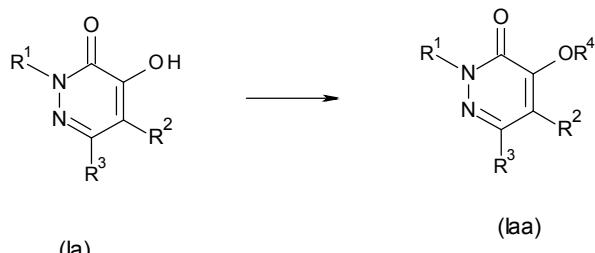
El compuesto 1g se puede preparar a partir del compuesto 1h por reacción con un ácido acuoso diluido, tal como ácido clorhídrico, opcionalmente con calentamiento o reacción en el microondas, de forma análoga a los métodos conocidos tales como los descritos en *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 18(9), 2967-2971; 2008.

- 25 Los compuestos de fórmula 1f se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 1g por reacción con un yoduro de arilo adecuado, en presencia de yoduro de cobre, una base adecuada tal como trifosfato de potasio, en presencia de un catalizador adecuado tal como cloruro de tetrabutilamonio, en un disolvente adecuado tal como N,N-

dimetilformamida, opcionalmente con calentamiento o reacción en el microondas. Se describen reacciones análogas, p. ej., en *Tet. Lett.* 45 (2004) 4257-4260.

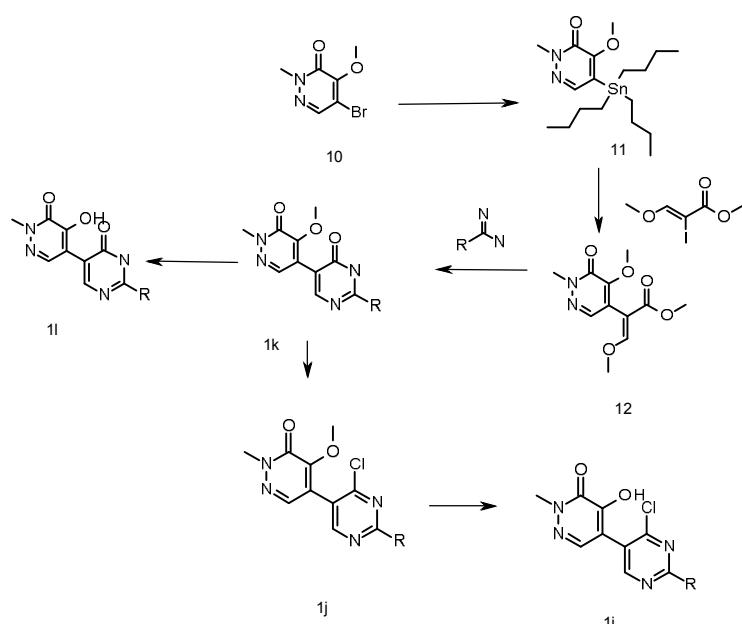
Los compuestos de fórmula 1e se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (1g) tal como se describe en el esquema de reacción 1.

## 5 Esquema de reacción 13



Los compuestos de fórmula (1aa), en los que R<sup>4</sup> es, por ejemplo, alquilcarbonilo, arilcarbonilo, alcoxcarbonilo, 10  
alcoxisulfonilo o arilsulfonilo, se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula general (1a), en los que R<sup>4</sup> es hidrógeno, por reacción con un haluro adecuado tal como cloruro de acetilo, cloroformiato de metilo, tiocloroformiato de etilo o cloruro de *p*-toluenosulfonilo, en presencia de una base adecuada tal como trietilamina o piridina, en presencia de un disolvente adecuado tal como diclorometano o tolueno.

## Esquema de reacción 14



15 Los compuestos de fórmula (1i), en los que R<sup>2</sup> es una pirimidina sustituida, o de fórmula (1l), en los que R<sup>2</sup> es una pirimidinona sustituida, se pueden preparar de acuerdo con el esquema de reacción 14. Los compuestos de fórmula (11) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 10 por reacción del reactivo de Grignard correspondiente con cloruro de tributilestaño en presencia de un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano, con enfriamiento de la reacción durante la adición de los reactivos. Se describen reacciones análogas, p. ej., en *J. Org. Chem.*, 2011, 76, 6670-6677 (formación de los reactivos de Grignard), WO2010/59943 (pág. 32) y *Journal of Organometallic Chemistry*, 1973, (63), 133 – 138.

20 Los compuestos de fórmula (12) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (11) por reacción con (Z)-2-yodo-3-metoxiprop-2-enoato de metilo en presencia de una base adecuada (p. ej., una base inorgánica, tal como fosfato de potasio o fluoruro de cesio), una fuente de metal (p. ej., una fuente de paladio, tal como tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0)) y un catalizador tal como yoduro de cobre, opcionalmente con calentamiento, de acuerdo con procesos análogos, p. ej., *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2004, 43, 1132-1136.

25 Los compuestos de fórmula general (1k) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula general (12) por reacción con una amidina adecuada en presencia de un alcóxido metálico adecuado, por ejemplo, metóxido de sodio, en un disolvente adecuado tal como metanol, con calentamiento de la mezcla de reacción.

Los compuestos de fórmula general (1j) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula general (1k) por reacción con un reactivo clorante adecuado, tal como oxicloruro de fósforo, opcionalmente en presencia de un disolvente adecuado, de acuerdo con procedimientos conocidos, p. ej., *Journal of Organic Chemistry*, 76(10), 4149-4153; 2011.

- 5 Los compuestos de fórmulas generales (1i) y (1l) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmulas generales (1j) y (1k), respectivamente, tal como se describe en el esquema de reacción 1.

### Ejemplos

A continuación, se proporcionan ejemplos de la síntesis de compuestos específicos de la presente invención.

#### **Ejemplo 1.**

10 **5-[2-cloro-3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxi-2-propilpiridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de 5-[2-cloro-3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxi-2-propilpiridazin-3-ona (692 mg, 1.62 mmol) en morfolina (1.42 mL) hasta 100 °C durante 1 h. La mezcla de reacción se enfrió, a continuación se añadieron diclorometano (20 mL) y ácido clorhídrico 2 M (20 mL), y la mezcla se agitó durante 30 min. La fase de diclorometano se separó y a continuación la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano.

- 15 Los extractos orgánicos combinados se hicieron pasar a través de un cartucho de separación de fases y posteriormente se concentraron al vacío. El producto crudo se disolvió en acetato de etilo, a continuación se hizo precipitar con hexano, se concentró al vacío y se lavó con acetonitrilo para obtener el producto como un sólido blanquecino (224.6 mg).

**5-[2-cloro-3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxi-2-propilpiridazin-3-ona**

- 20 Se calentó una mezcla de 5-cloro-4-metoxi-2-propilpiridazin-3-ona (811 mg, 4 mmol), acetato de potasio (589 mg, 6 mmol), bis(pinicolato)díboro (1.52 g, 6 mmol), tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (0) (148 mg, 0.16 mmol) y triciclohexilfosfina (180 mg, 0.64 mmol) en dioxano desgasificado (12 mL) a 150 °C durante 15 minutos con irradiación de microondas. La mezcla se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se filtró a través de Celite, eluyendo con acetato de etilo. El filtrado se evaporó a presión reducida y a continuación se utilizó directamente en el siguiente paso.

Se disolvió el éster boronato crudo en dimetoxietano desgasificado (12 mL); se añadieron a la mezcla 3-(3-bromo-2-cloro-6-metilsulfonilfenil)-4,5-dihidroisoxazol (2.71 g, 8 mmol), fluoruro de cesio (2.43 g, 16 mmol) y el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) y diclorometano (260 mg, 0.32 mmol). La mezcla resultante se calentó a 150 °C durante 20 minutos con irradiación de microondas, a continuación se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y se filtró a través de Celite, eluyendo con acetato de etilo. El filtrado se concentró a presión reducida, posteriormente se purificó mediante cromatografía en sílice eluyendo con 0-100% de acetato de etilo en isohexano para obtener el producto como un aceite marrón (692 mg).

8.06 (1H, d, J 8.1), 7.59 (1H, s), 7.56 (1H, d, J 8.1), 4.63 (3H, t, J 10.2), 4.19 (3H, s), 4.12 (2H, dd, J 7.3, 7.3), 3.47 (3H, t, J 10.2), 3.28 (3H, s), 1.90 (2H, m), 1.02 (3H, t, J 7.2)

35 **5-cloro-4-metoxi-2-propilpiridazin-3-ona**

A una solución agitada de 4,5-dicloro-2-propilpiridazin-3-ona (7.31 g, 35.3 mmol) en dioxano (150 mL), se añadió una solución de metóxido sódico en metanol (al 25% en peso en metanol, 8.6 mL, 38.8 mmol) gota a gota y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 60 min. Se añadió agua (150 mL) y la mezcla se extrajo con éter dietílico (3 x 100 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron, se filtraron y se concentraron al vacío.

- 40 El producto crudo se purificó mediante cromatografía en sílice eluyendo con acetato de etilo/hexanos para obtener el producto deseado como un aceite incoloro (5.44 g).

**4,5-dicloro-2-propilpiridazin-3-ona**

A una solución agitada de 4,5-dicloro-1*H*-piridazin-6-ona (8.25 g, 50 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (25 mL) a temperatura ambiente, se añadieron carbonato de potasio (1.2 g, 60 mmol) y 1-yodopropano (5.85 mL, 60 mmol). La mezcla se agitó a 70 °C durante 2 h, a continuación se añadió agua (75 mL) y la mezcla se extrajo con diclorometano (3 x 100 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron, se filtraron y se concentraron al vacío, a continuación se repartieron entre salmuera (200 mL) y éter dietílico (200 mL). La fase orgánica se secó, se filtró y se concentró al vacío para obtener un aceite marrón. El producto crudo se purificó mediante cromatografía en sílice eluyendo con acetato de etilo/hexanos para obtener el producto deseado como un aceite incoloro (7.31 g).

- 50 7.78 (1H, s), 4.20-4.11 (2H, m), 1.90-1.74 (2H, m), 0.96 (3H, t, J 7.2)

**Ejemplo 2**

**4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (48 mg, 0.132 mmol) en morfolina (2 mL) hasta 100 °C durante 3 horas. A continuación, la reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y se evaporó a presión reducida. El residuo resultante se disolvió en acetato de etilo y se lavó

5 con ácido clorhídrico 2 M. A continuación, la fase orgánica se secó con sulfato de sodio y se evaporó. El sólido resultante se lavó con diclorometano/hexano para obtener el producto deseado como un sólido de color rosa pálido (25 mg).

**4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona**

A una solución de 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfanil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (90 mg, 0.27 mmol) en 10 ácido acético (4 mL), se añadió peróxido de hidrógeno (al 50% en peso en agua, 56 mg, 0.82 mmol) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se calentó lentamente hasta 55 °C y se mantuvo a esa temperatura durante toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se desactivó con hidrogenocarbonato de sodio ac. sat. e hidrogenocarbonato de sodio sólido lentamente hasta que se alcanzó un pH de ~6-7. La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados se secaron con sulfato de sodio y 15 se evaporaron para obtener el producto deseado (78 mg) como un aceite de color amarillo pálido. Este se empleó sin purificación adicional.

δ<sub>H</sub> (CDCl<sub>3</sub>) 8.46 (1H, d), 7.98 (1H, dd), 7.60 (1H, s), 7.46 (1H, d), 4.14 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.02 (3H, s)

**4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfanil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de 5-cloro-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (100 mg, 0.573 mmol), acetato de potasio (84 mg, 20 0.86 mmol), bis(pinacolato)diboro (218 mg, 0.86 mmol), tris(dibencilidenoacetona)ditacaladio (0) (4%, 21 mg, 0.023 mmol) y triciclohexilfosfina (16%, 26 mg, 0.092 mmol) en dioxano desgasificado (2.5 mL) a 150 °C durante 15 min 25 con radiación de microondas. La mezcla se filtró a través de Celite, se lavó con acetato de etilo y el filtrado se evaporó a presión reducida. El residuo se disolvió en 1,2-dimetoxietano desgasificado (2.5 mL) y se añadieron 1-bromo-2-metilsulfanil-4-(trifluorometil)benceno (233 mg, 0.86 mmol), fluoruro de cesio (348 mg, 2.29 mmol), y el complejo de cloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) y diclorometano (8%, 38 mg, 0.046 mmol). La mezcla resultante se calentó a 160 °C durante 15 min con radiación de microondas. La mezcla de reacción se filtró 30 a través de Celite y se lavó con acetato de etilo. El filtrado se evaporó a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en sílice, eluyendo con 0-40% de acetato de etilo en hexanos, para obtener el producto deseado (190 mg, que contenía una pequeña cantidad de impureza de pinacol residual) como un aceite rojo. Este se empleó sin purificación adicional.

δ<sub>H</sub> (CDCl<sub>3</sub>) 7.52 (1H, s), 7.50 (1H, s a), 7.47 (1H, d a), 7.26 (1H, d a), 4.05 (3H, s), 3.84 (3H, s), 2.49 (3H, s)

**5-cloro-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona**

A una solución agitada de 4,5-dicloro-2-metilpiridazin-3-ona (19.7 g, 110 mmol) en 1,4-dioxano (550 mL), se añadió 35 metóxido de sodio (28.5 g, 132 mmol, 30.2 mL) gota a gota y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 h. La reacción se desactivó con agua (~500 mL) y a continuación se extrajo con éter dietílico (500 mL y después 250 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron, se filtraron y se concentraron al vacío para obtener 15.83 g de un sólido blanco.

δ<sub>H</sub> (CDCl<sub>3</sub>) 7.68 (1H, s), 4.28 (3H, s), 3.75 (3H, s)

**4,5-dicloro-2-metilpiridazin-3-ona**

40 A una solución agitada de 4,5-dicloro-1*H*-piridazin-6-ona (25.0 g, 152 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (152 mL), se añadieron carbonato de potasio (25.4 g, 182 mmol) y yodometano (25.8 g, 182 mmol, 11.3 mL). La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. A continuación, la mezcla de reacción se vertió sobre agua-hielo (300 mL) y la mezcla se agitó durante 15 min. El precipitado resultante se separó por filtración, 45 después se disolvió en diclorometano y se hizo pasar a través de un cartucho de separación de fases. Los extractos orgánicos se concentraron al vacío para obtener 19.7 g de un sólido de color marrón pálido.

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 3.83 (s, 3H) 7.77 (s, 1H)

**Ejemplo 3****4-hidroxi-2-metil-5-[3-(*m*-tolil)-2-oxo-4-(trifluorometil)-1-piridil]piridazin-3-ona**

50 Se calentó una mezcla de 4-cloro-2-metil-5-[3-(*m*-tolil)-2-oxo-4-(trifluorometil)-1-piridil]piridazin-3-ona (74 mg, 0.19 mmol) en hidróxido de potasio acuoso (0.5 M, 3 mL, 0.606 mmol) y metanol (2.5 mL) a 55 °C durante 90 minutos. Se añadió morfolina (1 mL) y la reacción se calentó a 90 °C durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. A continuación, se añadió ácido clorhídrico 2 M cuidadosamente al residuo con agitación rápida

durante 5-10 min. El precipitado de color crema resultante se filtró, se lavó con ácido clorhídrico 2 M y agua, y después se secó en un horno de vacío a 55 °C durante toda la noche para obtener el producto deseado (37 mg).

#### **4-cloro-2-metil-5-[3-(*m*-tolil)-2-oxo-4-(trifluorometil)-1-piridil]piridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de 3-(*m*-tolil)-4-(trifluorometil)-1*H*-piridin-2-ona (68 mg, 0.269 mmol), 4,5-dicloro-2-metilpiridazin-3-ona (58 mg, 0.323 mmol) y carbonato de potasio (112 mg, 0.807 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (1 mL) en el microondas a 150 °C durante 25 min. A continuación, la mezcla de reacción se vertió sobre ácido clorhídrico 2 M y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en sílice eluyendo con acetato de etilo en hexanos para obtener el producto deseado como un aceite amarillo (74 mg).

10 δ<sub>H</sub> (CDCl<sub>3</sub>) 7.84 (1H, s), 7.34-7.22 (3H, m), 7.11 (2H, m), 6.63 (1H, d), 3.88 (3H, s), 2.38 (3H, s)

#### **3-(*m*-tolil)-4-(trifluorometil)-1*H*-piridin-2-ona**

Se calentó una mezcla de 2-cloro-3-(*m*-tolil)-4-(trifluorometil)piridina (96 mg, 0.353 mmol) e hidróxido de sodio en sulfóxido de dimetilo (0.6 mL) y agua (0.6 mL) a 150 °C con irradiación de microondas durante 60 minutos. La mezcla líquida se separó del residuo vítreo y se acidificó hasta pH 1 con ácido clorhídrico 2 M. El precipitado blanco resultante se filtró, se lavó con unas gotas de agua y se secó en un horno de vacío a 55 °C durante toda la noche para obtener el producto como un sólido blanco (68 mg).

δ<sub>H</sub> (CD<sub>3</sub>OD) 7.62 (1H, d), 7.34-7.30 (1H, m), 7.25-7.23 (1H, m), 7.06 (1H, s), 7.02 (1H, d), 6.66 (1H, d), 2.40 (3H, s)

#### **2-cloro-3-(*m*-tolil)-4-(trifluorometil)piridina**

Se calentó una mezcla de 2-cloro-3-yodo-4-metilpiridina (200 mg, 0.652 mmol), ácido *m*-tolilborónico (132 mg, 0.976 mmol), tetrakis(trifenilfosfina) paladio (0) (8%, 60 mg, 0.052 mmol) y carbonato de potasio (136 mg, 0.976 mmol) en 1,2-dimetoxietano (2.8 mL) a 150 °C durante 30 min con irradiación de microondas. La mezcla de reacción se vertió sobre salmuera y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron.

25 La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en sílice, eluyendo con acetato de etilo en hexanos, para obtener el producto como un aceite incoloro (96 mg).

#### **2-cloro-3-yodo-4-metilpiridina**

Se añadió *n*-butillitio (1.6 M en hexanos, 13.3 mL, 21.3 mmol) gota a gota a una solución de diisopropilamina (33 mL, 23.3 mmol) en tetrahidrofurano (7 mL) a -70 °C (temp. interna) y la mezcla resultante se agitó durante 30 min. A continuación, se añadió 2-cloro-4-trifluorometilpiridina (2.5 mL, 3.52 g, 19.4 mmol) gota a gota en 20 minutos y la mezcla se agitó durante 2 horas a -70 °C. A continuación, esta se transfirió rápidamente a través de una cánula a una solución de yodo (5.2 g, 20.4 mmol) en tetrahidrofurano (3 mL) mantenida a 0 °C. La mezcla resultante se agitó durante 10 min, se desactivó con metabisulfito sódico acuoso y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se separó, se lavó con salmuera, se secó con sulfato de magnesio y se evaporó. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en sílice, eluyendo con acetato de etilo en hexano, para obtener el compuesto deseado (4.87 g, ~82%) como un sólido de color amarillo pálido contaminado con trazas de material de partida.

δ<sub>H</sub> (CDCl<sub>3</sub>) 8.50 (1H, d), 7.44 (1H, d)

#### **Ejemplo 4**

#### **2-ciclopentil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxipiridazin-3-ona**

A una solución agitada de 4-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-5-metoxi-1*H*-piridazin-6-ona (126 mg, 0.35 mmol), trifenilfosfina (184 mg, 0.70 mmol) y ciclopentanol (0.06 mL, 0.70 mmol) en THF anhidro (3.5 mL) en atmósfera de nitrógeno, se añadió azodicarboxilato de diisopropilo (0.14 mL, 0.7 mmol) gota a gota. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas y después se concentró al vacío. El producto crudo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice, eluyendo con isohexano/acetato de etilo, para obtener 2-ciclopentil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxipiridazin-3-ona (94 mg).

45 8.06 (1H, d, J 8.1), 7.56 (1H, s), 7.43 (1H, d, J 8.1), 5.50-5.41 (1H, m), 4.61 (2H, t, J 9.9), 4.10 (3H, s), 3.41 (2H, s a), 3.22 (3H, s), 2.17-2.02 (2H, m), 2.04 (3H, s), 2.00-1.86 (4H, m), 1.74-1.67 (2H, m)

#### **4-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-5-metoxi-1*H*-piridazin-6-ona**

A una solución agitada de 5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-2-[(4-hidroxifenil)metil]-4-metoxipiridazin-3-ona (281 mg, 0.58 mmol) en acetonitrilo (5 mL) y agua (1 mL) a temperatura ambiente, se añadió nitrato de amonio y cerio, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. La reacción se monitorizó mediante LCMS.

Después de 90 minutos, se añadieron salmuera (25 mL) y acetato de etilo (25 mL). Las fases se separaron y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo dos veces más. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con bicarbonato sódico acuoso sat. (25 mL), a continuación se secaron y se concentraron al vacío. El producto crudo se lavó con hexano (~20 mL) y se filtró para obtener 126 mg de un sólido de color amarillo pálido.

- 5 8.08 (1H, d, J 8.1), 7.56 (1H, s), 7.44 (1H, d, J 8.1), 4.61 (2H, t, J 10.2), 4.19 (3H, s), 3.43 (2H, s a), 3.22 (3H, s), 2.19 (3H, s)

#### **5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-2-[4-hidroxifenil]metil]-4-metoxipiridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de 5-cloro-4-metoxi-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona (281 mg, 1 mmol), acetato de paladio (18 mg, 0.08 mmol), 3-[2-metil-6-metilsulfonil-3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-4,5-dihidroisoxazol (548 mg, 1.5 mmol), fosfato de tripotasio acuoso (0.4 mL, 2 mmol) y SPhos (66 mg, 0.16 mmol) en tolueno desgasificado a 150 °C durante 30 minutos con irradiación de microondas. La mezcla se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se filtró a través de Celite, eluyendo con acetato de etilo. El filtrado se evaporó a presión reducida y posteriormente se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el producto deseado como un aceite rosa (281 mg).

- 10 15 8.00 (1H, d), 7.49 (1H, s), 7.41 (2H, d), 7.35 (1H, d), 6.86 (2H, d), 5.36-5.14 (2H, d a), 4.54 (2H, t), 4.07 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.34 (2H, s a), 3.18 (3H, s), 2.11 (3H, s)

El 3-[2-metil-6-metilsulfonil-3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-4,5-dihidroisoxazol se prepara como se describe en el ejemplo 7 más adelante.

#### **5-cloro-4-metoxi-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona**

- 20 25 A una solución agitada de 4,5-dicloro-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona (5.70 g, 20 mmol) en dioxano anhídrico (50 mL), se añadió una solución de metóxido de sodio (solución al 30% en peso en metanol (~5.4 M), 4.07 mL, 22 mmol) a temperatura ambiente. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente, mientras se monitorizaba mediante LCMS, y después se vertió sobre agua (50 mL)/diclorometano (50 mL). La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo con diclorometano (2 x 50 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron con sulfato de magnesio y se evaporaron. El producto crudo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice, eluyendo con acetato de etilo/hexano, para obtener el producto deseado 5-cloro-4-metoxi-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona como un sólido blanco (4.53 g) junto con el compuesto isomérico, 4-cloro-5-metoxi-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona (650 mg).

Datos de RMN:

- 30 35 5-cloro-4-metoxi-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona: 7.70 (1H, s), 7.39 (2H, d), 6.84 (2H, d), 5.20 (2H, s), 4.24 (3H, s), 3.79 (3H, s)  
4-cloro-5-metoxi-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona: 7.80 (1H, s), 7.40 (2H, d), 6.86 (2H, d), 5.29 (2H, s), 4.02 (3H, s), 3.79 (3H, s)

La 4,5-dicloro-2-[(4-metoxifenil)metil]piridazin-3-ona se prepara a partir de 4,5-dicloro-1*H*-piridazin-6-ona mediante un procedimiento análogo al que se ha descrito en el ejemplo 1 anteriormente.

#### **Ejemplo 5**

#### **5-[6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]-4-hidroxi-2-metilpiridazin-3-ona**

- 40 45 50 Se disolvió 5-[6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (70 mg, 0.1976 mmol) en acetonitrilo (5 mL) y se añadió yoduro de sodio (50 mg, 0.33 mmol) en un tubo de microondas de 20 mL. Se añadió cloro(trimetil)silano (0.043 mL, 0.34 mmol) y la mezcla de reacción amarilla se volvió púrpura inmediatamente. La mezcla se agitó en un vial de microondas a 100 °C durante 30 minutos. El análisis por LCMS mostró una conversión tan solo parcial en el producto deseado. Se añadieron más cloro(trimetil)silano y yoduro de sodio, y la reacción se volvió a irradiar en el microondas a 100 °C durante 30 min. El análisis por LCMS mostró un aumento del producto deseado pero sugirió que el material de partida seguía siendo el componente mayoritario (~60%). La mezcla se vertió en agua, se basificó con hidróxido sódico 2 M y se extrajo con diclorometano. Los extractos orgánicos se hicieron pasar a través de un cartucho de separación de fases y se evaporaron para obtener el material de partida sin reaccionar. La fase acuosa básica se acidificó con ácido clorhídrico 2 M y se extrajo con diclorometano. Los extractos orgánicos se hicieron pasar a través de un segundo cartucho de separación de fases y se evaporaron para obtener el producto deseado, 5-[6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]-4-hidroxi-2-metilpiridazin-3-ona (21 mg, 0.062 mmol) como un sólido rosa.

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm d 1H 9.18, s 1H 8.35, dd 1H 7.98, s 1H 7.69, s 3H 3.90

#### **5-[6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona**

Se agitaron [6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]trimetilestannano (200 mg, 0.528 mmol), 5-chloro-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (105 mg, 0.60144 mmol), dicloruro de 1,4-bis(difenilfosfinobutano)paladio (33 mg), óxido de cobre (II) (45 mg, 0.566 mmol) y *N,N*-dimetilformamida (5 mL, 64.4 mmol) en un vial de microondas a 140 °C durante 30 minutos. El análisis por LCMS mostró una buena conversión en el producto deseado con además una cantidad minoritaria del subproducto "homoacoplado" y otras pequeñas impurezas diferentes. La mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de sílice muy pequeño. El filtrado se repartió entre éter y agua. Los extractos orgánicos se separaron, se lavaron, se secaron con sulfato de magnesio anhidro y se evaporaron. El producto crudo se disolvió en diclorometano y se purificó mediante cromatografía en columna, eluyendo con acetato de etilo/isoctano, para obtener 5-[6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (75 mg, 0.2117 mmol) como un sólido amarillo.

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm d 1H 9.20, s 1H 8.20, dd 1H 7.92, s 1H 7.61, s 3H 4.14, s 3H 3.88.

La 5-cloro-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona se prepara a partir de 4,5-dicloro-1*H*-piridazin-6-ona como se ha descrito en el ejemplo 2.

#### **[6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]trimetilestannano**

15 Se calentó una mezcla de 6-fluoro-3-yodo-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridina (400 mg, 1.17 mmol), hexametildiestanano (1.15 g, 3.40 mmol) y el catalizador dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) (100 mg, 0.141 mmol), en 1,4-dioxano desgasificado (6 mL, 70.3 mmol), a 110 °C durante 60 minutos con irradiación de microondas. El análisis por LCMS mostró una conversión excelente en el producto deseado. La mezcla de reacción se adsorbió sobre sílice y se purificó mediante cromatografía en columna, eluyendo con acetato de etilo/isoctano, para obtener [6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-il]trimetilestannano como un sólido de color naranja pálido (300 mg, 0.7918 mmol).

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm d 1H 9.10, s 1H 8.48, dd 1H 7.85, s 9H 0.47.

La 6-fluoro-3-yodo-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridina se puede preparar a partir de 6-fluoro-2-(trifluorometil)-1,8-naftiridin-3-amina mediante procedimientos descritos, p. ej., en *J. Org. Chem.* 1977, 42 (14), 2426–2431.

#### **Ejemplo 6**

#### **4-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-1,3-dimetil-4*H*-piridazin-5,6-diona**

La 4-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-1,3-dimetil-4*H*-piridazin-5,6-diona se prepara a partir de 4,5-dicloro-2,6-dimetilpiridazin-3-ona mediante una secuencia de reacciones análoga a la del Ejemplo 1.

#### **4,5-dicloro-2,6-dimetilpiridazin-3-ona**

30 En un vial de microondas de 20 mL, se introdujeron 6-bromo-4,5-dicloro-2-metilpiridazin-3-ona (1.00 g, 3.88 mmol), el aducto de dicloruro de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) y diclorometano (0.032 g, 0.039 mmol), carbonato de cesio (2.02 g, 6.20 mmol), trimetilboroxina (0.787 g, 6.20 mmol, 0.876 mL) y 1,4-dioxano (9 mL), y se calentó en el microondas a 100 °C durante 1 hora y a continuación durante 30 minutos más a 150 °C.

La mezcla de reacción se filtró a través de Celite, se añadió sílice y se redujo al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en sílice, eluyendo con 0-30% de acetato de etilo/hexano, para obtener un sólido blanco que contenía una proporción 9:1 del producto deseado, 4,5-dicloro-2,6-dimetilpiridazin-3-ona, junto con un subproducto, 5-cloro-2,4,6-trimetilpiridazin-3-ona (502 mg en total). Esta mezcla se empleó directamente en el siguiente paso para formar 5-cloro-4-metoxi-2,6-dimetilpiridazin-3-ona, ya que el subproducto no reacciona.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>):

4,5-dicloro-2,6-dimetilpiridazin-3-ona δ 3.79 (s, 3H), 2.44 (s, 3H)

40 5-cloro-2,4,6-trimetilpiridazin-3-ona δ 3.73 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)

#### **Ejemplo 7**

#### **2-ciclopropil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-hidroxipiridazin-3-ona**

Se calentó una solución de 2-ciclopropil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxipiridazin-3-ona (0.203 g, 0.5032 mmol) en morfolina (0.4384 g, 5.032 mmol, 0.440 mL) a 100 °C durante 1 hora.

45 La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se diluyó con diclorometano (5 mL) y ácido clorhídrico 2 M (5 mL). A continuación, la mezcla se agitó durante 30 minutos.

La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo con diclorometano (2 x 5 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron y se concentraron al vacío para obtener un sólido rosa.

El sólido crudo se lavó con acetonitrilo (3 porciones de 2 mL) y se separó por filtración para obtener 2-ciclopropil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-hidroxipiridazin-3-ona como un sólido blanco (0.0883 g).

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 1.05 - 1.12 (m, 2H) 1.22 - 1.29 (m, 2H) 2.23 (s, 3H) 3.21 (s, 3H) 3.39 (s a, 2H) 4.19 (dt, J=7.65, 3.69 Hz, 1H)

5 4.60 (t, J=10.07 Hz, 2H) 7.49 (d, J=8.19 Hz, 1H) 7.60 (s, 1H) 8.08 (d, J=8.19 Hz, 1H)

#### **2-ciclopropil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxipiridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de 5-cloro-2-ciclopropil-4-metoxipiridazin-3-ona (0.20 g, 1 mmol), 3-[2-metil-6-metilsulfonil-3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-4,5-dihidroisoxazol (0.438 g, 1.2 mmol), acetato de paladio (II) (0.018 g, 0.08 mmol), fosfato tripotásico (1.026 g, 2 mmol, 0.4 mL, 5 mol/L) y SPhos (0.0670 g, 0.16 mmol) en tolueno (3.46 g, 37.4 mmol, 4.0 mL) a 150 °C durante 30 minutos con irradiación de microondas.

La mezcla de reacción se filtró a través de Celite, eluyendo con acetato de etilo. El filtrado se concentró al vacío para obtener el producto crudo. El producto crudo se colocó sobre sílice en seco y se purificó mediante cromatografía para obtener 2-ciclopropil-5-[3-(4,5-dihidroisoxazol-3-il)-2-metil-4-metilsulfonilfenil]-4-metoxipiridazin-3-ona como un aceite incoloro (0.203 g, 0.503 mmol).

15 <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 1.03 - 1.11 (m, 2H) 1.19 (s a, 2H) 2.18 (s, 3H) 3.22 (s, 3H) 3.40 (s a, 2H) 4.14 (s, 4H) 4.60 (t, J=10.07 Hz, 3 H) 7.41 (d, J=8.19 Hz, 1H) 7.48 (s, 1H) 8.06 (d, J=8.19 Hz, 1H)

#### **3-[2-metil-6-metilsulfonil-3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-4,5-dihidroisoxazol**

Se calentó una mezcla de 3-(3-bromo-2-metil-6-metilsulfonilfenil)-4,5-dihidroisoxazol (A, 3.182 g, 10 mmol), bis(pinacolato)diboro (3.8476 g, 15 mmol), tris(dibencildenoacetona)dipaladio (0) (0.092 g, 0.1 mmol), S-Phos (0.168 g, 0.4 mmol) y acetato de potasio (1.487 g, 15 mmol) en 1,4-dioxano (15.51 g, 176 mmol, 15 mL) a 150 °C durante 30 min con irradiación de microondas. La mezcla cruda se filtró a través de un lecho de Celite eluyendo con acetato de etilo. El producto crudo se colocó sobre sílice en seco y se purificó mediante cromatografía para obtener 3-[2-metil-6-metilsulfonil-3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil]-4,5-dihidroisoxazol como un sólido de color amarillo pálido (2.06 g, 5.64 mmol).

25 <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 1.37 (s, 13H) 2.52 (s, 3H) 3.16 (s, 4H) 3.33 (s a, 2H) 4.57 (t, J=10.00 Hz, 2H) 7.94 (d, J=8.06 Hz, 1H) 7.99 (d, J=7.92 Hz, 1H)

El 3-(3-bromo-2-cloro-6-metilsulfonilfenil)-4,5-dihidroisoxazol se puede preparar tal como se describe, por ejemplo, en DE 19820722.

#### **5-cloro-2-ciclopropil-4-metoxipiridazin-3-ona**

30 A una solución agitada de 4,5-dicloro-2-ciclopropilpiridazin-3-ona (A, 0.599 g, 2.9214 mmol, 100% en masa) en 1,4-dioxano (100 mL, 100% en masa), se añadió metóxido de sodio (0.69443 g, 3.2135 mmol, 0.735 mL, 25% en masa) gota a gota y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró al vacío para obtener un aceite marrón crudo, a continuación se colocó sobre sílice en seco y se purificó mediante cromatografía para obtener 5-cloro-2-ciclopropil-4-metoxipiridazin-3-ona como un sólido blanco (0.498 g).

35 <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 0.96 - 1.14 (m, 4H) 3.95 - 4.07 (m, 1H) 4.28 (s, 3H) 7.64 (s, 1H)

#### **4,5-dicloro-2-ciclopropilpiridazin-3-ona**

Se calentó una mezcla de *N*-(*tert*-butoxicarbonilamino)-*N*-ciclopropilcarbamato de *tert*-butilo (0.68 g, 2.5 mmol) y ácido mucoclórico (0.43 g, 2.5 mmol) en ácido clorhídrico (4 mol/L) en agua (25 mmol, 6.3 mL) a refluo durante 6 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se extrajo con diclorometano (3 x 10 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron y se concentraron al vacío. El producto crudo se purificó mediante cromatografía para obtener 4,5-dichloro-2-ciclopropilpiridazin-3-ona como un sólido blanco (0.353 g).

40 <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 1.02 - 1.17 (m, 4H) 4.09 - 4.16 (m, 1H) 7.72 (s, 1H)

#### ***N*-(*tert*-butoxicarbonilamino)-*N*-ciclopropilcarbamato de *tert*-butilo**

45 A una suspensión agitada de magnesio (1.34 g, 55 mmol) y yodo catalítico en tetrahidrofurano (5 mL), se añadieron 5 mL de una solución de 45 mL de bromuro de ciclopropilo (4.0 mL) en tetrahidrofurano (50 mL). La mezcla se calentó hasta que se inició la formación del reactivo de Grignard y a continuación se añadió el resto de la solución de bromuro de ciclopropilo gota a gota en 30 min con calentamiento (70 °C). La solución del reactivo de Grignard se calentó a refluo durante 30 minutos más y después se enfrió hasta 0 °C.

50 Se añadió la solución de bromuro de ciclopilmagnesio gota a gota a una solución agitada de azodicarboxilato de di-*tert*-butilo en THF (50 mL) a -78 °C a través de una cánula. La solución resultante se agitó a -78 °C durante 30 min

y después se desactivó con ácido acético. La mezcla se dejó calentar hasta temperatura ambiente, a continuación se añadió agua (150 mL) y la mezcla se extrajo tres veces con éter dietílico. Los extractos orgánicos combinados se secaron, se filtraron y se concentraron al vacío. El producto crudo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice, eluyendo con acetato de etilo/hexano, para obtener el producto como sólido blanco (6.68 g).

- 5      $^1\text{H}$  RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 0.7 (4H, s a), 1.5 (18H, s), 2.9-3.0 (1H, m a), 6.1 y 6.4 (1H, s a)

#### Ejemplo 8

##### **acetato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il]**

A una suspensión de 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (0.1 g, 0.29 mmol) en diclorometano anhídrico (1 mL) a temperatura ambiente, se añadieron piridina (0.03 g, 0.03 mL, 0.37 mmol) y 4-(dimetilamino)piridina (0.35 mg, 0.0029 mmol). La mezcla se agitó durante 2 min y se añadió cloruro de acetilo (0.027 g, 0.025 mL, 0.345 mmol) gota a gota. La suspensión resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas, a continuación se diluyó con diclorometano y se lavó sucesivamente con ácido clorhídrico 2 M e hidrogenocarbonato sódico acuoso saturado. La fase orgánica se separó, se hizo pasar a través de un cartucho de separación de fases y el filtrado se evaporó.

15   El residuo crudo se purificó mediante cromatografía flash (10-55% de acetato de etilo en hexanos, 13 min, a continuación 3 min al 55%, 4 g de sílice GOLD) para obtener el acetato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il] (0.095 g, 0.2434 mmol, 84.78% de rendimiento) como un sólido blanco.

La 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona se preparó como se ha descrito en el ejemplo 2.

20   Ejemplo 9

##### **[2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il]carbonato de metilo**

A una suspensión de 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (0.1 g, 0.29 mmol) en tolueno anhídrico (1.99 g, 2.3 mL, 21.5 mmol) a temperatura ambiente, se añadió trietilamina (0.032 g, 0.044 mL, 0.31 mmol) y a continuación cloroformiato de metilo (0.03 g, 0.024 mL, 0.31 mmol). La mezcla resultante se agitó durante toda la noche.

Se añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se hicieron pasar a través de un cartucho de separación de fases y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash (0-50% de acetato de etilo en hexanos, 12 min, a continuación 3 min al 50%, 4 g de sílice) para obtener [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il]carbonato de metilo (0.113 g, 0.2781 mmol, 96.87% de rendimiento) como un sólido blanco.

La 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona se preparó como se ha descrito en el ejemplo 2.

#### Ejemplo 10

##### **etilsulfaniloformiato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il]**

35   A una suspensión de 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (0.1 g, 0.29 mmol) en tetrahidrofurano anhídrico (4.6 g, 5.17 mL, 63.7 mmol) a temperatura ambiente, se añadió trietilamina (0.059 g, 0.08 mL, 0.57 mmol) y a continuación clorotioformiato de etilo (0.047 g, 0.039 mL, 0.36 mmol). La suspensión resultante se agitó a temperatura ambiente durante 90 minutos, a continuación se diluyó con acetato de etilo y se lavó con salmuera. La fase orgánica se separó y se hizo pasar a través de un cartucho de separación de fases. El filtrado se evaporó y el residuo se purificó mediante cromatografía flash (0-40% de acetato de etilo en hexanos, 13 min, a continuación 3 min al 40%, 4 g de sílice) para obtener etilsulfanilformiato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il] (0.126 g, 0.289 mmol, 100% de rendimiento) como un sólido blanco.

La 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona se preparó como se ha descrito en el ejemplo 2.

45   Ejemplo 11

##### **propano-1-sulfonato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-il]**

A una suspensión de 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (0.1 g, 0.29 mmol) en diclorometano (1.14 g, 0.86 mL, 13.4 mmol) a temperatura ambiente, se añadió una solución de carbonato de potasio (0.06 g, 0.43 mmol) en agua (0.86 g, 0.86 mL, 47.81 mmol) y después una solución de cloruro de 1-propanosulfonilo (0.063 g, 0.05 mL, 0.43 mmol) en diclorometano (0.2 mL). A continuación, se añadió cloruro de

benciltrimetilamonio (0.0027 g, 0.0025 mL, 0.014 mmol) y la mezcla bifásica se agitó enérgicamente a temperatura ambiente durante toda la noche.

La mezcla de reacción se diluyó con agua/diclorometano y se separó la fase orgánica. La fase acuosa se extrajo con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con ácido clorhídrico 2 M acuoso y salmuera, y a continuación se hicieron pasar a través de un cartucho de separación de fases. El filtrado se evaporó y el residuo se purificó mediante cromatografía flash (0-50% de acetato de etilo en hexanos, 13 min, 4 g de sílice) para obtener propano-1-sulfonato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-ilo] (0.1 g, 0.22 mmol, 76,7% de rendimiento) como un sólido blanco.

La 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona se preparó como se ha descrito en el ejemplo 2.

### Ejemplo 12

#### propano-1-sulfonato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-ilo]

A una suspensión de 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (0.1 g, 0.2871 mmol) y cloruro de *para*-toluenosulfonilo (0.061 g, 0.32 mmol) en acetonitrilo anhídro (4.51 g, 5.7 mL, 110 mmol) a temperatura ambiente, se añadió carbonato de potasio (0.071 g, 0.52 mmol). La suspensión resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche.

La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se hicieron pasar a través de un cartucho de separación de fases y el filtrado se evaporó. El sólido resultante se disolvió en una cantidad mínima de diclorometano y se añadió hexano gota a gota con agitación rápida hasta que se observó precipitación. El precipitado se separó por filtración y se secó con succión para obtener 4-metilbencenosulfonato de [2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-3-oxopiridazin-4-ilo] (0.10 g, 0.2 mmol, 70.0% de rendimiento) como un sólido blanco.

La 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona se preparó como se ha descrito en el ejemplo 2.

### Ejemplo 13

#### 4-hidroxi-2-metil-5-[4-morfolino-2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]piridazin-3-ona

Se disolvió 5-[4-cloro-2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (240.0 mg, 0.22 mmol) en morfolina (2.5 mL, 28.6 mmol). La reacción se agitó a 100 °C durante 45 minutos. La mezcla de reacción se añadió cuidadosamente a 30.0 mL de agua y se agitó durante 10 minutos. La fase acuosa se extrajo con diclorometano (2 x 20 mL). A continuación, la fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico acuoso (2.0 M) y después se lavó con diclorometano, que se separó utilizando un cartucho de separación de fases. El disolvente se concentró al vacío y el crudo se lavó con 5.0 mL de acetonitrilo, a continuación se sonicó y el sólido resultante (40.0 mg) se separó por filtración. El análisis por TLC mostró una pequeña cantidad de impureza, de modo que se volvió a lavar una vez más con 5.0 mL de metanol y el precipitado resultante se aisló para proporcionar 4-hidroxi-2-metil-5-[4-morfolino-2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]piridazin-3-ona (25.0 mg, 0.07 mmol, 31.2% de rendimiento) como un sólido blanco.

#### 5-[4-cloro-2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona

Se disolvió 4-metoxi-2-metil-5-[6-oxo-2-(trifluorometil)-1*H*-pirimidin-5-il]piridazin-3-ona (515.0 mg, 1.7 mmol) en oxicloruro de fósforo (V) (5.0 mL, 53 mmol). La mezcla se agitó a 85 °C durante 90 minutos. A continuación, la reacción se detuvo y se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se concentró al vacío. El producto crudo se vertió sobre agua enfriada con hielo y la fase acuosa se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas se combinaron, se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío, a continuación se purificaron utilizando un cartucho de sílice de 24 g eluyendo con isohexano:acetato de etilo (100:0 → 60:40 en 12 minutos y después manteniendo el gradiente durante 6 minutos). Las fracciones que contenían el producto se concentraron al vacío para obtener 5-[4-cloro-2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (240.0 mg, 0.22 mmol, 13.18% de rendimiento) como un aceite translúcido.

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm = 3.86 (3H, s) 4.29 (3H, s) 7.63 (1H, s) 8.76 (1H, s)

#### 4-metoxi-2-metil-5-[6-oxo-2-(trifluorometil)-1*H*-pirimidin-5-il]piridazin-3-ona

Se suspendió 2,2,2-trifluoroacetamidina (450 mg, 11.8 mmol) en metanol (3.0 mL). A continuación, se añadió (*E*)-3-metoxi-2-(5-metoxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)prop-2-enoato de metilo (1.00 g, 3.93 mmol) y después metóxido de sodio (1.35 mL, 5.90 mmol). La mezcla se calentó hasta 65 °C durante 2 horas.

Se añadieron más 2,2,2-trifluoroacetamidina (450.0 mg, 11.8 mmol) y metóxido de sodio (1.35 mL, 5.90 mmol), y la mezcla se agitó durante 2 horas más. La reacción se detuvo y se dejó enfriar hasta temperatura ambiente. Se añadió ácido clorhídrico acuoso 2 M y la mezcla se concentró al vacío.

El producto crudo se purificó mediante cromatografía en sílice, eluyendo con isohexano:acetato de etilo y después con diclorometano:metanol. Las fracciones que contenían el producto se combinaron y se concentraron al vacío para obtener 4-metoxi-2-metil-5-[6-oxo-2-(trifluorometil)-1*H*-pirimidin-5-il]piridazin-3-ona (520.0 mg, 1.72 mmol, 43.7% de rendimiento) como un sólido de color amarillo pálido.

5   <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, *d*3-metanol) δ ppm = 3.80 (3H, s) 4.01 (3H, s) 7.94 (1H, s) 8.13 (1H, s)

**(E)-3-metoxi-2-(5-metoxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)prop-2-enoato de metilo**

Se disolvieron 4-metoxi-2-metil-5-tributilestannilpiridazin-3-ona (2.9 g, 6.8 mmol) y (Z)-2-yodo-3-metoxiprop-2-enoato de metilo (1.5 g, 6.2 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (15.0 mL, 193 mmol). Se añadió fluoruro de cesio (1.9 g, 2.0 eq., 12 mmol) y la mezcla se desgasificó con nitrógeno. A continuación, se añadieron yoduro de cobre (0.12 g, 0.62 mmol) y tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (0.36 g, 0.31 mmol), y la mezcla se desgasificó una vez más con nitrógeno antes de introducirla en un bloque calefactor precalentado a 55 °C durante 2 horas.

10   Se añadieron agua (50 mL) y diclorometano (50 mL), y la reacción se agitó enérgicamente. Se añadieron 50.0 mL de hidrogenocarbonato de sodio acuoso saturado y la mezcla se agitó de nuevo. La fase de diclorometano se separó y se concentró al vacío. El producto crudo se colocó sobre un cartucho de sílice de 120 g en seco y se eluyó con diclorometano:acetato de etilo (100:0 → 40:60 en 20 minutos y después manteniendo el gradiente durante 10 minutos más). Las fracciones que contenían el producto se combinaron y se concentraron al vacío para obtener 1.12 g de un aceite marrón que solidificó al dejarlo en reposo.

15   Se añadieron agua (50 mL) y diclorometano (50 mL), y la reacción se agitó enérgicamente. Se añadieron 50.0 mL de hidrogenocarbonato de sodio acuoso saturado y la mezcla se agitó de nuevo. La fase de diclorometano se separó y se concentró al vacío. El producto crudo se colocó sobre un cartucho de sílice de 120 g en seco y se eluyó con diclorometano:acetato de etilo (100:0 → 40:60 en 20 minutos y después manteniendo el gradiente durante 10 minutos más). Las fracciones que contenían el producto se combinaron y se concentraron al vacío para obtener 1.12 g de un aceite marrón que solidificó al dejarlo en reposo.

20   El producto crudo se purificó adicionalmente mediante cromatografía en columna de sílice, eluyendo con isohexano:acetato de etilo (60:40 → 30:70 en 8 minutos, posteriormente manteniendo el gradiente durante 5 minutos y después llegando a un 100% de acetato de etilo). Las fracciones que contenían el producto se combinaron y se concentraron al vacío para obtener el producto como un sólido de color amarillo pálido (882.0 mg, 56% de rendimiento).

25   <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo, (12wq161h2)) δ ppm = 3.74 (3H, s) 3.77 (3H, s) 3.90 (3H, s) 4.11 (3H, s) 7.52 (1H, s) 7.56 (1H, s)

**4-metoxi-2-metil-5-tributilestannilpiridazin-3-ona**

30   A una solución agitada de 5-bromo-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (5.00 g, 22.8 mmol) en tetrahidrofuran (40.6 g, 560 mmol, 45.7 mL) a -40 °C, se añadió bromuro de 2-mesilmagnesio (1.0 mol) en tetrahidrofuran (46 g, 45.7 mmol, 46 mL, 1.0 mol/L) gota a gota mediante un embudo de adición (manteniendo la temperatura interna por debajo de -30 °C en todo momento) y la mezcla se agitó a -40 °C durante 30 minutos. A continuación, se añadió cloruro de tri-*n*-butilestanio (23.2 g, 68.5 mmol, 19.3 mL) gota a gota como una solución en tetrahidrofuran (20 mL) y la mezcla se dejó calentar hasta 0 °C durante ~1 h.

35   A continuación, la mezcla de reacción se desactivó con una solución acuosa saturada de cloruro de amonio (100 mL) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 100 mL). Los extractos orgánicos combinados se secaron, se filtraron y se concentraron al vacío para obtener el producto crudo.

40   45   El producto crudo se colocó sobre sílice en seco y se purificó mediante cromatografía para obtener 4-metoxi-2-metil-5-tributilestannilpiridazin-3-ona como un aceite rojizo (5.21 g, 12.1 mmol, 53.2% de rendimiento).

45   <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 7.56 (1H, s) 4.14 (3H, s) 3.78 (3H, s) 1.44 - 1.62 (6H, m) 1.27 - 1.38 (6H, m) 1.00 - 1.21 (6H, m) 0.89 (9H, t, J=7.3 Hz)

50   40   La 5-bromo-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona se puede preparar mediante una ruta análoga a la del esquema de reacción 3.

**Ejemplo 14**

**3-ciclohexil-2-(3-fluorofenil)-5-(5-hidroxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)pirimidin-4-ona**

55   Se disolvió 3-ciclohexil-2-(3-fluorofenil)-5-(5-metoxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)pirimidin-4-ona (51.0 mg, 0.118 mmol) en morfolina (2.0 mL, 23 mmol). La reacción se agitó a 95 °C durante 2 horas. El análisis por LC indicó que no se había producido reacción alguna, de modo que se incrementó la temperatura hasta 105 °C y se agitó la reacción durante 2 horas más. En esta ocasión, la reacción se había completado, por lo tanto, se dejó enfriar la mezcla hasta temperatura ambiente. A continuación, se añadió ácido clorhídrico acuoso cuidadosamente a la mezcla de reacción hasta que esta se volvió ácida. La fase acuosa se lavó con diclorometano, y las fases orgánicas se combinaron y se hicieron pasar a través de un cartucho de separación de fases. El disolvente se concentró al vacío y el crudo se lavó con 3.0 mL de acetonitrilo, sonicando la solución durante aproximadamente 1 minuto.

60   55   El sólido se separó por filtración para obtener el producto como un sólido de color rosa pálido (25.0 mg, 53.4% de rendimiento).

**3-ciclohexil-2-(3-fluorofenil)-5-(5-metoxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)pirimidin-4-ona**

Se suspendió clorhidrato de 3-fluorobencenocarboximidato de etilo (135.0 mg, 0.6629 mmol) en metanol (3.0 mL). A continuación, se añadió ciclohexanamina (0.066 g, 0.6629 mmol) y la mezcla se agitó durante 2 horas a durante 18 horas. La reacción se calentó gradualmente hasta reflujo y se agitó durante 2 horas más. Se añadió más 5 ciclohexilamina (0.066 g, 0.6629 mmol) y la mezcla se agitó a reflujo durante 2 horas. La reacción se detuvo y se concentró al vacío para obtener un aceite.

El producto crudo se volvió a disolver en metanol (3.0 mL), a continuación se añadió metóxido de sodio (0.12 g, 0.57 mmol) y la mezcla se agitó durante 5 minutos antes de que se añadiera posteriormente (*E*-3-metoxi-2-(5-metoxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)prop-2-enoato de metilo (145.0 mg, 0.57 mmol) y la mezcla se agitó a 65 °C durante 3 horas.

- 10 La reacción se enfrió y el disolvente se concentró al vacío, a continuación se añadió éter dietílico al producto crudo. La fase orgánica se lavó con hidrogenocarbonato de sodio saturado y la fase acuosa se lavó con éter dietílico. Las fases orgánicas se combinaron, se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío, a continuación se purificaron mediante cromatografía en sílice eluyendo con isohexano:acetato de etilo para obtener el producto (95 mg) como un material viscoso de color amarillo pálido. Este se purificó adicionalmente mediante HPLC preparativa y se concentró al vacío para obtener el producto como un aceite translúcido (51.0 mg, 21.8% de rendimiento).
- 15

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm = 0.93 - 1.11 (2H, m) 1.14 - 1.30 (1H, m) 1.57 (1H, d, *J*=12.9 Hz) 1.72 (2H, d, *J*=11.3 Hz) 1.81 (2H, d, *J*=13.4 Hz) 2.63 - 2.79 (2H, m) 3.81 (3H, s) 3.87 - 3.97 (1H, m) 4.21 (3H, s) 7.21 - 7.26 (1H, m) 7.27 - 7.30 (1H, m) 7.52 (1H, td, *J*=7.9, 5.6 Hz) 7.88 (1H, s) 8.07 (1H, s)

- 20 El (*E*-3-metoxi-2-(5-metoxi-1-metil-6-oxopiridazin-4-il)prop-2-enoato de metilo se preparó como se ha descrito anteriormente en el ejemplo 13.

**Ejemplo 15****4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-propoxipiridazin-3-ona**

- 25 Se puede preparar 4-hidroxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-propoxipiridazin-3-ona a partir de 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-propoxipiridazin-3-ona mediante un método análogo al que se ha descrito, por ejemplo, en el paso 1 del ejemplo 1.

**4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-propoxipiridazin-3-ona**

- 30 A una mezcla de 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-1*H*-piridazin-3,6-diona (0.09 g, 0.24 mmol) y carbonato de potasio (0.17 g, 1.19 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (1.4 g, 1.5 mL, 19 mmol) a temperatura ambiente, se añadió 1-yodopropano (0.045 g, 0.026 mL, 0.26 mmol). La mezcla amarilla resultante se agitó durante 3 horas, y después se vertió sobre agua y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se lavaron con salmuera, se filtraron a través de un cartucho de separación de fases y el filtrado se evaporó. El residuo crudo se purificó mediante cromatografía flash (30-80% de acetato de etilo en hexanos, 13 min, 4 g de sílice) para obtener 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-propoxipiridazin-3-ona como un aceite de color amarillo pálido (0.099 g, 0.236 mmol, 99.0% de rendimiento).
- 35

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8.41 (1H, d a), 7.94 (1H, dd a), 7.39 (1H, d), 4.10 (3H, s), 4.04-4.00 (2H, m), 3.72 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.57-1.52 (2H, m), 0.76 (3H, t)

**4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-1*H*-piridazin-3,6-diona**

- 40 A una solución de nitrito sódico (0.11 g, 1.6 mmol) en ácido sulfúrico concentrado (3 mL) a 0 °C, se añadió gota a gota una suspensión de 6-amino-4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (0.51 g, 1.352 mmol) en ácido acético glacial (6.294 g, 6 mL, 105 mmol). La mezcla resultante se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 40 min. A continuación, se enfrió hasta 0 °C y se añadió agua gota a gota (9 mL). La suspensión resultante se agitó durante 60 minutos a temperatura ambiente, después se diluyó con agua (10 mL) y el precipitado se separó por filtración, se lavó con agua y se secó en un horno de vacío a 55 °C durante toda la noche para obtener 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-1*H*-piridazin-3,6-diona como un sólido blanquecino (0.35 g, 0.92 mmol, 68.25% de rendimiento).
- 45

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, MeOD): δ 8.38 (1H, d a), 8.08 (1H, dd a), 7.62 (1H, d), 3.95 (3H, s), 3.67 (3H, s), 3.14 (3H, s)

**6-amino-4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona**

- 50 A una solución de 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-nitropiridazin-3-ona (0.8 g, 1.964 mmol) en etanol (19.7 g, 25 mL, 411 mmol) a 80 °C, se añadieron formiato de amonio (2.502 g, 39.28 mmol) e hidróxido de paladio sobre carbón (0.5517 g, 3.928 mmol). La mezcla negra resultante se mantuvo a 80 °C durante 1 h (NB: se observó sublimación del formiato de amonio) y posteriormente se filtró en caliente a través de un lecho corto de Celite, lavando con etanol, acetato de etilo y metanol calientes. El filtrado se evaporó y el residuo resultante se agitó

rápidamente con agua durante 10 min, y después se separó por filtración y se secó en un horno de vacío a 55 °C durante 2 días (fin de semana).

Rendimiento: 510 mg (69%, sólido amarillo)

<sup>1</sup>H RMN (400 MHz, MeOD): δ 8.42 (1H, s a), 8.14 (1H, d a), 7.65 (1H, d), 3.94 (3H, s), 3.66 (3H, s), 3.16 (3H, s)

5 **4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-nitropiridazin-3-ona**

A una solución de 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]piridazin-3-ona (1.81 g, 5.00 mmol) en ácido sulfúrico (14.7 g, 8 mL, 138 mmol) a 0 °C, se añadió ácido nítrico gota a gota (1.26 g, 0.891 mL, 20.0 mmol). La solución resultante se agitó a 0 °C durante 5 min, a continuación se dejó calentar hasta temperatura ambiente durante 15 min y después se calentó hasta 50 °C durante 2.5 horas más. Se añadió más ácido nítrico (1.26 g, 0.891 mL, 20.0 mmol) y se continuó calentando durante 2 h más. El análisis por LC-MS mostró que todavía había material de partida presente. Se añadió más ácido nítrico (1.26 g, 0.891 mL, 20.0 mmol) y se continuó calentando durante 1 h más. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y después se vertió cuidadosamente sobre agua enfriada con hielo con agitación rápida. El precipitado de color amarillo pálido resultante se filtró, se lavó con agua enfriada con hielo y después se secó en un horno de vacío durante toda la noche a 55 °C.

15 Se observó que el producto crudo contenía una pequeña cantidad de contaminante ácido. El sólido naranja se disolvió en diclorometano, y la fase orgánica se lavó con agua (con adición de unas gotas de hidróxido sódico acuoso - pH 14) y a continuación se hizo pasar a través de un cartucho de separación de fases. El filtrado se evaporó a presión reducida para obtener 4-metoxi-2-metil-5-[2-metilsulfonil-4-(trifluorometil)fenil]-6-nitropiridazin-3-ona (0.8 g, 1.96 mmol, 39.3% de rendimiento) como un sólido de color rosa pálido.

20 <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ 8.38 (1H, s a), 7.98 (1H, dd), 7.41 (1H, d), 4.20 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.00 (3H, s)

**Ejemplo 16**

**4-hidroxi-2-metil-5-[1-metil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]piridazin-3-ona**

**2-metoxi-6-(trifluorometil)piridina**

25 A una solución de 6-(trifluorometil)piridin-2-ol (10.0 g, 10.0 g, 61.3 mmol) en diclorometano (3 mL/mmol, 184 mL), se añadieron carbonato de plata (22.8 g, 82.8 mmol, 3.75 mL) y yodometano (87.0 g, 613 mmol, 38.2 mL), y se agitó en la oscuridad durante 24 horas. A continuación, la mezcla de reacción se filtró a través de Celite y se lavó con diclorometano. El filtrado se concentró a 30 °C a 250 mbar, se añadió sílice y el residuo se purificó mediante cromatografía eluyendo con 0-10% de acetato de etilo/hexano.

30 Las fracciones que contenían el producto se combinaron para obtener 2-metoxi-6-(trifluorometil)piridina (6.49 g, 36.6 mmol, 59.8% de rendimiento).

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>): δ 7.69 (t, J=8.1 Hz, 1H) 7.25 (d, J=7.5 Hz, 1H) 6.91 (d, J=8.6 Hz, 1H) 3.98 (s, 3H)

**ácido [2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]borónico**

35 A una solución de 2-metoxi-6-(trifluorometil)piridina (1.0 g, 5.6 mmol) en éter dietílico (1.2 mL/mmol, 6.8 mL) a -78 °C en atmósfera de nitrógeno, se añadió nBuLi (2.5 mol/L) en hexanos (4.7 g, 17 mmol, 6.8 mL) en 5 min y se dejó calentar hasta temperatura ambiente durante 30 minutos. Se enfrió el éster triisopropílico del ácido bórico (2.1 g, 11 mmol, 2.6 mL) en éter dietílico (1.2 mL/mmol, 6.8 mL) hasta -78 °C, y se añadió [2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]litio a esta solución en 15 minutos y después se calentó hasta temperatura ambiente durante 30 min.

40 Se añadió cloruro de hidrógeno (al 25% acuoso) (10 mL, 10 mmol) y la mezcla de reacción se diluyó con agua, se extrajo dos veces con diclorometano, se hizo pasar a través de un separador de fases y se redujo al vacío para obtener un aceite amarillo que solidificó durante la noche.

La mezcla de reacción se adsorbió sobre sílice y se purificó mediante cromatografía en sílice, eluyendo con 0-25% de acetato de etilo/hexano. Las fracciones que contenían el producto se combinaron para obtener el ácido [2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]borónico como un sólido amarillo (707 mg, 3.20 mmol, 59% de rendimiento).

<sup>1</sup>H RMN (11vu941h1, CDCl<sub>3</sub>): δ 8.29 (d, J=7.5 Hz, 1H) 7.34 (d, J=7.5 Hz, 1H) 5.92 (s, 2H) 4.10 (s, 3H)

45 **4-metoxi-5-[2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]-2-metilpiridazin-3-ona**

50 A una mezcla de 5-cloro-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (400 mg, 2.29 mmol), preparada como se ha descrito en el ejemplo 2, ácido [2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]borónico (0.71 g, 3.20 mmol), sPhos (0.19 g, 0.46 mmol), tris(dibencildinoacetonil)bispaladio (0.11 g, 0.11 mmol), fosfato de potasio (1.00 g, 4.58 mmol, 0.39 mL), y la mezcla de reacción se diluyó con *tert*-butanol (1.6 mL/mmol, 2.88 g, 38.5 mmol, 3.67 mL). La mezcla de reacción se calentó hasta 80 °C durante 50 min. La mezcla de reacción se diluyó con salmuera y se extrajo con acetato de etilo (3x). La

solución naranja se hizo pasar a través de un separador de fases, se añadió sílice y se redujo al vacío. A continuación, se purificó mediante cromatografía eluyendo con 0-50% de acetato de etilo/hexano. Las fracciones que contenían el producto se combinaron para obtener 4-metoxi-5-[2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]-2-metilpiridazin-3-ona (545 mg, 0.54 g, 1.73 mmol, 75.46% de rendimiento).

5 **5-[2-hidroxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona**

En 4 viales de microondas, se añadió en cada uno 1 g de 4-metoxi-5-[2-metoxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]-2-metilpiridazin-3-ona (4.0 g, 13 mmol) y a continuación 15 mL de bromuro de hidrógeno (solución acuosa al 48%) (60 mL) y se calentó secuencialmente a 40 °C en el microondas durante 45 minutos. Las mezclas de reacción se combinaron y se añadió acetato de etilo seguido de salmuera, a continuación se extrajo con acetato de etilo (3 x 10 mL) y los extractos orgánicos combinados se hicieron pasar a través de un separador de fases y se redujeron al vacío para obtener un sólido blanco. A continuación, se purificó mediante cromatografía, eluyendo con 0-50% de acetato de etilo/hexano.

Las fracciones que contenían el producto se combinaron para obtener 5-[2-hidroxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona como un sólido rosa (1.6 g, 5.3 mmol, 42% de rendimiento).

15  $^1H$  RMN (11vz747h1,  $CDCl_3$ ):  $\delta$  7.83 (s, 1H) 7.75 (d,  $J=7.6$  Hz, 1H) 6.96 (d,  $J=7.4$  Hz, 1H) 4.18 (s, 3H) 3.82 (s, 3H)

**4-metoxi-2-metil-5-[1-metil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]piridazin-3-ona**

A una solución de 5-[2-hidroxi-6-(trifluorometil)-3-piridil]-4-metoxi-2-metilpiridazin-3-ona (150 mg, 0.49797 mmol) en 1,2-dimetoxietano (12 mL/mmol, 5.98 mL), se añadió ácido carbónico dipotásico (0.21 g, 1.49 mmol) seguido de yodometano (0.64 g, 4.48 mmol, 0.28 mL) y la mezcla de reacción se calentó a reflujo (75 °C) durante 30 min. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y los sólidos inorgánicos se filtraron y se lavaron con acetato de etilo y el disolvente; se añadió sílice y la mezcla de reacción se concentró al vacío y se purificó mediante cromatografía, eluyendo con 0-35-50% de acetato de etilo/hexano.

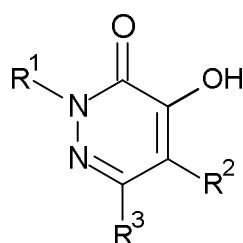
Las fracciones que contenían el producto se combinaron para obtener 4-metoxi-2-metil-5-[1-metil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]piridazin-3-ona como un sólido blanco (88 mg, 0.28 mmol, 56.06% de rendimiento).

25  $^1H$  RMN (12wk938h1,  $CDCl_3$ ):  $\delta$  7.82 (s, 1H) 7.55 (d,  $J=7.5$  Hz, 1H) 6.78 (d,  $J=7.0$  Hz, 1H) 4.16 (s, 3H) 3.80 (s, 3H) 3.70 (d,  $J=1.1$  Hz, 3H)

**4-hidroxi-2-metil-5-[1-metil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]piridazin-3-ona**

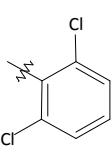
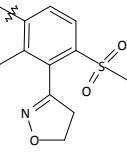
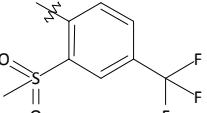
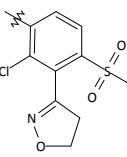
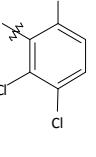
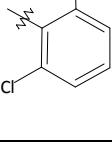
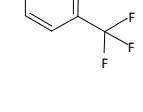
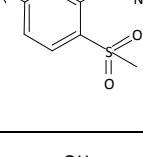
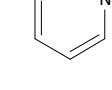
Se calentó una solución de 4-metoxi-2-metil-5-[1-metil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]piridazin-3-ona (88 mg, 0.2792 mmol) en morfolina (1 mL, 11.4 mmol) hasta 100 °C durante 1.5 h. La mezcla de reacción se redujo al vacío, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con HCl 1 M 3 veces, se redujo al vacío y se lavó con TBME para obtener 4-hidroxi-2-metil-5-[1-metil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]piridazin-3-ona como un sólido blanco (48 mg, 0.16 mmol, 57.08% de rendimiento).

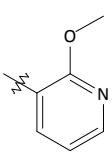
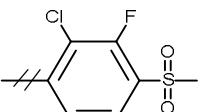
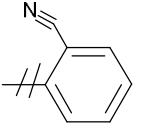
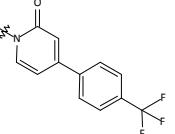
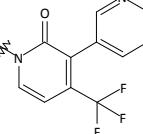
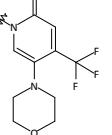
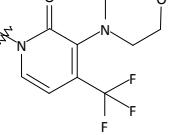
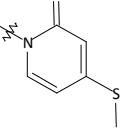
**TABLA C1** – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

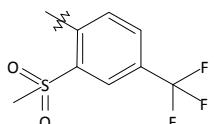
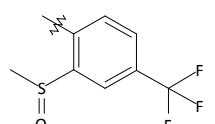
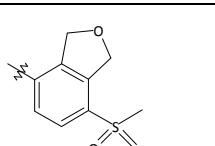
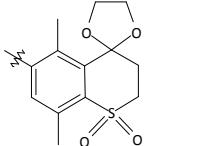
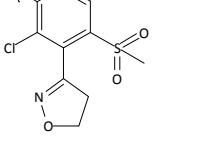
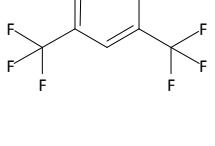
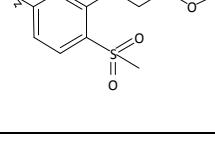
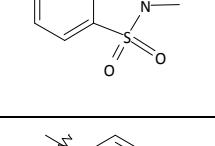


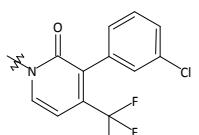
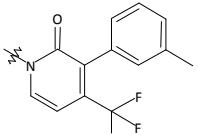
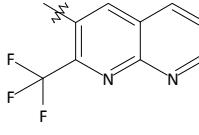
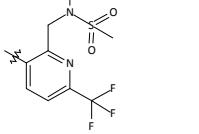
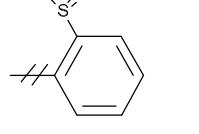
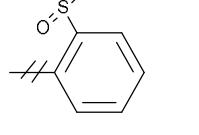
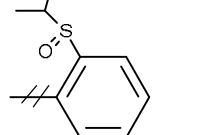
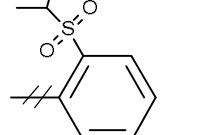
Cmp.	R¹	R²	R³	RMN
1.001	-CH <sub>2</sub> OMe		H	2.24 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.31-3.52 (2H, m), 3.55 (3H, s), 4.61 (2H, t, $J=10.0$ ), 5.54 (2H, s), 7.52 (1H, d, $J=8.2$ ), 7.70 (1H, s), 8.10 (1H, d, $J=8.2$ )

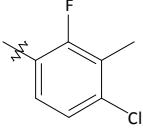
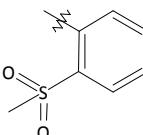
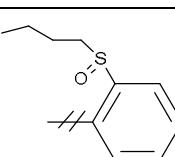
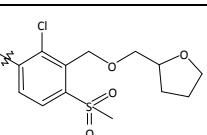
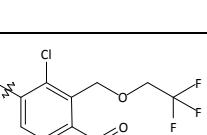
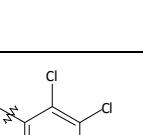
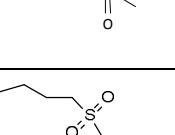
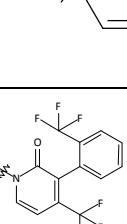
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.002	p-metoxibencil-		H	2.21 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.38 (s a, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.60 (t, J=10.00 Hz, 2H), 5.33 (s, 2H), 6.87 - 6.92 (m, 2H), 7.43 - 7.49 (m, 3H), 7.64 (s, 1H), 8.06 (d, J=8.19 Hz, 1H)
1.003	sec-butilo		H	
1.004			H	1.51-1.66 (3H, m), 1.71-1.88 (3H, m), 2.23 (3H, s), 3.21 (3H, s), 3.75-3.86 (2H, s a), 4.20 (1H, dd, J=11.6, 4.0), 4.60 (2H, t, J=9.9), 6.09 (1H, dd, J=10.7, 2.2), 7.49 (1H, d, J=8.1), 7.74 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.1)
1.005	CHF <sub>2</sub>		H	2.21 (3H, s), 3.20 (3H, s), 3.40 (2H, s a), 4.61 (2H, t, J=10.0), 6.98 (1H, t, J=60), 7.49 (1H, d, J=8.1), 8.08 (1H, s), 8.21 (1H, s, J=8.1)
1.006	CHF <sub>2</sub>		H	6.96 (1H, t, J=60), 7.60 (1H, d, J=8.1), 7.92 (1H, d, J=8.1), 8.07 (1H, s), 8.19 (1H, s)
1.007	Ciclopentilo		H	8.09 (1H, d), 7.69 (1H, s), 7.51 (1H, d), 5.46 - 5.39 (1H, m), 4.60 (2H, t), 3.41 (2H, s a), 3.21 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.18 - 2.09 (2H, m), 2.04-1.88 (4H, m), 1.78-1.69 (2H, m)
1.008	Ciclopropilo		H	1.00-1.15 (2H, m), 1.20-1.32 (2H, m), 2.23 (3H, s), 3.21 (3H, s), 3.38 (2H, s a), 4.18 (1H, dt, J=7.7, 3.7), 4.60 (2H, t, J=10.0), 7.49 (1H, d, J=8.2), 7.60 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.1)
1.009	Et		H	1.47 (3H, t, J=7.2), 3.27 (3H, s), 3.47 (2H, t, J=10.1), 4.30 (2H, c, J=7.2), 4.63 (2H, t, J=10.1), 7.68 (1H, d, J=8.2), 7.74 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.2)
1.010	Et		H	7.71 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.30 (1H, d), 4.30 (2H, c), 1.46 (3H, t)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.011	Et		H	7.63 (1H, s), 7.43 (1H, d), 7.34-7.30 (1H, m), 4.30 (2H, d a), 1.47 (3H, t a)
1.012	i-Pr		H	1.45 (6H, d, J=6.4), 2.24 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.39 (2H, s a), 4.61 (2H, t, J=10.2), 5.22-5.38 (1H, m), 7.52 (1H, d, J=8.1), 7.70 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.1)
1.013	i-Pr		H	8.47 (1H, d), 7.99 (1H, dd), 7.75 (1H, s), 7.55 (1H, d), 5.27 (1H, septuplicate), 3.04 (3H, s), 1.46 (6H, d)
1.014	i-Pr		H	1.45 (6H, d, J=7.0), 3.27 (3H, s), 3.47 (2H, t, J=10.3), 4.63 (2H, t, J=10.2), 5.30 (1H, m), 7.69 (1H, d, J=8.1), 7.78 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.1)
1.015	i-Pr		H	7.75 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.31 (1H, d), 5.28 (1H, septuplicate), 1.44 (6H, d)
1.016	i-Pr		H	7.67 (1H, s), 7.45-7.43 (2H, 2 s ap), 7.32 (1H, dd), 5.29 (1H, septuplicate), 1.45 (6H, d)
1.017	Me		H	7.82 (1H, s), 7.74 (1H, d), 6.61 (1H, d), 3.79 (3H, s)
1.018	Me		H	8.08 (1H, d), 7.64 (1H, s), 7.50 (1H, d), 4.61 (2H, t), 3.91 (3H, s), 3.40 (2H, s a), 3.22 (3H, s), 2.24 (3H, s)
1.019	Me		H	3.60 (s, 3H), 6.37-6.40 (m, 1H), 7.51-7.52 (m, 1H), 7.77-7.78 (m, 1H), 7.86 (s, 1H), 11.87 (s a, 1H)

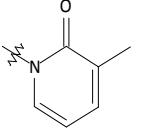
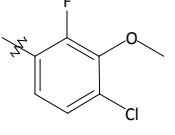
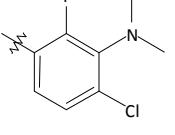
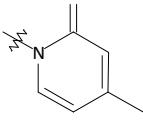
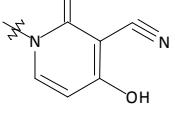
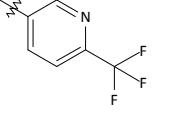
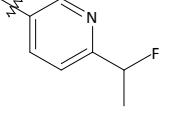
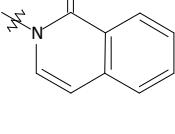
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.020	Me		H	3.86 (s, 3H), 3.98 (s, 3H), 6.99-7.03 (m, 1H), 7.80-7.82 (m, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.22-8.34 (m, 1H)
1.021	Me		H	
1.022	Me		H	7.82 (2H, m), 7.68 - 7.75 (1H, m), 7.52 - 7.60 (2H, m), 3.89 (3H, s)
1.023	Me		H	3.66 (3H, s), 6.66-6.70 (1H, dd), 6.83 (1H, d), 7.64-7.66 (1H, d), 7.78-7.82 (2H, d), 7.85 (1H, s), 7.91-7.93 (2H, d)
1.024	Me		H	9.22 (1H, s), 8.80 (2H, s), 7.91 (2H, m), 6.83 (1H, d), 3.82 (3H, s)
1.025	Me		H	7.90 (1H, s), 7.25 (1H, s), 6.99 (1H, s), 3.87 (3H, s), 3.78 (4H, m), 2.86 (4H, m)
1.026	Me		H	7.87 (1H, s), 7.22 (1H, d), 6.45 (1H, d), 3.86 (3H, s), 3.79 (4H, m), 3.17 (4H, m a)
1.027	Me		H	2.40 (3H, s), 3.64 (3H, s), 6.14-6.20 (2H, m), 7.32-7.34 (1H, d), 7.76 (1H, s)

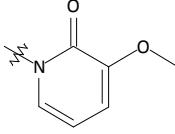
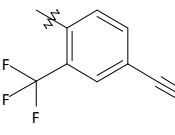
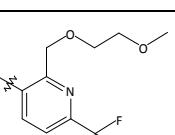
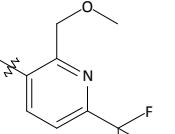
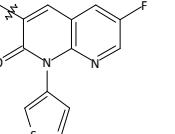
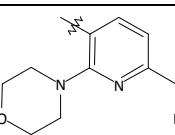
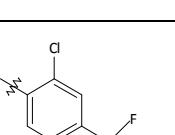
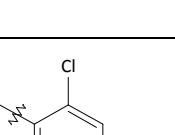
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.028	Me		H	8.48 (1H, d a), 8.00 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.54 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.03 (3H, s)
1.029	Me		H	8.47 (1H, d), 7.86 (1H, dd), 7.68 (1H, s), 7.48 (1H, d), 3.90 (3H, s), 2.67 (3H, s)
1.030	Me		H	3.09 ppm (3H, s), 3.90 ppm (3H, s), 5.11 ppm (2H, s), 5.47 ppm (2H, s), 7.53 ppm (1H, d), 7.71 ppm (1H, s), 7.93 ppm (1H, d)
1.031	Me		H	2.24 (3H, s), 2.62 ppm (2H, m), 2.78 ppm (3H, s), 3.52 ppm (2H, m), 3.90 ppm (3H, s), 4.20 ppm (2H, m), 4.31 ppm (2H, m), 7.19 ppm (1H, s), 7.59 ppm (1H, s)
1.032	Me		H	3.27 (3H, s), 3.47 (2H, t, J=10.2), 3.90 (3H, s), 4.63 (2H, t, J=10.2), 7.68 (1H, d, J=8.1), 7.72 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.1)
1.033	Me		H	8.07 (1H, s), 7.91 (1H, d), 7.62 (1H, s), 7.54 (1H, d), 3.90 (3H, s)
1.034	Me		H	3.35 ppm (3H, s), 3.49 ppm (3H, s), 3.87 ppm (2H, t), 3.90 ppm (3H, s), 4.47 ppm (2H, t), 7.35 ppm (1H, d), 7.71 ppm (1H, s), 8.00 ppm (1H, d)
1.035	Me		H	2.70 ppm (3H, s), 3.27 ppm (3H, s), 3.92 ppm (3H, s), 7.63 ppm (1H, s), 7.70 ppm (1H, d), 7.87 ppm (1H, d)
1.036	Me		H	8.18 (1H, dd), 7.72 (1H, td), 7.70 (1H, s), 7.61 (1H, td), 7.33 (1H, dd), 3.89 (3H, s), 2.66 (3H, s)

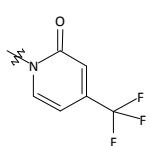
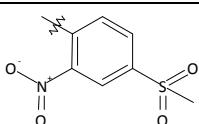
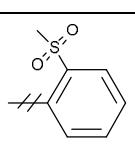
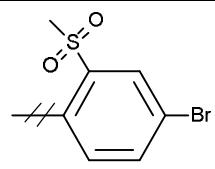
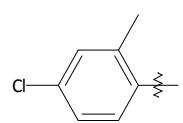
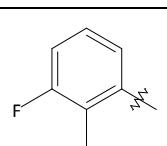
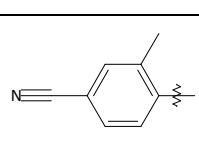
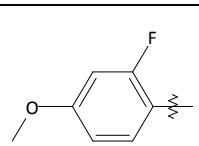
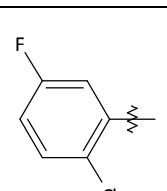
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.037	Me		H	7.85 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.42-7.40 (2H, m), 7.31 (1H, m), 7.22-7.20 (1H, m), 6.72 (1H, d), 3.78 (3H, s)
1.038	Me		H	7.88 (1H, s), 7.75 (1H, d), 7.34-7.31 (1H, m), 7.25-7.24 (1H, m), 7.12 (1H, s), 7.09 (1H, d), 6.74 (1H, d), 3.81 (3H, s), 2.40 (3H, s)
1.039	Me		H	9.24 (1H, dd), 8.64 (1H, s), 8.61 (1H, dd), 7.84 (1H, dd), 7.77 (1H, s), 3.85 (3H, s)
1.040	Me		H	7.81 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.63 (1H, s), 4.62 (2H, s), 3.90 (3H, s), 2.99 (3H, s), 2.90 (3H, s)
1.041	Me		H	8.10 (1H, dd), 7.74 (1H, s), 7.70 (1H, td), 7.62 (1H, td), 7.35 (1H, dd), 3.90 (3H, s), 2.89-2.80 (1H, m), 2.77-2.68 (1H, m), 1.20 (3H, t)
1.042	Me		H	8.16 (1H, dd), 7.74 (1H, td), 7.72 (1H, s), 7.67 (1H, td), 7.37 (1H, dd), 3.88 (3H, s), 3.01 (2H, c), 1.21 (3H, t)
1.043	Me		H	8.06 (1H, dd), 7.76 (1H, s), 7.68 (1H, td), 7.61 (1H, td), 7.36 (1H, dd), 3.90 (3H, s), 2.72 (1H, septuplicate), 1.10 (3H, d), 1.08 (3H, d)
1.044	Me		H	8.14 (1H, dd), 7.74-7.71 (1H, m), 7.73 (1H, s), 7.65 (1H, td), 7.37 (1H, dd), 3.88 (3H, s), 3.05 (1H, septuplicate), 1.20 (6H, d a)

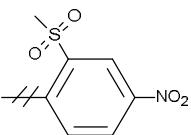
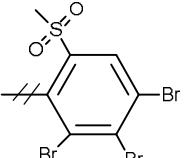
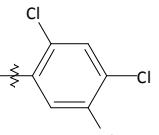
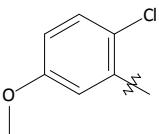
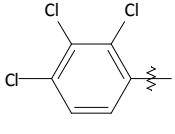
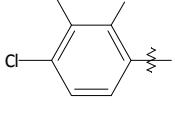
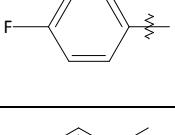
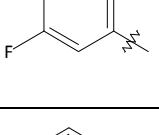
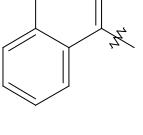
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.045	Me		H	2.37 ppm (3H, d), 3.87 ppm (3H, s), 7.29 ppm (2H, m), 7.79 ppm (1H, d)
1.046	Me		H	8.21 (1H, dd), 7.77-7.66 (2H, m), 7.71 (1H, s), 7.37 (1H, dd), 3.89 (3H, s), 2.99 (3H, s)
1.047	Me		H	8.12 (1H, dd), 7.72 (1H, s), 7.69 (1H, td), 7.60 (1H, td), 7.33 (1H, dd), 3.89 (3H, s), 2.74-2.70 (2H, m), 1.75-1.52 (2H, m), 1.44-1.24 (2H, m), 0.85 (3H, t)
1.048	Me		H	1.61 ppm (1H, m), 1.90 ppm (2H, m), 1.98 ppm (1H, m), 3.35 ppm (3H, s), 3.67 ppm (2H, m), 3.77 ppm (1H, m), 3.84 ppm (1H, m), 3.90 ppm (3H, s), 4.12 ppm (1H, m), 5.26 ppm (2H, m), 7.55 ppm (1H, d), 7.71 ppm (1H, s), 8.17 ppm (1H, d)
1.049	Me		H	3.26 ppm (3H, s), 3.91 ppm (3H, s), 4.08 ppm (2H, c), 5.42 ppm (2H, s), 7.61 ppm (1H, d), 7.72 ppm (1H, s), 8.19 ppm (1H, d)
1.050	Me		H	3.34 ppm (3H, s), 3.89 ppm (3H, s), 7.52 ppm (1H, d), 7.70 ppm (1H, s), 8.19 ppm (1H, d)
1.051	Me		H	8.16 (1H, dd), 7.75-7.72 (1H, m), 7.72 (1H, s), 7.66 (1H, td), 7.36 (1H, dd), 3.88 (3H, s), 2.99 (2H, t ap), 1.59 (2H, d a), 1.37-1.28 (2H, m), 0.85 (3H, t)
1.052	Me		H	7.86 (1H, s), 7.77 (1H, d), 7.64-7.60 (1H, m), 7.57-7.52 (1H, m), 7.47 (1H, d), 7.28 (1H, d a), 6.57 (1H, d), 3.85 (3H, s)

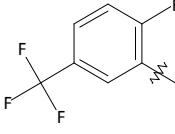
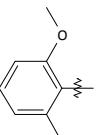
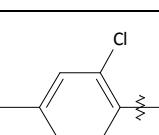
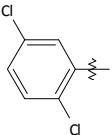
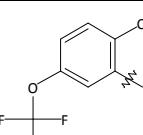
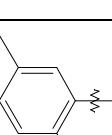
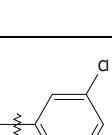
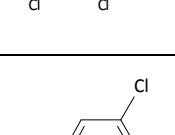
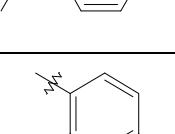
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.053	Me		H	7.82 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.30-7.19 (3H, m), 7.08 (1H, d), 6.73 (1H, d), 3.77 (3H, m), 2.12 (3H, s)
1.054	Me		H	7.85 (1H, s), 7.73 (1H, d), 7.42-7.40 (3H, m), 7.28-7.26 (2H, m), 6.72 (1H, d), 3.78 (3H, s)
1.055	Me		H	8.26-8.24 (1H, m), 7.78-7.76 (2H, m), 7.68 (1H, s), 7.42-7.40 (1H, m), 3.90 (3H, s)
1.056	Me		H	8.27 (1H, d), 7.91 (1H, td), 7.77 (1H, td), 7.65 (1H, s), 7.51 (1H, dd), 3.89 (3H, s)
1.057	Me		H	7.90 (1H, dd), 7.67 (1H, s), 7.36-7.27 (2H, m), 3.89 (3H, s), 2.64 (3H, s)
1.058	Me		H	7.93 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.46-7.42 (1H, m), 7.37 (1H, dd), 3.88 (3H, s), 3.00 (3H, s)
1.059	Me		H	8.14 (1H, d), 7.66 (1H, s), 7.57 (1H, dd), 7.27 (1H, d), 3.87 (3H, s), 2.66 (3H, s)
1.060	Me		H	3.64 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.14-6.16 (1H, d), 7.68-7.70 (1H, d), 7.89 (1H, s)
1.061	Me		H	8.20 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 7.68 (1H, s), 7.31 (1H, d), 3.88 (3H, s), 3.00 (3H, s)

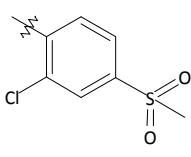
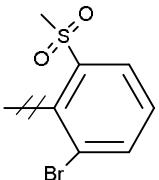
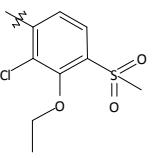
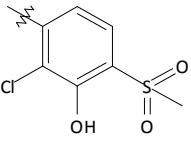
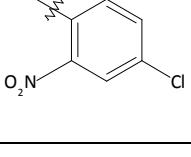
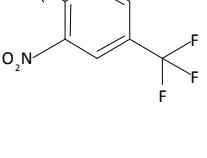
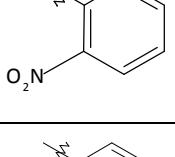
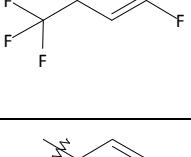
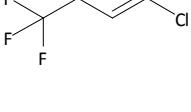
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.062	Me		H	2.02 (3H, s), 3.72 (3H, s), 6.22-6.26 (1H, t), 7.39-7.41 (2H, d), 7.84 (1H, s), 11.7-11.9 (1H, s a)
1.063	Me		H	3.88 ppm (3H, s), 4.02 ppm (3H, d), 7.19 ppm (1H, dd), 7.28 ppm (1H, dd), 7.81 ppm (1H, d)
1.064	Me		H	2.92 ppm (6H, 2s), 3.88 ppm (3H, s), 7.15 ppm (1H, dd), 7.26 ppm (1H, dd), 7.80 ppm (1H, d)
1.065	Me		H	2.18 (3H, s), 3.70 (3H, s), 6.18-6.20 (1H, dd), 6.30 (1H, s), 7.40-7.42 (1H, d), 7.82 (1H, s), 11.7-11.9 (1H, s a)
1.066	Me		H	3.70 (3H, s), 6.17-6.19 (1H, d), 7.70-7.72 (1H, d), 7.87 (1H, s)
1.067	Me		H	7.74 (1H, d), 7.66 (1H, s), 7.62 (1H, d), 3.90 (3H, s), 2.58 (3H, s)
1.068	Me		H	7.83 (1H, d), 7.67 (1H, s), 7.59 (1H, d), 5.90 (1H, dc), 3.90 (3H, s), 2.59 (3H, s), 1.76 (3H, dd)
1.069	Me		H	3.72 (3H, s), 6.70-6.72 (1H, d), 7.30-7.32 (1H, d), 7.53-7.57 (1H, t), 7.70-7.72 (1H, d), 7.76-7.80 (1H, t), 7.92 (1H, s), 8.21-8.23 (1H, d)

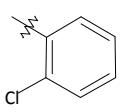
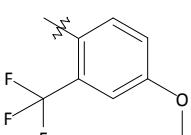
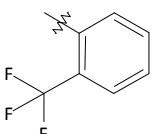
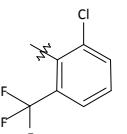
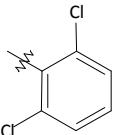
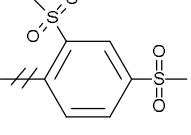
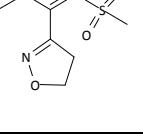
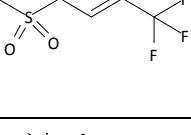
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.070	Me		H	3.79 (3H, s), 3.84 (3H, s), 6.39-6.43 (1H, t), 6.98-7.00 (1H, d), 7.08-7.10 (1H, d), 7.78 (1H, s)
1.071	Me		H	8.10 (1H, s), 7.94 (1H, dd), 7.60 (1H, s), 7.54 (1H, d), 3.89 (3H, s)
1.072	Me		H	7.88 (1H, d), 7.83 (1H, s), 7.73 (1H, d), 4.70 (2H, s), 3.90 (3H, s), 3.60-3.58 (2H, m), 3.45-3.43 (2H, m), 3.30 (3H, s)
1.073	Me		H	7.88 (1H, d), 7.81 (1H, s), 7.74 (1H, d), 4.57 (2H, s), 3.90 (3H, s), 3.35 (3H, s)
1.074	Me		H	8.42 (1H, d), 8.21 (1H, s), 8.19 (1H, s), 7.73 (1H, dd), 7.53 (1H, dd), 7.38 (1H, dd), 7.07 (1H, dd), 3.85 (3H, s)
1.075	Me		H	7.99 (1H, s), 7.87 (1H, d), 7.33 (1H, d), 3.87 (3H, s), 3.73 (4H, m), 3.26 (4H, m)
1.076	Me		H	7.79 (1H, s a), 7.73 (1H, s), 7.63 (1H, dd), 7.54 (1H, d), 3.89 (3H, s)
1.077	Me		H	7.71 (1H, d), 7.66 (1H, s), 7.47 (1H, d), 7.39 (1H, d), 3.67 (3H, s)

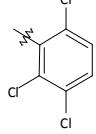
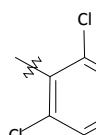
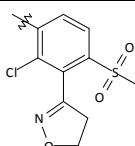
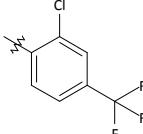
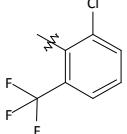
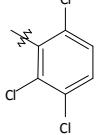
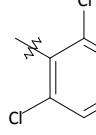
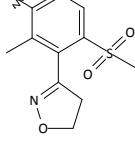
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.078	Me		H	7.83 (1H, s), 7.75 (1H, d), 6.94 (1H, m a), 6.61 (1H, dd), 3.79 (3H, s)
1.079	Me		H	8.66 (1H, d), 8.28 (1H, dd), 7.72 (1H, s), 7.71 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.18 (3H, s)
1.080	Me		H	
1.081	Me		H	8.35 (1H, d), 7.86 (1H, dd), 7.68 (1H, s), 7.24 (1H, d), 3.88 (3H, s), 3.00 (3H, s)
1.082	Me		H	7.69 (1H, s), 7.33-7.27 (1H, m), 7.23-7.19 (1H, m), 7.06 (1H, dd), 3.73 (3H, s), 2.06 (3H, d)
1.083	Me		H	7.69 (1H, s), 7.33-7.27 (1H, m), 7.23-7.19 (1H, m), 7.06 (1H, dd), 3.73 (3H, s), 2.06 (3H, d)
1.084	Me		H	7.82 (1H, s a), 7.73 (1H, dd), 7.71 (1H, s), 7.42 (1H, d), 3.73 (3H, s), 2.21 (3H, s)
1.085	Me		H	7.74 (1H, d), 7.40 (1H, t ap), 6.92 (1H, dd), 6.86 (1H, dd), 3.80 (3H, s), 3.70 (3H, s)
1.086	Me		H	7.62 (1H, s), 7.51 (1H, dd), 7.26-7.19 (2H, m), 3.63 (3H, s)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.087	Me		H	8.89 (1H, d), 8.63 (1H, dd), 7.77 (1H, d), 3.88 (3H, s), 3.04 (3H, s)
1.088	Me		H	8.45 (1H, s), 7.56 (1H, s), 3.90 (3H, s), 2.98 (3H, s)
1.089	Me		H	8.00 (1H, s), 7.77 (1H, s), 7.74 (1H, s), 3.72 (3H, s)
1.090	Me		H	7.66 (1H, s), 7.42 (1H, d), 6.99-6.94 (2H, m), 3.73 (3H, s), 3.69 (3H, s)
1.091	Me		H	7.75 (1H, s), 7.74 (1H, d), 7.44 (1H, d), 3.72 (3H, s)
1.092	Me		H	7.70 (1H, s), 7.66 (1H, dd), 7.29 (1H, dd), 3.69 (3H, s)
1.093	Me		H	7.66 (1H, s), 7.24 (1H, dd), 7.16 (1H, dd), 7.08 (1H, td), 3.73 (3H, s), 2.16 (3H, s)
1.094	Me		H	7.69 (1H, s), 7.33 (1H, dd), 7.15 (1H, td), 7.08 (1H, dd), 3.73 (3H, s), 2.13 (3H, s)
1.095	Me		H	8.00 (2H, d), 7.77 (1H, s), 7.61-7.46 (5H, m), 3.79 (3H, s)

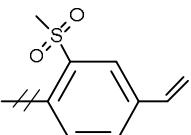
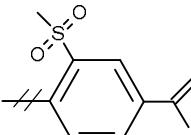
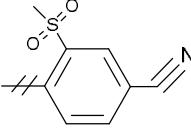
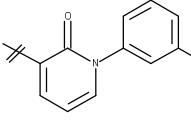
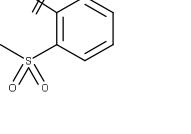
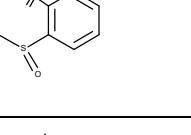
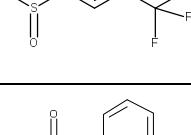
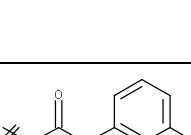
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.096	Me		H	7.91-7.86 (3H, m), 7.60-7.55 (1H, m), 3.73 (3H, s)
1.097	Me		H	7.68-7.17 (4H, m), 3.63 (6H, m)
1.098	Me		H	7.75-7.66 (4H, m), 3.74 (3H, s), 2.50 (3H, s)
1.099	Me		H	7.68 (1H, s), 7.57-7.54 (1H, m), 7.48-7.45 (2H, m), 3.68 (3H, s)
1.100	Me		H	7.55 (1H, s), 7.40 (1H, d), 7.15 (1H, d), 7.11-7.08 (1H, m), 3.743 (3H, s)
1.101	Me		H	7.59 (1H, s), 7.25 (1H, d), 7.07-7.03 (2H, m), 3.74 (3H, s), 2.25 (3H, s)
1.102	Me		H	7.68 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.30 (1H, d), 3.88 (3H, s)
1.103	Me		H	7.58 (1H, s), 7.18 (1H, d), 6.91 (1H, d), 6.77 (1H, dd), 3.72 (3H, s), 3.71 (3H, s)
1.104	Me		H	7.70 (1H, s), 7.61 (1H, d), 7.35 (1H, d), 7.24 (1H, dd), 3.93 (3H, s), 3.88 (3H, s)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.105	Me		H	8.09 (1H, d), 8.00 (1H, dd), 7.79 (1H, d), 7.75 (1H, s), 3.77 (3H, s), 3.26 (3H, s)
1.106	Me		H	8.20 (1H, dd), 8.01 (1H, dd), 7.60 (1H, s), 7.55 (1H, t ap), 3.90 (3H, s), 2.98 (3H, s)
1.107	Me		H	7.97 (1H, d), 7.71 (1H, s), 7.32 (1H, d), 4.35 (2H, c), 3.90 (3H, s), 3.30 (3H, s), 1.53 (3H, t)
1.108	Me		H	7.88 (1H, d), 7.72 (1H, s), 7.13 (1H, d), 3.84 (3H, s), 3.35 (3H, s)
1.109	Me		H	8.11 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.41 (1H, d), 3.88 (3H, s)
1.110	Me		H	8.38 (1H, s), 7.98 (1H, d), 7.72 (1H, s), 7.63 (1H, d), 3.89 (3H, s)
1.111	Me		H	8.12 (1H, dd), 7.76-7.71 (1H, m), 7.73 (1H, s), 7.64-7.60 (1H, m), 7.47 (1H, d), 3.88 (3H, s)
1.112	Me		H	7.62 (1H, s), 7.51 (1H, dd), 7.39-7.32 (2H, m), 3.87 (3H, s)
1.113	Me		H	7.79 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 7.61 (1H, s), 7.32 (1H, d), 3.89 (3H, s)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.114	Me		H	7.75 (1H, s), 7.53-7.51 (1H, m), 7.41-7.36 (3H, m), 3.89 (3H, s)
1.115	Me		H	7.62 (1H, s), 7.30 (1H, d), 7.28 (1H, d), 7.14 (1H, d), 3.89 (3H, s), 3.88 (3H, s)
1.116	Me		H	7.80 (1H, d), 7.66-7.63 (2H, s y m solapados), 7.59-7.55 (1H, m), 7.37 (1H, d), 3.89 (3H, s)
1.117	Me		H	
1.118	Me		H	7.60 (1H, s), 7.43 (1H, d), 7.34-7.30 (1H, m), 3.90 (3H, s)
1.119	Me		H	8.47 (1H, s), 8.27 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.67 (1H, s), 3.68 (3H, s), 3.32 (3H, s), 3.15 (3H, s)
1.120	metilciclopropilo		H	0.46-0.53 (2H, m), 0.57-0.67 (2H, m), 1.37-1.48 (1H, m), 2.25 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.39 (1H, s a), 4.11 (2H, d, J=7.2), 4.61 (2H, t, J=10.1), 7.53 (1H, d, J=8.1), 7.66 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.1)
1.121	metilciclopropilo		H	8.49 (1H, d), 7.99 (1H, dd), 7.71 (1H, s), 7.57 (1H, d), 4.11 (2H, m a), 3.04 (3H, s), 1.42 (1H, m), 0.64-0.59 (2H, m), 0.50-0.47 (2H, m)
1.122	metilciclopropilo		H	8.48 (1H, s), 7.87 (1H, d), 7.70 (1H, m), 7.51 (1H, d), 4.11 (2H, m), 2.70 (3H, m), 1.42 (1H, m), 0.62 (2H, m), 0.50 (2H, m)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.123	<i>n</i> -Bu		H	7.70 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.31 (1H, d), 4.23 (2H, dd), 1.90-1.82 (2H, m), 1.47-1.38 (2H, m), 0.99 (3H, t)
1.124	<i>n</i> -Bu		H	7.62 (1H, s a), 7.48-7.28 (3H, m a), 4.24 (2H, m a), 1.87 (2H, m a), 1.42 (2H, m a), 0.99 (3H, m a)
1.125	<i>n</i> -Pr		H	1.02 (3H, t, J=7.5), 1.84-1.97 (2H, m), 3.27 (3H, s), 3.47 (2H, t, J=9.9), 4.16-4.25 (2H, m), 4.63 (2H, t, J=10.2), 7.69 (1H, d, J=8.1), 7.74 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.1)
1.126	<i>n</i> -Pr		H	7.79 (1H, d a), 7.74 (1H, s), 7.63 (1H, dd), 7.55 (1H, d), 4.20 (2H, m), 1.96-1.87 (2H, m), 1.02 (3H, t)
1.127	<i>n</i> -Pr		H	
1.128	<i>n</i> -Pr		H	7.70 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.31 (1H, d), 4.19 (2H, dd), 1.95-1.86 (2H, m), 1.01 (3H, t)
1.129	<i>n</i> -Pr		H	7.70-7.00 (4H, m a), 4.20 (2H, m a), 1.90 (2H, m a), 1.00 (3H, m a)
1.130	Ph		H	2.31 (3H, s), 3.23 (3H, s), 3.41 (2H, d, J=4.6), 4.62 (2H, t, J=10.0), 7.43-7.49 (1H, m), 7.51-7.60 (3H, m), 7.71-7.76 (2H, m), 7.81 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.2)

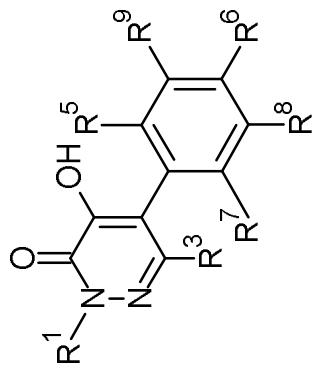
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.131	t-Bu		H	1.73 (9H, s), 2.25 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.39 (2H, s a), 4.61 (2H, t, J=9.9), 7.51 (1H, d, J=8.1), 7.62 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.1)
1.132	t-Bu		H	7.67 (1H, s), 7.55 (1H, d), 7.31 (1H, d), 1.71 (9H, s)
1.133	t-Bu		H	7.58 (1H, s), 7.44-7.42 (2H, 2 s ap), 7.33-7.29 (1H, m), 1.73 (9H, s)
1.134	Me		H	2.88 (6H, s), 3.87 (3H, s), 7.22 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.77 (1H, d, J=7.0 Hz), 7.82 (1H, s)
1.135	Me		H	1.37 - 1.48 (3H, m), 3.66 (2H, c, J=7.5 Hz), 3.88 (3H, s), 7.91 (1H, s), 7.98 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.13 (1H, d, J=8.1 Hz)
1.136	cPr		H	1.06 (dd, J=7.52, 1.61 Hz, 2H), 1.22 - 1.31 (m, 2H), 2.99 (s, 3H), 4.15 (tt, J=7.67, 3.94 Hz, 1H), 7.36 (dd, J=7.52, 1.21 Hz, 1H), 7.64 - 7.77 (m, 3H), 8.20 (dd, J=7.86, 1.28 Hz, 1H)
1.137	Me		H	
1.138	Me		H	δ 8.02 (s a, 1H), 7.77 - 7.93 (m, 3H), 7.63 - 7.76 (m, 2H), 6.44 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.60 (s, 3H)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.139	Me		H	8.21 (1H, d), 7.73 (1H, dd), 7.70 (1H, s), 7.32 (1H, d), 6.80 (1H, dd), 5.95 (1H, d), 5.50 (1H, d), 3.88 (3H, s), 2.99 (3H, s)
1.140	Me		H	8.26 (1H, d), 7.79 (1H, dd), 7.70 (1H, s), 7.33 (1H, d), 5.55 (1H, m a), 5.29 (1H, m a), 3.88 (3H, s), 2.99 (3H, s), 2.22 (3H, m a)
1.141	Me		H	8.51 (1H, d), 8.01 (1H, dd), 7.68 (1H, s), 7.53 (1H, d), 3.89 (3H, s), 3.02 (3H, s)
1.143	Me		H	δ 7.86 (s a, 1H), 7.65 (d, J=5.9 Hz, 1H), 7.58 (s a, 1H), 7.49 (s a, 1H), 7.40 (s a, 1H), 6.40 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.58 (s a, 3H)
1.144	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub> -		H	8.21 (1H, dd), 7.77-7.74 (1H, m), 7.75 (1H, s), 7.71-7.67 (1H, m), 7.38 (1H, dd), 5.57-5.47 (2H, m a), 3.53 (3H, s), 3.00 (3H, s)
1.145	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub> -		H	8.19 (1H, dd), 7.75 (1H, s), 7.72 (1H, dd), 7.62 (1H, td), 7.34 (1H, dd), 5.55-5.50 (2H, m), 3.54 (3H, s), 2.69 (3H, s)
1.146	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub> -		H	8.47 (1H, d), 7.87 (1H, dd), 7.74 (1H, s), 7.49 (1H, d), 5.54 (1H, d), 5.51 (1H, d), 3.55 (3H, s), 2.69 (3H, s)
1.147	Me		H	δ 8.39 - 8.43 (m, 1H), 8.30 - 8.36 (m, 1H), 7.97 - 8.02 (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.81 - 7.89 (m, 3H), 6.53 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.67 (s, 3H)
1.148	Me		H	8.11 (s, 1H), 7.90 (dd, J=5.9, 1.1 Hz, 1H), 7.49 (m, J=5.9 Hz, 2H), 7.17 - 7.24 (m, 2H), 6.49 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.84 (s, 2H)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.149	Me		H	3.90 (2H, s), 7.73 (1H, d, J=1.074 Hz), 8.02 (1H, dd, J=2.149, 1.074 Hz)
1.150	Me		H	3.88 (2H, s), 4.07 (2H, s), 6.93 (1H, d, J=5.37 Hz), 7.73 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=5.37 Hz), 8.15 - 8.16 (1H, m)
1.151	Me		H	8.26 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.87 (d, 3H)
1.152	Me		H	δ 7.89 (s, 2H), 7.79-7.81 (m, 5H), 6.51-6.54 (t, 1H), 3.66 (s, 3H)
1.153	Me		H	3.85 (3H, s), 3.97 (3H, s), 4.05 (s, 3H), 6.40-6.44 (1H, d), 7.75-7.77 (1H, d), 7.93 (1H, s)
1.154	Me		H	8.20 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.56 (d, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.90 (s, 3H)
1.156	Me		H	δ 8.09 (s a, 1H), 7.88-7.90 (d, 1H), 7.50-7.51 (d, 1H), 7.41-7.45 (t, 1H), 6.94-7.03 (m, 2H), 6.48-6.52 (t, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.83 (s a, 3H)
1.157	Me		Me	8.08-8.10 (d, 1H), 7.38-7.40 (d, 1H), 4.58-4.63 (t, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.40 (s a, 2H), 3.23 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.02 (s, 3H)
1.157	Me		H	9.18 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.69 (s, 1H), 3.90 (s, 3H)

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
1.158	cPr		H	3.30 (s, 6H), 3.47 (t, J=10.27 Hz, 4H), 4.64 (t, J=10.14 Hz, 4H), 7.56 (m, J=8.06 Hz, 2H), 8.19 (m, J=8.19 Hz, 2H)
1.159	Me		H	7.82-7.80 (2H, m), 7.50-7.48 (1H, m), 7.43-7.35 (2H, m), 7.29-7.27 (1H, m), 6.74 (1H, d), 3.78 (3H, s)
1.160	Me		H	8.29 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.68 (1H, s), 3.70 (3H, s), 3.17 (3H, s)
1.161	Me		H	8.04 (1H, d), 7.96 (1H, d), 7.58 (1H, s), 3.90 (3H, s), 2.96 (3H, s)
1.163	C≡C-CH <sub>2</sub> -		H	2.24 (s, 3H), 2.45 (t, J=2.55 Hz, 1H), 3.22 (s, 3H), 3.40 (s a, 2H), 4.61 (t, J=10.00 Hz, 2H), 5.04 (d, J=2.42 Hz, 2H), 7.51 (d, J=8.19 Hz, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.09 (d, J=8.19 Hz, 1H)
1.164	Me		H	9.13 (m, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 3.95 (m, 4H), 3.90 (s, 3H), 3.42 (m, 4H)
1.165	Me		H	7.84 (s, 1H), 7.32-7.34 (dd, 1H), 7.21-7.25 (m, 1H), 6.89-6.92 (m, 2H), 3.79 (s, 3H)

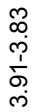
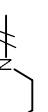
TABLA C2 – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.



Cmp.	R'	R³	R⁵	R⁹	R'	R⁸	R⁹	RMN
2.001	-alilo	H	-S (O)₂ Me	H	H	H	H	8.20 (1H, dd, J=7.9, 1.3 Hz), 7.71 - 7.77 (2H, m), 7.64 - 7.71 (1H, m), 7.38 (1H, dd, J=7.5, 1.2 Hz), 6.04 (1H, ddt, J=17.3, 10.0, 6.0, 6.0 Hz), 5.27 - 5.35 (2H, m), 4.83 (2H, d, J=19.7 Hz), 3.01 (3H, s)
2.002	Metoximetil-	H	H	-CF₃	H	H	H	8.48 (1H, s a), 8.00 (1H, dd), 7.73 (1H, s), 7.55 (1H, d), 5.52 (2H, s a), 3.54 (3H, s), 3.04 (3H, s)
2.003	Metoximetil-	H	-SOEt	H	H	H	H	8.11 (1H, dd), 7.76 (1H, s), 7.70 (1H, td), 7.61 (1H, td), 7.35 (1H, dd), 5.54 (1H, d), 5.51 (1H, d), 3.54 (3H, s), 2.84-2.75 (1H, m), 2.70-2.61 (1H, m), 1.18 (3H, t)
2.004	Metoximetil-	H	-SO₂ Et	H	H	H	H	8.16 (1H, dd), 7.77-7.73 (1H, m), 7.75 (1H, s), 7.68 (1H, td), 7.39 (1H, dd), 5.52 (2H, d a), 3.53 (3H, s), 3.02 (2H, c), 1.21 (3H, t)
2.005	Metoximetil-	H	-S (O)₂ Me	Cl	H	H	H	8.20 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 7.71 (1H, s), 7.33 (1H, d), 5.51 (2H, s a), 3.53 (3H, s), 3.01 (3H, s)
2.006	Metoximetil-	H	-S (O)₂ Me	F	H	H	H	7.93 (1H, dd), 7.72 (1H, s), 7.48-7.43 (1H, m), 7.39 (1H, dd), 5.52 (2H, s a), 3.53 (3H, s), 3.01 (3H, s)

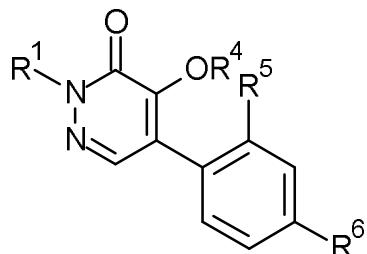
Cmp.	R'	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R'	R'	R'	R'	RMIN
2.007	i-butilo	H	Me	-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H			8.09 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (1H, s), 7.48 - 7.56 (1H, m), 4.61 (2H, t, J=9.9 Hz), 4.07 (2H, d, J=7.5 Hz), 3.39 (2H, s a), 3.22 (3H, s), 2.35 (1H, dt, J=13.6, 6.9 Hz), 2.24 (3H, s), 1.00 (6H, d, J=6.4 Hz)
2.008	p-metoxibencil-	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	Cl	H			
2.009	-etnilo	H	Me		Cl	H			
2.010	-etnilo	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H			8.5 (1H, s a), 8.0 (1H, d), 7.7 (1H, s), 7.5 (1H, d), 5.0 (2H, d a), 3.0 (3H, s), 2.4 (1H, m)
2.011	-etnilo	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	Cl-	H			8.2 (1H, s), 7.7 (2H, m), 7.3 (1H, d), 5.0 (2H, d a), 3.0 (3H, s), 2.4 (1H, m)
2.012	CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H			8.20 (1H, dd, J=7.9, 1.1 Hz), 7.64 - 7.81 (3H, m), 7.35 - 7.43 (1H, m), 4.69 (1H, s a), 4.46 (1H, s a), 3.00 (3H, s)
2.013	CH <sub>3</sub> C≡CCH <sub>2</sub> -	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H			8.21 (1H, dd, J=7.9, 1.3 Hz), 7.72 - 7.79 (2H, m), 7.69 (1H, dd, J=7.7, 1.4 Hz), 7.38 (1H, dd, J=7.6, 1.3 Hz), 4.75 - 5.15 (1H, m), 3.54 - 3.80 (1H, m), 3.00 (3H, s), 1.87 (3H, t, J=2.4 Hz)
2.014	c-Propil-	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	Cl	H			8.19 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.69 (1H, dd, J=8.2, 2.1 Hz), 7.63 (1H, s), 7.30 (1H, d, J=8.2 Hz), 4.15 (1H, tt, J=7.7, 3.9 Hz), 3.00 (4H, s), 1.26 (2H, s a), 1.06 (2H, dd, J=7.5, 1.6 Hz)
2.015	c-Propio	H		-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H			8.48 (1H, s), 7.96 - 8.01 (1H, m), 7.65 (1H, s), 7.53 (1H, d, J=7.9 Hz), 4.16 (1H, dt, J=7.8, 3.7 Hz), 3.03 (3H, s), 1.27 (2H, s a), 1.07 (2H, dd, J=7.5, 1.6 Hz)

Cmpd.	R'	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R'	R <sup>8</sup>	R'	R <sup>9</sup>	RMIN
2.016	Etilo	H	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.5 (1H, s), 8.0 (1H, d), 7.7 (1H, s), 7.5 (1H, d), 4.3 (2H, c a), 3.0 (3H, s), 1.5 (3H, t)
2.017	Etilo	H	-S(O) <sub>2</sub> Me	Cl	H	H	H		8.2 (1H, s a), 7.8 (1H, dd), 7.6 (1H, s), 7.4 (1H, d), 4.3 (2H, m a), 3.1 (3H, s), 1.4 (3H, t)
2.018	i-propilo	H	Cl	H	Cl	H	H		
2.019	Metilo	cPr			-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H		0.71 - 0.82 (2H, m), 0.87 - 1.07 (2H, m), 1.21 - 1.32 (1H, m), 2.18 (3H, s), 3.23 (3H, s), 3.41 (2H, s a), 3.81 (3H, s), 4.60 (2H, t, J=9.9 Hz), 7.48 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.09 (1H, d, J=8.1 Hz)
2.020	Metilo	vinilo			-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H		2.13 (3H, s), 3.24 (3H, s), 3.40 (2H, s a), 3.93 (3H, s), 4.60 (2H, t, J=9.9 Hz), 5.29 - 5.34 (1H, m), 5.95 - 6.10 (2H, m), 7.41 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.09 (1H, d, J=8.1 Hz)
2.021	Metilo	-S(O) <sub>2</sub> Et	Me	-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H			1.40 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.17 (3H, s), 3.22 (3H, s), 3.30 - 3.61 (2H, m y 2H, s a), 3.95 (3H, s), 4.58 (2H, t, J=9.9 Hz), 7.51 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.06 (1H, d, J=8.1 Hz)
2.022	Metilo	-NO <sub>2</sub>	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.40 (1H, d a), 8.02 (1H, dd), 7.53 (1H, d), 3.99 (3H, s), 2.98 (3H, s)
2.023	Metilo	CH <sub>2</sub> =C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Me		H	H			1.83 (3H, d, J=1.6 Hz), 2.16 (3H, s), 3.23 (3H, s), 3.29 - 3.48 (2H, s a), 3.91 (3H, s), 4.60 (2H, t, J=9.9 Hz), 4.76 (1H, s), 5.13 (1H, s), 7.38 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.03 (1H, d, J=8.1 Hz)
2.024	Metilo	i-Pr	Me	-S(O) <sub>2</sub> Me	H	H			1.07 (3H, d, J=7.0 Hz), 1.10 (3H, d, J=7.0 Hz), 2.13 (3H, s), 2.42 - 2.54 (1H, m), 3.24 (3H, s), 3.33 - 3.50 (2H, s a), 3.88 (3H, s), 4.60 (2H, t, J=10.2 Hz), 7.40 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.08 (1H, d, J=8.6 Hz)003

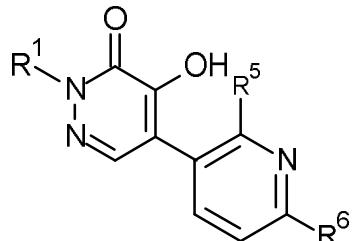
Cmp.	R'	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R'	R <sup>8</sup>	R'	R <sup>9</sup>	RMIN
2.025	Metilo	-CN	Me	-S (O) <sub>2</sub> Me	H	H			2.23 (3H, s), 3.24 (3H, s), 3.30 - 3.51 (2H, s a), 3.98 (3H, s), 4.61 (2H, t, J=10.2 Hz), 7.52 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.14 (1H, d, J=8.6 Hz)
2.026	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	H	Br	H			7.98 (1H, d), 7.56 (1H, s), 7.45 (1H, d), 3.88 (7H, s solapado con s a), 3.36 (3H, s), 3.17 (2H, m a), 2.96 (2H, m a)
2.027	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	Br	H				8.18 (1H, s), 7.55 (1H, s), 4.22-4.17 (1H, m), 3.97-3.95 (1H, m), 3.91-3.83 (3H, m), 3.87 (3H, s), 3.79-3.74 (1H, m), 3.34 (3H, s), 2.99-2.97 (1H, m), 2.73-2.71 (1H, m)
2.028	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	-C≡C	H	H			8.31 (1H, d), 7.80 (1H, dd), 7.68 (1H, s), 7.33 (1H, d), 3.88 (3H, s), 3.28 (1H, s), 2.99 (3H, s)
2.029	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	-C≡C-CH <sub>3</sub>	H	H			8.20 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 7.68 (1H, s), 7.27 (1H, d), 3.87 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.10 (3H, s)
2.030	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -O-	H	H			7.75 (1H, d), 7.68 (1H, s), 7.35-7.29 (2H, m), 4.50 (1H, d), 4.46 (1H, d), 3.88 (3H, s), 2.98 (3H, s)
2.031	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	Me	H	H			8.01 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.54-7.52 (1H, m), 7.25 (1H, d), 3.88 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.51 (3H, s)
2.032	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	-NO <sub>2</sub>	H	H			9.06 (1H, d), 8.57 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.61 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.06 (3H, s)
2.033	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	-fenilo	H	H			8.42 (1H, d), 7.94 (1H, dd), 7.75 (1H, s), 7.68-7.66 (2H, m), 7.53-7.43 (4H, m), 3.90 (3H, s), 3.03 (3H, s)
2.034	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub> C(O)-	H	H			8.05 (1H, d), 7.66 (1H, s), 7.55 (1H, dd), 7.40-7.28 (5H, m), 7.21 (1H, d), 4.25 (2H, s), 3.87 (3H, s), 2.92 (3H, s)
2.035	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	Bencil-S-	H	H			

Cmp.	R'	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R'	R'	R'	R'	RMIN
2.036	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	Bencil-S(O) <sub>2</sub> -	H	H	H	H	8.39 (1H, d), 7.94 (1H, dd), 7.65 (1H, s), 7.45 (1H, d), 7.38-7.30 (3H, m), 7.16-7.15 (2H, m), 4.42 (2H, s), 3.89 (3H, s), 2.94 (3H, s)
2.037	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me		H	H	H	H	8.55 (1H, d), 8.10 (1H, dd), 7.71 (1H, s), 7.58 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.80 (4H, m), 3.12 (4H, m), 3.04 (3H, s)
2.038	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHN(CH <sub>3</sub> )SO <sub>2</sub> -	H	H	H	H	8.59 (1H, d), 8.15 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.52 (1H, d), 4.31 (1H, quint.), 3.89 (3H, s), 3.03 (3H, s), 2.80 (3H, s), 1.10 (6H, d)
2.039	Metilo	NH <sub>2</sub>	-S (O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
2.040	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	CH <sub>3</sub> O-CH <sub>2</sub> -	H	H	H	H	8.16 (1H, d a), 7.71 (1H, dd a), 7.69 (1H, s), 7.35 (1H, d), 4.58 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.48 (3H, s), 2.99 (3H, s)
2.041	Metilo	CH <sub>3</sub> -O-	-S (O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	8.43 (1H, d a), 7.97 (1H, dd a), 7.47 (1H, d), 3.78 (3H, s), 3.75 (3H, s), 3.01 (3H, s)
2.042	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	-C(O)OH	H	H	H	H	
2.043	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	i-Pr-O-CH <sub>2</sub> -	H	H	H	H	8.16 (1H, d), 7.73 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.34 (1H, d), 4.62 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.76 (1H, quint.), 2.99 (3H, s), 1.27 (6H, d)
2.044	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	c-hexil-CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -	H	H	H	H	
2.045	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me		H	H	H	H	
2.046	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me		H	H	H	H	
2.047	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> bencilo	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	7.90 (1H, dd), 7.69 (1H, d a), 7.64 (1H, s), 7.53 (1H, d), 7.34-7.31 (1H, m), 7.26-7.22 (2H, m), 7.08-7.07 (2H, m), 4.28 (2H, s), 3.91 (3H, s)

Cmp.	R'	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R'	R <sup>8</sup>	R'	R <sup>9</sup>	RMIN
2.048	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) (f-Pr)	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		
2.049	Metilo	H		-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.30 (1H, d), 7.94 (1H, dd), 7.73 (1H, s), 7.56 (1H, d), 3.88 (3H, s), 3.65-3.62 (4H, m), 2.98 (4H, s, a)
2.050	Metilo	EtO-	-S (O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.43 (1H, d a), 7.96 (1H, dd), 7.47 (1H, d), 4.17 (2H, c), 3.76 (3H, s), 3.01 (3H, s), 1.19 (3H, t)
2.051	Metilo	nPr-O-	-S (O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.43 (1H, d a), 7.96 (1H, dd), 7.47 (1H, d), 4.05 (2H, t), 3.76 (3H, s), 3.01 (3H, s), 1.61-1.52 (2H, m), 0.78 (3H, t)
2.052	Metilo	iPr-O-	-S (O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.42 (1H, d a), 7.96 (1H, dd), 7.44 (1H, d), 5.01 (1H, quint.), 3.76 (3H, s), 3.01 (3H, s), 1.19 (3H, d), 1.16 (3H, d)
2.053	Metilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	H	H	H		8.16 (1H, d), 7.75 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.39 (1H, d), 4.82 (2H, s), 3.97 (2H, c), 3.88 (3H, s), 2.99 (3H, s)
2.054	Vinilo	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	H	H	H	H		8.20 (1H, dd, J=7.9, 1.1 Hz), 7.81 (1H, td, J=7.6, 1.4 Hz), 7.74 (1H, td, J=7.7, 1.3 Hz), 7.70 (1H, s), 7.40 (1H, dd, J=7.5, 1.2 Hz), 5.18 (1H, d, J=16.5 Hz), 4.82 (1H, d, J=16.5 Hz), 3.83 (3H, s), 3.00 (3H, s)
2.055	H	H	Cl	-S (O) <sub>2</sub> Me	H	H			8.17 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, s), 7.69 (1H, d, J=8.6 Hz), 4.64 (2H, t, J=10.2 Hz), 3.47 (2H, t, J=10.2 Hz), 3.28 (3H, s)
2.056	Me	-OH	-S (O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	H	H	H		8.37 (1H, d a), 8.06 (1H, dd a), 7.61 (1H, d), 3.66 (3H, s), 3.14 (3H, s)
2.057	Me	H	-S (O) <sub>2</sub> Me	CH <sub>3</sub> O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O-CH <sub>2</sub> -	H	H	H		8.17 (1H, d), 7.74 (1H, dd), 7.69 (1H, s), 7.34 (1H, d), 4.70 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.74-3.72 (2H, m), 3.64-3.62 (2H, m), 3.42 (3H, s), 2.99 (3H, s)

**TABLA C3** – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

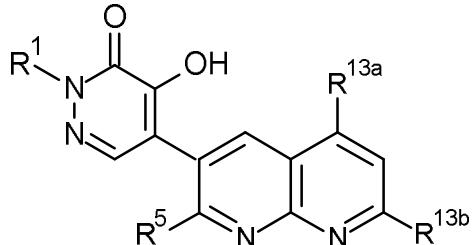
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	RMN
3.001	Metilo	CH <sub>3</sub> C(O)-	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.49 (1H, d a), 7.98 (1H, dd), 7.77 (1H, s), 7.52 (1H, d), 3.88 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.21 (3H, s)
3.002	Metilo	Fenilo-C(O)-	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.46 (1H, d a), 7.97-7.94 (3H, m), 7.83 (1H, s), 7.64-7.60 (2H, m), 7.46-7.42 (2H, m), 3.91 (3H, s), 3.09 (3H, s)
3.003	Metilo	CH <sub>3</sub> OC(O)-	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.48 (1H, d a), 8.00 (1H, dd), 7.78 (1H, s), 7.54 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.03 (3H, s)
3.004	Metilo	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> SC(O)-	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.48 (1H, d a), 7.99 (1H, dd), 7.76 (1H, s), 7.53 (1H, d), 3.89 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.91 (2H, c), 1.30 (3H, t)
3.005	Metilo	nPr-S(O) <sub>2</sub> -	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.44 (1H, d a), 8.03 (1H, dd a), 7.78 (1H, s), 7.64 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.91-3.85 (1H, m), 3.79-3.73 (1H, m), 3.07 (3H, s), 2.01-1.95 (2H, m), 1.10 (3H, t)
3.006	Metilo	4-Me-fenil-S(O) <sub>2</sub> -	-S(O) <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.43 (1H, d a), 8.00 (1H, dd a), 7.87 (2H, d), 7.77 (1H, s), 7.65 (1H, d), 7.33 (2H, d), 3.87 (3H, s), 3.06 (3H, s), 2.45 (3H, s)

**TABLA C4** – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

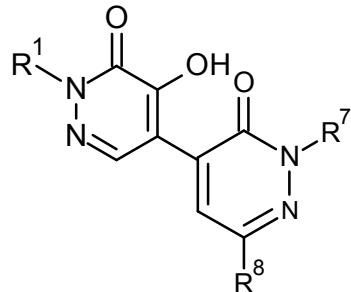
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	RMN
4.001	Etil-	-SO <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	8.1 (1H, d), 8.0 (1H, d), 7.9 (1H, s a), 4.3 (2H, c), 3.4 (3H, s), 1.4 (3H, t)
4.002	Metil-		-CF <sub>3</sub>	

Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	RMN
4.003	Metil-	-SO <sub>2</sub> Me	-CF <sub>3</sub>	3.41 (3H, s), 3.86 (3H, s), 7.85 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.13 (1H, d, J=8.1 Hz)
4.004	Metil-		-CF <sub>3</sub>	1.14 (6H, d, J=5.9 Hz), 2.58 - 2.69 (2H, m), 3.41 (2H, d, J=10.7 Hz), 3.64 - 3.76 (2H, m), 3.88 (3H, s), 7.31 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.86 (1H, d, J=7.0 Hz), 7.95 (1H, s)
4.005	Metil-	CH <sub>3</sub> -O-	-CF <sub>3</sub>	δ 11.28 (s a, 1H), 7.97 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.53 (d, J=7.5 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.65 (s, 3H)
4.006	Metil-	-OH	-CF <sub>3</sub>	δ 12.21 (s a, 1H), 7.90 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.35 (d, J=7.0 Hz, 1H), 3.65 (s, 3H)
4.007	Metil-	HOC(O)CH <sub>2</sub> O-	-CF <sub>3</sub>	
4.008	Metil-	Ph-O-	-CF <sub>3</sub>	3.88 (3H, s), 7.14 - 7.19 (2H, m), 7.19 - 7.24 (1H, m), 7.36 - 7.42 (2H, m), 7.49 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.01 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.6 Hz)
4.009	Metilo	3-Cl-bencil-O-	-CF <sub>3</sub>	3.87 (3H, s), 5.46 (2H, s), 7.27 - 7.35 (3H, m), 7.40 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.45 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=7.5 Hz)
4.010	Metilo		-CF <sub>3</sub>	3.88 (3H, s), 7.63 (1H, s), 7.85 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.95 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.1 Hz), 9.08 (1H, s)
4.011	Metilo	CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-	H	δ 7.87 - 8.10 (m, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.02 (dd, J=7.5, 4.8 Hz, 1H), 6.30 (tt, J=54.8, 3.8 Hz, 1H), 4.50 (td, J=15.0, 3.2 Hz, 2H), 3.53 (s, 3H)
4.012	Metilo	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OC(O)-O-	-CF <sub>3</sub>	
4.013	Metilo	CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> O-	-CF <sub>3</sub>	
4.014	Metilo	Cl	-CF <sub>3</sub>	3.90 (3H, s), 7.75 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.79 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=7.0 Hz)
4.015	Metilo	-CN	-CF <sub>3</sub>	3.71 (1H, s), 7.46 - 7.53 (1H, m), 8.10 - 8.16 (1H, m), 8.19 (1H, s)
4.016	Metilo		-CF <sub>3</sub>	3.54 - 3.63 (4H, m), 3.76 - 3.83 (4H, m), 3.89 (3H, s), 7.89 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.10 (1H, d, J=8.1 Hz)
4.017	Metilo	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHN(CH <sub>3</sub> ) -SO <sub>2</sub> -	-CF <sub>3</sub>	1.23 (6H, d, J=6.4 Hz), 2.99 (3H, s), 3.88 (3H, s), 4.20 (1H, dt, J=13.4, 6.7 Hz), 7.89 (1H, s), 7.91 (1H, d, J=2.7 Hz), 8.06 (1H, d, J=7.5 Hz)
4.018	Metilo	-S(O) <sub>2</sub> Et	-CN	

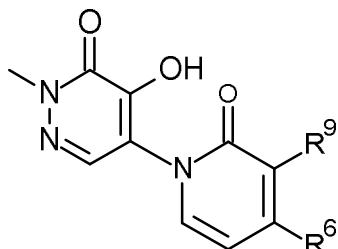
Cmp.	R <sup>1</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>b</sup>	RMN
4.019	Metilo	-S(O) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-CF <sub>3</sub>	

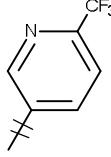
**TABLA C5** – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>b</sup>	R <sup>13a</sup>	R <sup>13b</sup>	RMN
5.001	Etílo	-CF <sub>3</sub>	H	H	9.3 (1H, m), 8.4 (1H, s), 8.3 (1H, d), 7.7 (1H, s), 7.6 (1H, d), 4.4 (2H, c), 1.5 (3H, t)
5.002	Metilo	-CF <sub>3</sub>	Metilo	Metilo	2.72 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 7.39 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

**TABLA C6** – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>b</sup>	R'	RMN
6.001	Metilo	Metilo	-fenilo	2.48 (3H, s), 3.84 (3H, s), 7.39 - 7.45 (1H, m), 7.47 - 7.53 (2H, m), 7.57 - 7.62 (2H, m), 7.63 (1H, s), 8.25 (1H, s)
6.002	Metilo	Metilo		2.49 (3H, s), 3.85 (3H, s), 7.32 - 7.37 (1H, m), 7.55 (1H, s), 7.63 (1H, dd, J=5.4, 1.6 Hz), 8.03 - 8.08 (1H, m), 8.22 (1H, s)
6.003	Metilo	Metilo	n-butilo	0.97 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.41 (2H, dd, J=15.0, 7.5 Hz), 1.77 - 1.87 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.83 (3H, s), 4.19 - 4.26 (2H, m), 7.47 (1H, s), 8.08 (1H, s)

**TABLA C7** – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

Compuesto	R <sup>b</sup>	R <sup>g</sup>	RMN
7.001		4-CF <sub>3</sub> -fenil-	δ 9.51 (s, 1H), 7.83 - 7.91 (m, 3H), 7.79 (d, J=7.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J=7.0 Hz, 1H), 7.68 (d, J=7.5 Hz, 2H), 6.46 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H)
7.002	-CF <sub>3</sub>	3-NH <sub>2</sub> -fenil-	
7.003	-CF <sub>3</sub>	3-MeO-fenil-	7.83 (1H, s), 7.73 (1H, d), 7.41-7.37 (1H, m), 7.12-7.10 (1H, m), 7.05-7.03 (1H, m), 7.01-6.97 (1H, m), 6.70 (1H, d), 3.79 (3H, s), 3.77 (3H, s)
7.004	-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> C(O)NH-fenil-	
7.005	-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> O-fenil-	7.88 (1H, s), 7.79 (1H, d), 7.55-7.51 (1H, m), 7.35-7.29 (2H, m), 7.23 (1H, m), 6.75 (1H, d), 3.79 (3H, s)
7.006	-CF <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -fenil-	7.85 (1H, s), 7.72 (1H, dd), 7.24 (2H, d), 7.15 (2H, d), 6.71 (1H, d), 3.78 (3H, s), 2.38 (3H, s)
7.007	-CF <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> ,5F-fenilo	7.86 (1H, s), 7.81 (1H, dd), 7.27 (1H, dd), 7.05 (1H, td), 6.89 (1H, dd), 6.76 (1H, d), 3.79 (3H, s), 2.10 (3H, s)
7.008	-CF <sub>3</sub>	3-MeS(O) <sub>2</sub> -NH-	
7.009	-CF <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -fenilo	8.31 (2H, d), 7.87 (1H, s), 7.83 (1H, dd), 7.57 (2H, d), 6.78 (1H, d), 3.79 (3H, s)
7.010	-CF <sub>3</sub>		3.85 (3H, s), 6.65 (1H, d), 7.4-7.8 (4H, m), 7.85 (1H, s)
7.011	-CF <sub>3</sub>	3-vinilfenil-	3.8 (3H, s), 5.25 (1H, d), 5.75 (1H, d), 6.6 (1H, d), 6.7 (1H, dd), 7.2-7.7 (5H, m), 7.8 (1H, s)
7.012	-CF <sub>3</sub>	3-F-fenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.0-7.7 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.013	-CF <sub>3</sub>	3-HC(O)-fenil-	
7.014	-CF <sub>3</sub>	3-iPr-fenil-	1.3 (6H, d), 2.9 (1H, m), 3.85 (3H, s), 6.7 (1H, d), 7.1-7.4 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.015	-CF <sub>3</sub>	2-MeO, 5-iPr-fenil-	1.2 (6H, d), 2.9 (1H, m), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 6.9-7.45 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.016	-CF <sub>3</sub>	3-EtO-fenil-	1.4 (3H, t), 3.85 (3H, s), 4.05 (2H, c), 6.6 (1H, d), 6.8-7.7 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.017	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-trifluorofenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 6.9-7.7 (3H, m), 7.9 (1H, s)
7.018	-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -fenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.4-7.7 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.019	-CF <sub>3</sub>	3-CN-fenil-	3.8 (3H, s), 6.7 (1H, d), 7.5-7.7 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.020	-CF <sub>3</sub>	3-MeS-fenil-	2.5 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.1-7.7 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.021	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-trimetoxifenil-	3.89 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.84 (6H, s), 6.5 (2H, s), 6.6 (1H, d), 7.4 (1H, d), 7.9 (1H, s)
7.022	-CF <sub>3</sub>	3,5-diclorofenil-	3.8 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.2-7.5 (4H, m), 7.9 (1H, s)

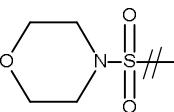
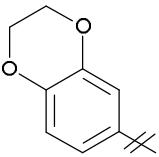
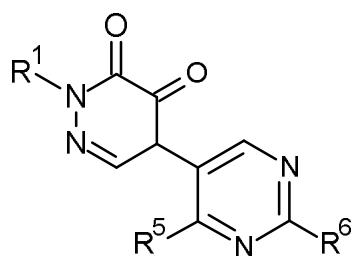
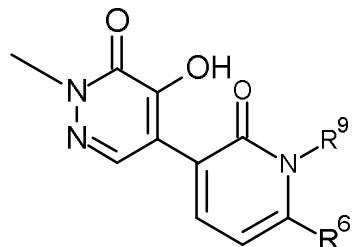
Compuesto	R <sup>b</sup>	R <sup>g</sup>	RMN
7.023	-CF <sub>3</sub>	3-MeS(O) <sub>2</sub> -fenil-	3.1 (3H, s), 3.8 (3H, s), 6.65 (1H, d), 7.5-8.0 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.024	-CF <sub>3</sub>	3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> N-fenil-	3.15 (6H, s), 3.85 (3H, s), 6.7 (1H, d), 7.2-7.55 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.025	-CF <sub>3</sub>	3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> NS(O) <sub>2</sub> -fenil-	
7.026	-CF <sub>3</sub>	3-CN,4-Cl-fenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.2-7.5 (4H, m), 7.85 (1H, s)
7.027	-CF <sub>3</sub>	3-NO <sub>2</sub> , 4Me-fenil-	2.65 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.4-7.7 (3H, m), 7.9 (1H, s), 8.0 (1H, s)
7.028	-CF <sub>3</sub>		
7.029	-CF <sub>3</sub>	2,3-diclorofenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.15-7.55 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.030	-CF <sub>3</sub>	2-Me,3-Cl-fenil-	2.2 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 6.95-7.7 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.031	-CF <sub>3</sub>	4-CN-fenil-	3.85 (3H, s), 6.65 (1H, d), 7.45-7.75 (5H, m), 7.85 (1H, s)
7.032	-CF <sub>3</sub>	2-Cl,5-Me-fenil-	2.35 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.05 -7.5 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.033	-CF <sub>3</sub>	4-MeO-fenil-	3.84 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 6.9 - 7.4 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.034	-CF <sub>3</sub>	2-vinilfenil-	3.85 (3H, s), 5.3 (1H, d), 5.8 (1H, d), 6.6 (1H, d), 6.75 (1H, dd), 7.1 - 7.7 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.035	-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -fenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.4-7.7 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.036	-CF <sub>3</sub>	4-MeS-fenil-	2.5 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.2-7.7 (5H, m), 7.9 (1H, s)
7.037	-CF <sub>3</sub>	4-CH(O)-fenil-	
7.038	-CF <sub>3</sub>	2-Me,4-Cl-fenil-	2.15 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.05 -7.5 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.039	-CF <sub>3</sub>	2,4-diclorofenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.15-7.55 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.040	-CF <sub>3</sub>		
7.041	-CF <sub>3</sub>	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> fenil-	3.85 (3H, s), 6.6 (1H, d), 7.15-7.5 (4H, m), 7.9 (1H, s)
7.042	-CF <sub>3</sub>	2-Me,4-CN-fenil-	2.2 (3H, s), 3.85 (3H, s), 6.65 (1H, d), 7.2-7.6 (4H, m), 7.9 (1H, s)

TABLA C8 – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.

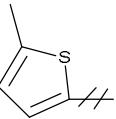
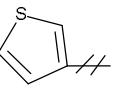
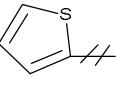


Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>b</sup>	RMN
8.001	Metilo		-CF <sub>3</sub>	δ 2.96 - 3.10 (2H, m), 3.22 - 3.33 (2H, m), 3.45 - 3.54 (2H, m), 3.63 - 3.76 (10H, m), 3.79 (3H, s), 7.52 (1H, s), 8.19 (1H, s)

TABLA C9 – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.



Compuesto	R <sup>b</sup>	R <sup>3</sup>	RMN
9.001	-CF <sub>3</sub>		δ 8.26 (t, J=8.1 Hz, 1H), 8.08 (d, J=8.6 Hz, 1H), 8.00 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.90 (dd, J=7.0, 2.1 Hz, 1H), 7.77 (dd, J=7.0, 2.1 Hz, 1H), 6.51 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.63 (s, 3H)
9.002	H	CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub> -	δ 7.93 (s, 1H), 7.88 (dd, J=7.0, 1.6 Hz, 1H), 7.74 (dd, J=6.4, 1.6 Hz, 1H), 6.56 (t, J=7.0 Hz, 1H), 5.97 - 6.08 (m, 1H), 5.17 - 5.30 (m, 2H), 4.71 (dt, J=5.4, 1.6 Hz, 2H), 3.77 (s, 3H)
9.003	H	Metilo	δ 7.91 - 7.94 (m, 1H), 7.88 (dd, J=7.0, 2.1 Hz, 1H), 7.80 (dd, J=6.4, 2.1 Hz, 1H), 6.54 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.66 (s, 3H)
9.004	H	4-MeO-bencil-	δ 7.91 (s, 1H), 7.80 - 7.88 (m, 2H), 7.28 - 7.35 (m, 2H), 6.87 - 6.92 (m, 2H), 6.54 (t, J=7.0 Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.76 (d, J=1.1 Hz, 6H)
9.005	H	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -	δ 7.91 (s, 1H), 7.89 (dd, J=7.5, 1.6 Hz, 2H), 7.70 - 7.75 (m, 1H), 6.54 (t, J=7.0 Hz, 1H), 4.89 (c, J=8.6 Hz, 2H), 3.77 (s, 3H)
9.006	H	cPr-CH <sub>2</sub> -	δ 7.93 (s, 1H), 7.89 (dd, J=7.5, 1.6 Hz, 1H), 7.85 (dd, J=6.4, 2.1 Hz, 1H), 6.57 (t, J=7.0 Hz, 1H), 3.95 (d, J=7.5 Hz, 2H), 3.77 (s, 3H), 1.29 - 1.40 (m, 1H), 0.56 - 0.63 (m, 2H), 0.42 - 0.49 (m, 2H)

Compuesto	R <sup>b</sup>	R <sup>g</sup>	RMN
9.007	H	CH <sub>3</sub> C(=CH <sub>2</sub> )-CH <sub>2</sub> -	δ 7.96 (s a, 1H), 7.90 (dd, J=7.5, 1.6 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=7.0, 1.6 Hz, 1H), 6.58 (t, J=7.0 Hz, 1H), 4.96 (s, 1H), 4.67 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 1.77 (s, 3H)
9.008	H	Bencil-	δ 7.92 (s, 1H), 7.81 - 7.90 (m, 2H), 7.31 (m, J=4.3 Hz, 5H), 6.55 (t, J=7.0 Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.76 (s, 3H)
9.009	H	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	δ 7.94 (s a, 1H), 7.89 (dd, J=7.0, 2.1 Hz, 1H), 7.75 (dd, J=6.4, 2.1 Hz, 1H), 6.54 (t, J=7.0 Hz, 1H), 4.28 (t, J=4.8 Hz, 1H), 3.78 (s, 1H), 3.71 (t, J=5.4 Hz, 2H), 3.34 (s, 2H)
9.010	-CF <sub>3</sub>	Me	δ 7.93 (s, 1H), 7.88 (d, J=7.0 Hz, 1H), 7.00 (d, J=7.5 Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.69 (s, 3H)
9.011	-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> -	δ 8.12 (s, 1H), 7.85 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.84 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.93 (m, J=10.9, 10.9, 5.6 Hz, 1H), 5.18 - 5.33 (m, 2H), 4.78 (d, J=4.8 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H)
9.012	H		2.48 (3H, s), 3.83 (3H, s), 6.47 (1H, t ap), 6.68 (1H, m), 6.94 (1H, d), 7.68 (1H, d), 7.87 (1H, d), 8.09 (1H, s)
9.013	H		3.82 (3H, s), 6.51 (1H, t ap), 7.25 (1H, d), 7.44-7.51 (2H, m), 7.62 (1H, d), 7.91 (1H, d), 8.08 (1H, s)
9.014	H		3.82 (3H, s), 6.52 (1H, t ap), 7.03 (1H, m), 7.18 (1H, m), 7.28 (1H, m), 7.72 (1H, d), 7.86 (1H, d), 8.08 (1H, s)
9.015	H	3-Cl,4-F-fenil-	3.82 (3H, s), 6.50 (1H, t ap), 7.02 (1H, m), 7.33 (1H, m), 7.42 (1H, d), 7.53 (1H, d), 7.89 (1H, d), 8.03 (1H, s)
9.016	H	4-MeO-fenil-	
9.017	H	4-Me-fenilo	3.81 (3H, s), 6.53 (1H, t ap), 7.31-7.59 (6H, m), 7.89 (1H, d), 8.08 (1H, s)
9.018	H	Fenil-	2.53 (3H, s), 3.82 (3H, s), 6.51 (1H, t ap), 7.11 (2H, m), 7.21 (1H, m), 7.51 (1H, d), 7.89 (1H, m), 8.08 (1H, s)
9.019	H	3-F,4-Me-fenil-	2.41 (3H, s), 3.78 (3H, s), 6.52 (1H, t ap), 7.20 (1H, d), 7.33-3.41 (2H, m), 7.50 (1H, d), 7.89 (1H, d), 8.05 (1H, s)

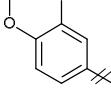
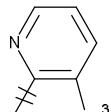
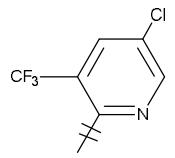
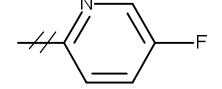
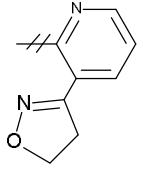
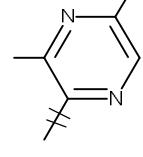
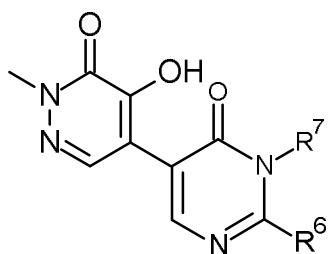
Compuesto	R <sup>b</sup>	R <sup>g</sup>	RMN
9.020	H	2-Cl,4-Me-fenil-	3.79 (3H, s), 6.53 (1H, t ap), 7.47 (1H, d), 7.62 (2H, d), 7.84 (2H, d), 7.91 (1H, d), 8.06 (1H, s)
9.021	H	3-CN-fenil-	
9.022	H		
9.023	H		3.80 (3H, s), 6.52 (1H, t ap), 7.38 (1H, d), 7.64 (1H, m), 7.94 (1H, d), 8.11 (1H, s), 8.21 (1H, d), 8.89 (1H, s)
9.024	H		3.81 (3H, s), 6.50 (1H, t ap), 7.34 (1H, d), 7.98 (1H, d), 8.09 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.79 (1H, s)
9.025	H		3.82 (3H, s), 6.51 (1H, t ap), 7.57 (1H, dd), 7.85 (1H, d), 7.92-8.00 (2H, m), 8.09 (1H, s), 8.41 (1H, s)
9.026	H		
9.027	H		

TABLA C10 – Ejemplos de compuestos herbicidas de la presente invención.



Compuesto	R <sup>b</sup>	R'	RMN
10.001	H	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3.85 (3H, s), 4.64 (2H, d, J=5.9 Hz), 5.30 - 5.42 (2H, m), 5.94 - 6.06 (1H, m), 8.13 (1H, s), 8.14 - 8.23 (1H, m), 8.35 - 8.43 (1H, m)

Compuesto	R <sup>b</sup>	R'	RMN
10.002	3-Cl-fenil-	nPr	0.83 (3H, t, J=7.5 Hz), 1.70 (2H, dd, J=15.6, 7.5 Hz), 3.86 (3H, s), 3.93 - 4.00 (2H, m), 7.39 - 7.57 (4H, m), 8.17 (1H, s), 8.41 (1H, s)
10.003	3-F-fenil-	c-hexil-	0.95 - 1.09 (2H, m), 1.14 - 1.29 (1H, m), 1.57 (1H, d, J=14.0 Hz), 1.72 (2H, d, J=11.8 Hz), 1.81 (2H, d, J=12.9 Hz), 2.71 (2H, td, J=12.8, 9.4 Hz), 3.85 (3H, s), 3.90 - 4.00 (1H, m), 7.20 - 7.26 (1H, m), 7.27 - 7.30 (1H, m), 7.52 (1H, td, J=7.9, 5.6 Hz), 8.12 (1H, s), 8.32 (1H, s)
10.004	3-F-fenil-	2-Me,5-Cl-fenil-	2.14 (3H, s), 3.86 (3H, s), 7.03 - 7.14 (4H, m), 7.16 - 7.33 (3H, m), 8.24 (1H, s), 8.63 (1H, s)
10.005	c-propilo	n-butilo	1.01 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.14 - 1.22 (2H, m), 1.30 - 1.35 (2H, m), 1.49 (2H, dc, J=15.0, 7.4 Hz), 1.74 - 1.85 (2H, m), 2.01 (1H, ddd, J=12.5, 7.9, 4.8 Hz), 3.83 (3H, s), 4.26 - 4.33 (2H, m), 8.07 (1H, s), 8.21 (1H, s)

Ejemplos biológicos

Se siembran semillas de una variedad de las especies de ensayo en tierra estándar en macetas (*Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Setaria faberii* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Ipomoea hederacea* (IPOHE)). Tras cultivarlas durante un día (preemergencia) o tras cultivarlas durante 8 días (posemergencia) en condiciones controladas en un invernadero de cristal (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad), las plantas se pulverizan con una solución acuosa en aerosol derivada de la formulación del principio activo técnico en una solución de acetonaagua (50:50) que contiene un 0.5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxietilenado, N.<sup>o</sup> de reg. CAS 9005-64-5). Los compuestos se aplican con una tasa de 1000 g/h. Posteriormente, las plantas de ensayo se cultivan en un invernadero de cristal en condiciones controladas (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65% de humedad) y se riegan dos veces al día. El ensayo se evalúa 13 días después para la pre- y posemergencia con el fin de determinar el porcentaje de daños provocados por el herbicida en la planta. Las actividades biológicas se muestran en la siguiente tabla en una escala de cinco puntos (5 = daños de un 80-100%; 4 = daños de un 60-79%; 3 = daños de un 40-59%; 2 = daños de un 20-39%; 1 = daños de un 0-19%).

**TABLA B1**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
1.001	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.002	5	3	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.003	5	5	5	2	5	5	4	5	1	1	5	3
1.004	5	5	4	1	5	4	1	1	1	1	3	1
1.005	5	5	5	4	5	5	3	5	5	1	5	1
1.006	5	5	1	1	1	5	3	5	1	2	2	3
1.007	5	5	4	4	5	4	2	3	4	1	4	2
1.008	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	3
1.009	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	-
1.010	4	2	1	1	1	4	1	1	1	1	1	1
1.011	4	4	2	2	2	2	1	1	1	1	1	1
1.012	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4
1.013	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
1.014	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2

# ES 2 571 449 T3

Cmp.	POSaplicación							PREaplicación						
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE		
1.015	4	2	1	1	2	4	-	-	1	1	1	1	1	
1.016	3	5	3	2	2	2	1	1	1	1	1	1	1	
1.018	5	5	5	4	5	5	5	5	4	2	5	5		
1.021	5	5	1	1	5	5	1	5	1	2	5	2		
1.022	3	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	
1.023	2	3	4	2	1	1	1	5	4	2	1	1		
1.024	5	5	3	1	2	4	1	5	1	1	2	4		
1.025	4	2	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1		
1.026	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		
1.027	5	5	5	1	5	5	4	5	3	1	5	1		
1.028	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		
1.029	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		
1.030	5	5	2	1	4	3	4	5	1	1	2	1		
1.031	5	5	5	2	5	5	2	5	4	1	5	1		
1.032	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4		
1.033	5	5	1	2	2	5	5	5	1	1	2	1		
1.034	5	5	5	4	5	5	5	5	5	2	5	3		
1.035	5	5	1	2	5	5	3	5	1	1	5	4		
1.036	5	5	5	5	5	5	1	3	2	3	2	1		
1.037	5	5	4	4	4	4	5	5	4	4	5	1		
1.038	5	5	5	4	4	4	5	5	3	3	5	1		
1.039	5	5	5	4	5	5	4	5	3	2	5	5		
1.040	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4		
1.041	5	5	5	4	5	5	2	4	2	3	4	1		
1.042	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	1		
1.043	5	5	4	2	4	4	1	1	1	1	1	1		
1.044	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	1		
1.045	4	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1		
1.046	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	1		
1.047	4	3	1	1	1	3	1	1	1	1	1	1		
1.049	5	5	5	5	5	5	5	5	3	2	5	1		
1.050	5	5	4	2	5	5	3	5	2	1	5	1		
1.051	5	5	2	1	2	4	1	5	1	2	4	1		
1.052	5	5	5	4	5	5	5	5	4	4	5	1		
1.053	5	5	4	5	5	5	5	5	4	5	5	2		
1.054	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	3		
1.055	5	5	1	1	4	4	4	5	1	1	2	2		
1.056	5	5	5	5	5	5	4	5	1	5	5	1		
1.057	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2		
1.058	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		

# ES 2 571 449 T3

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
1.059	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.061	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
1.062	4	5	4	2	5	5	1	-	1	1	1	1
1.063	2	3	1	1	1	3	1	1	1	1	1	1
1.064	5	5	1	1	1	4	1	1	1	1	1	1
1.065	4	5	5	1	5	4	1	5	2	1	3	-
1.066	3	1	1	2	1	2	4	4	1	3	2	5
1.067	5	5	4	2	5	5	3	4	1	1	5	2
1.068	5	5	3	3	5	5	4	4	2	2	5	3
1.069	4	5	1	2	5	4	2	2	2	1	5	4
1.070	4	3	4	1	4	1	1	1	1	1	1	1
1.071	5	5	4	3	5	5	5	5	4	4	5	2
1.072	5	5	5	4	5	5	5	5	5	4	5	5
1.073	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	2
1.074	5	5	5	2	5	5	1	5	1	2	4	1
1.075	5	5	2	3	5	5	5	5	1	1	5	2
1.076	4	5	1	2	2	4	2	5	1	1	1	1
1.077	2	4	1	1	1	2	3	3	1	1	1	1
1.078	5	5	5	1	5	4	5	5	5	2	5	2
1.081	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2
1.082	4	2	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.084	4	4	2	1	3	4	1	1	1	1	1	1
1.086	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.088	5	5	1	1	5	1	1	5	1	1	1	1
1.089	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.090	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.091	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.092	2	1	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.093	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.094	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.095	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.096	1	1	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.098	3	2	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.099	2	3	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.100	2	2	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
1.101	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.103	2	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
1.105	5	5	1	2	5	5	4	5	2	2	5	1
1.106	4	5	2	2	4	2	1	4	1	1	1	1
1.108	3	3	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1

# ES 2 571 449 T3

Cmp.	POSaplicación							PREaplicación						
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE		
1.109	4	5	1	1	2	4	2	5	1	1	1	1		
1.110	5	5	1	1	3	5	1	5	1	1	1	1		
1.111	3	2	1	1	1	1			1	1	1	1		2
1.112	4	5	1	1	1	4	1	1	1	1	1	1		
1.113	5	5	3	2	2	5	4	5	1	1	1	1		2
1.114	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1		
1.115	5	2	1	1	1	4	4	4	1	1	1	2		
1.116	5	4	2	1	2	4	3	5	2	2	1	1		
1.118	3	4	1	1	2	2	1	1	1	1	1	1		
1.119	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		
1.120	5	5	5	5	5	5	4	5	4	3	5	4		
1.125	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	1		
1.126	4	5	2	1	2	3	1		1	1	1	1		
1.128	4	1	2	1	1	3	1	1	1	1	1	1		
1.129	3	3	2	1	2	2	1	1	1	1	1	1		
1.131	5	5	4	4	5	5	4	3	1	1	1	1		
1.133	2	1	1	1	3	2	1	1	1	1	1	1		
1.134	5	5	2	1	2	5	5	5	1	1	1	2		
1.135	5	5	5	4	5	5	5	5	5	4	5	5		
1.137	5	5	5	1	5	5	3	2	1	1	1	1		
1.138	5	5	5	1	4	1	1	1	1	1	1	1		
1.139	5	5	5	5	5	5		5	1	5	5	4		
1.140	5	5	3	5	5	5	5	5	1	5	5	2		
1.141	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5		
1.143	4	1	1	2	2	1	1	3	1	2	1	1		
1.144	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4		
1.145	5	5	5	3	5	5	2	5	2	1	4	1		
1.146	5	5	5	5	5	5	5	5	2	4	5	4		
1.147	3	1	1	1	1	1	1	2	2	1	1	1		
1.148	3	2	4	1	2	3	1	1	1	1	1	2		
1.149	4	4	1	2	1	1	1	1	1	1	1	1		
1.150	4	1	1	1	1	1	1	2	1	1	1	2		
1.151	5	5	5	5	5	5	4	5	2	2	5	5		
1.152	1	1	1	1	1	2	2	2	5	4	2	1		
1.153	4	2	1	1	1	2	2	2	1	1	2	3		
1.154	5	5	5	4	5	5	2	5	2	2	5	5		
1.157	5	5	5	3	5	5	3	5	3	2	5	3		
1.158	5	5	5	5	5	5	4	5	3	3	5	3		
1.159	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	1		
1.160	5	5	4	3	5	5	4	5	1	1	5	2		

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
1.161	4	5	4	3	4	2	1	3	1	1	1	1
1.163	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
1.164	5	5	5	1	5	5	2	3	2	1	4	4
1.165	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1

\* aplicado con una tasa de 250 g/ha

**TABLA B2**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
2.001	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.002	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.003	5	5	4	3	5	4	1	5	4	3	4	1
2.004	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	4
2.005	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.006	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.007	5	5	5	2	5	5	4	5	1	1	5	3
2.008	5	5	5	3	5	5	5	5	2	4	5	3
2.010	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.011	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.012	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.014	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.015	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.016	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.017	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.019	5	5	4	5	4	5	5	5	2	4	5	4
2.020	5	5	4	4	4	5	5	5	1	4	5	1
2.021	5	5	2	1	5	5	1	5	1	1	1	1
2.022	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
2.023	5	5	5	5	5	5	5	5	1	5	5	4
2.024	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5	4
2.025	5	5	1	2	4	4	5	5	1	1	1	5
2.026	5	4	3	3	4	2	4	5	1	1	2	1
2.027	5	5	4	4	5	5	3	5	1	2	5	3
2.028	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4
2.029	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	1
2.030	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
2.031	5	5	5	4	5	5	5	5	5	4	5	3
2.032	5	5	4	3	5	5	5	5	2	2	5	3
2.033	5	5	3	5	5	5	5	5	2	4	4	1
2.035	5	5	5	4	5	5	5	5	2	3	3	3
2.036	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

# ES 2 571 449 T3

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
2.037	5	5	4	3	5	5	5	5	2	3	5	4
2.038	5	5	5	4	5	4	5	5	4	5	5	4
2.039	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.040	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	3
2.041	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.043	5	5	4	3	5	5	5	5	1	3	5	2
2.047	5	5	3	3	5	4	4	2	1	1	5	1
2.049	5	5	1	1	5	5	5	5	2	1	5	4
2.050	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.051	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	4
2.052	5	5	5	5	5	5	5	5	3	4	5	4
2.053	5	5	2	3	3	5	5	5	2	3	5	1
2.054	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
2.055	5	5	5	3	5	3	2	4	1	2	2	1
2.056	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3

**TABLA B3**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
3.001	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3.002	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3.003	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3.004	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3.005	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
3.006	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4

**TABLA B4**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
4.001	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4.003	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4.004	5	5	2	1	3	5	3	5	1	1	3	
4.005	3	5	1	1	1	2	1	5	1	1	1	1
4.006	4	3	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
4.008	5	5	2	1	2	4	1	5	1	1	1	1
4.009	5	4	1	1	1	1	1	3	1	1	1	1
4.010	5	5	4	3	5	5	5	5	1	1	5	5
4.011	5	4	1	1	1	3	1	1	1	1	1	1
4.014	5	5	2	1	3	5	4	5	1	1	5	2
4.015	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
4.016	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4.017	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5

**TABLA B5**

# ES 2 571 449 T3

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
5.001	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
5.002	5	5	2	1	3	5	1	5	1	1	2	3

**TABLA B6**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
6.001	5	5	3	3	5	1	1	1	1	1	1	1
6.002	3	4	1	1	1	2	5	5	1	1	1	2
6.003	4	4	2	2	4	2	1	1	1	1	1	1

**TABLA B7**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
7.001	4	3	3	2	4	2	1	1	1	1	1	1
7.003	5	5	3	4	5	3	5	5	4	4	4	3
7.005	5	5	4	4	5	4	5	5	4	4	5	1
7.006	5	4	3	3	5	3	5	5	4	3	5	2
7.007	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
7.009	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
7.010	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
7.011	5	5	3	1	5	3	5	5	2	2	1	2
7.012	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	1
7.014	5	5	4	1	5	3	5	5	4	3	3	1
7.015	5	5	3	2	4	3	5	5	4	3	3	4
7.016	5	5	2	2	2	1	5	5	2	2	2	1
7.017	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
7.018	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	2
7.019	5	5	5	5	5	2	5	5	5	5	5	2
7.021	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	4
7.022	5	5	5	4	5	2	5	5	5	5	5	2
7.023	5	5	4	1	4	1	5	5	4	2	2	2
7.027	5	5	5	3	5	2	5	5	3	3	5	1
7.029	5	5	2	3	5	4	5	5	1	2	2	1
7.030	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4
7.031	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
7.032	5	5	5	3	5	5	5	5	5	4	5	5
7.033	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	4
7.034	5	5	3	1	3	2	5	5	1	2	1	1
7.035	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	3
7.036	5	5	3	2	4	4	5	5	2	2	1	4
7.038	5	5	3	5	5	5	5	5	3	5	5	4

**TABLA B8**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
8.001	5	5	2	1	5	5	5	5	2	1	5	3

**TABLA B9**

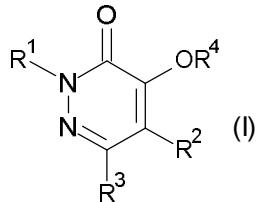
Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
9.001	4	3	4	4	4	1	1	2	1	3	2	1
9.002	5	4	2	1	2	2	1	1	1	1	1	1
9.003	4	4	2	1	1	2	1	2	1	1	1	1
9.004	4	4	1	1	1	3	1	1	1	1	1	1
9.005	4	2	1	1	1	2	1	1	1	1	1	1
9.006	3	3	2	2	1	2	1	1	1	1	1	1
9.007	4	3	2	1	1	2	1	1	1	1	1	1
9.008	3	3	1	1	1	1	2	2	1	1	4	1
9.009	5	4	3	2	3	3	1	1	1	1	1	1
9.010	5	5	2	2	4	4	1	5	1	1	5	1
9.011	5	5	5	4	5	4	1	4	3	2	5	1
9.016	5	5	3	3	4	2	1	1	1	2	1	1
9.017	4	3	2	2	5	2	1	1	1	2	1	2

**TABLA B10**

Cmp.	POSaplicación						PREaplicación					
	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE	SOLNI	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	IPOHE
10.002	5	5	1	1	2	4	1	4	1	1	1	1
10.003	5	5	4	1	5	4	1	5	1	1	1	1
10.004	5	5	3	1	4	4	1	2	1	1	1	1
10.005	5	5	5	2	5	4	5	5	1	1	2	1

## **REIVINDICACIONES**

## 1. Un compuesto de Fórmula (I):

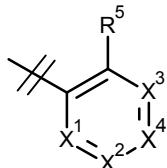


o una de sus sales agronómicamente aceptables,

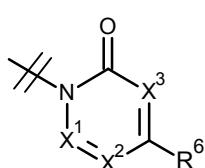
**donde:-**

$R^1$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, tetrahidropiranyl- y bencil-, donde el bencilo está opcionalmente sustituido con uno o más R<sup>11</sup>;

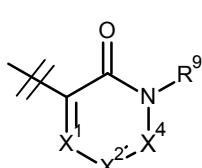
$R^2$  se selecciona del grupo constituido por A1, A2 y A3



(A1)



(A2)



(A3)

donde

$X^1$  es  $N \circ CR^7$ ;

$X^2$  es N o CR<sup>8;</sup>

$X^3$  es No CR<sup>9</sup>.

$X^4$  es N o CR<sup>6.</sup>

$R^3$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halo, nitrógeno, amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>);

$R^4$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonil-, arilcarbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonil-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>carbonil- y aril-S(O)<sub>p</sub>-, donde dichos grupos arilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R<sub>11</sub>:

<sup>5</sup> se selecciona del grupo constituido por hidroxilo, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, aril-S(O)<sub>p</sub>-, heterociclico, heterociclico-S(O)<sub>p</sub>-, arilloxi-, aril-(alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, aril-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterociclico-, heterociclico-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, hidroxicarbonilo, hidroxicarbonilo-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(aminoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, ciano y nitrógeno, donde dichos heterociclos son heterociclos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno independientemente seleccionado del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitrógeno;

$R^6$  y  $R^9$  se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alquenilonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, aril-S(O)<sub>p</sub>-, heterociclico, heterociclico-S(O)<sub>p</sub>-, ariloxi-, aril-(alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, aril-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterocicloxi-, heterociclico-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, hidroxicarbonilo, hidroxicarbonilo-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(aminoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, ciano y nitro, donde dichos heterociclicos son heterociclos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno independientemente seleccionado del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitro;

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquenil C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquinil C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)- y (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-;

y donde R<sup>5</sup> y R<sup>9</sup> pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos de nitrógeno y/u oxígeno, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos R<sup>12</sup>, o

$R^6$  y  $R^9$  pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos seleccionados del grupo constituido por nitrógeno, oxígeno y  $S(O)_2$ , estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos  $R^{12}$ , o

$R^6$  y  $R^8$  pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos de nitrógeno, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos  $R^{13}$ , y

$R^{11}$  se selecciona del grupo constituido por halo-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

R<sup>12</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, halo-, oxi-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

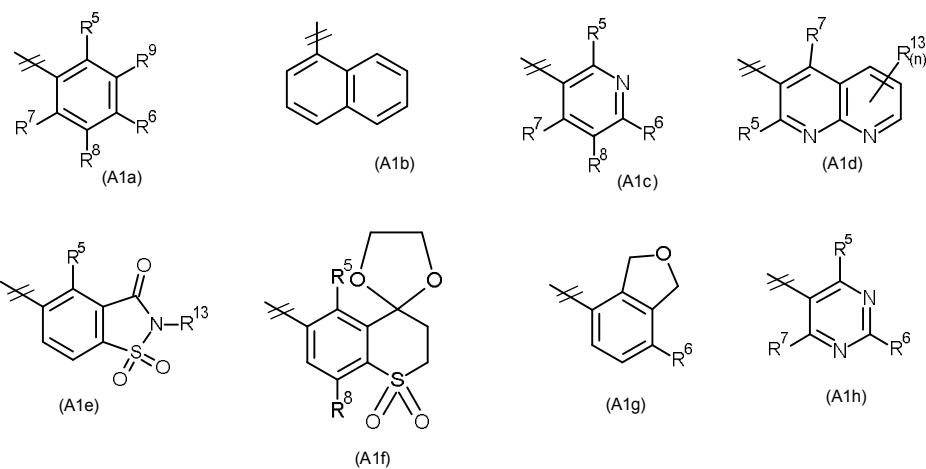
$R^{13}$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, halo-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, morfolinil- y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; y

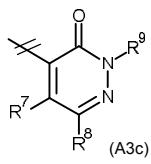
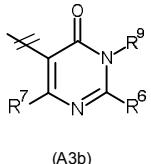
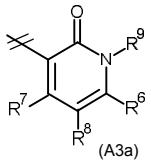
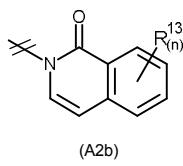
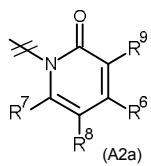
$p = 0, 1 \text{ o } 2;$

y donde el compuesto de Fórmula (I) no es ácido 2-(1-bencil-5-hidroxi-6-oxo-1,6-dihidropiridazin-4-il) benzoico.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>3</sup> y/o R<sup>4</sup> es hidrógeno.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde R<sup>2</sup> se selecciona del grupo constituido por A1a, A1b, A1c, A1d, A1e, A1f, A1g, A1h, A2a, A2b, A3a A3b y A3c;





donde R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> y R<sup>13</sup> son como se han definido previamente y n es 0, 1, 2 o 3.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde R<sup>2</sup> es A1a.

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde R<sup>5</sup> se selecciona del grupo constituido por hidroxilo, halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, ariloxi, heterociclico-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-(dialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), ciano y nitro.

6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, donde R<sup>5</sup> se selecciona del grupo constituido por cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, 2-fluoroethyl-, metoxietoximetil-, trifluorometoximetil-, metil-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, isoxazolinilo, morfolinilo, metil-S(O)<sub>p</sub>-dimetilamino-, ciano y nitro, donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por cloro, metilo o trifluorometilo.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde R<sup>6</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>.

8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, halógeno y (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-.

9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde R<sup>9</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>.

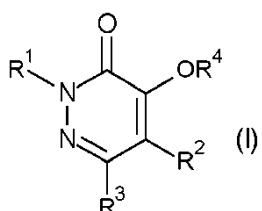
10. Una composición herbicida que comprende un compuesto herbicida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores y un adyuvante de formulación aceptable en agricultura.

11. Una composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 10, que comprende además al menos un pesticida adicional.

12. Una composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 11, donde el pesticida adicional es un herbicida o un protector contra herbicidas.

13. Un método para controlar malezas en un emplazamiento que comprende aplicar al emplazamiento una cantidad que controla malezas de una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 10-12.

14. El uso de un compuesto de Fórmula (I):

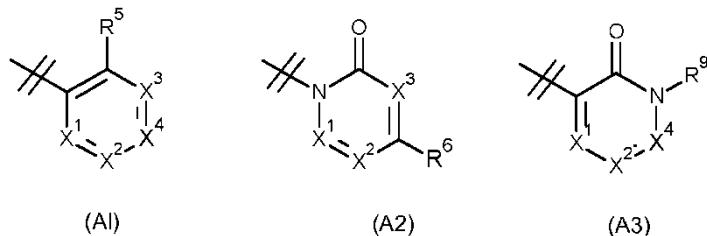


o una de sus sales agronómicamente aceptables,

donde:-

$R^1$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, tetrahidropiranil- y bencil-, donde el bencilio está sustituido opcionalmente con uno o más R<sup>11</sup>.

$R^2$  se selecciona del grupo constituido por A1, A2 y A3



donde

$x^1$  es No CR<sup>7;</sup>

$X^2$  es No CR<sup>8.</sup>

$x^3$  es No CR<sup>9</sup>;

$X^4$  es No CR<sup>6</sup>;

$R^3$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, halo, nitro, amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>);

$R^4$  se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonil-, arilcarbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonil-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>carbonil- y aril-S(O)<sub>p</sub>-, donde dichos grupos arilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^{11}$ .

<sup>5</sup> se selecciona del grupo constituido por hidroxilo, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alqueniloxilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, aril-S(O)<sub>p</sub>-, heterociclico, heterociclico-S(O)<sub>p</sub>-, ariloxi-, aril-(alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, aril-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterociclico-, heterociclico-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, hidroxicarbonilo, hidroxicarbonilo-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(aminoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, ciano y nitro, donde dichos heterociclos son heterociclos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno independientemente seleccionado del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitro;

$R^6$  y  $R^9$  se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, (alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, arilo, aril-S(O)<sub>p</sub>-, heterociclico, heterociclij-S(O)<sub>p</sub>-, ariloxi-, aril-(alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-, aril-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-, heterociclioxi-, heterociclij-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, hidroxicarbonilo, hidroxicarbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-, (dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilamino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-amino-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-(aminoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, ciano y nitro, donde dichos heterociclos son heterociclos de cinco o seis miembros que contienen de uno a tres heteroátomos, cada uno independientemente seleccionado del grupo constituido por oxígeno, nitrógeno y azufre, y donde los componentes arilo o heterociclico pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, fenilo, ciano y nitro;

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> se seleccionan independientemente del grupo constituido por hidrógeno, halógeno, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquenil C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-, (alquinil C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)- y (haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-;

y donde R<sup>5</sup> y R<sup>9</sup> pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos de nitrógeno y/u oxígeno, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos R<sup>12</sup>; o

R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos seleccionados del grupo constituido por nitrógeno, oxígeno y S(O)<sub>2</sub>, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos R<sup>12</sup>; o

R<sup>6</sup> y R<sup>8</sup> pueden formar juntos un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado, comprendiendo dicho anillo heterocíclico uno o más heteroátomos de nitrógeno, estando el anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más grupos R<sup>13</sup>; y

R<sup>11</sup> se selecciona del grupo constituido por halo-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>12</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, halo-, oxi-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

R<sup>13</sup> se selecciona del grupo constituido por hidrógeno, ciano, halo-, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-S(O)<sub>p</sub>-, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>, morfolinil- y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; y

p = 0, 1 o 2 como un herbicida.